



SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 930240

(51) Kv.1k.5 - Int.cl.5

A 61K 47/48, 39/395, C 07D 519/04, C 07H 15/252
C 07K 15/28

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 21.01.93

(24) Alkuperä - Löpnummer 21.01.93

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 24.07.93

(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet

23.01.92 US 824951 P

(71) Hakija - Sökande

1. Bristol-Myers Squibb Company, 345 Park Avenue, New York, N.Y. 10154, USA, (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Willner, David, 9 Raelin Road, Hamden, Conn. 06514, USA, (US)
2. Trail, Pamela A., 49 Walnut Farms Road, Farmington, Conn. 07032, USA, (US)
3. King, H. Dalton, 114 Wakefield Street, Hamden, Conn. 06517, USA, (US)
4. Hofstead, Sandra J., 3-18 Forest Glen Circle, Middletown, Conn. 06457, USA, (US)
5. Greenfield, Robert S., 10 Seiter Hill Road, Wallingford, Conn. 06492, USA, (US)
6. Braslawsky, Gary R., 124 Heritage Drive, Glastonbury, Conn. 06033, USA, (US)

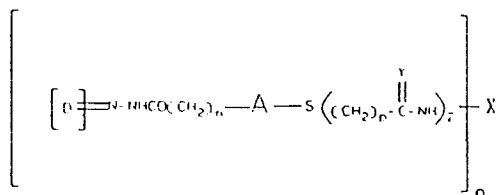
(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Tioetterikonjugaatteja
Tioeterkonjugat

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksinnön kohteena on menetelmä lääke/li-gandiyhdisteiden valmistamiseksi, joilla on kaava (I):



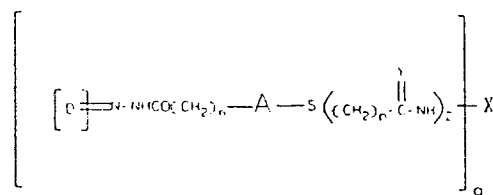
(I)

jossa D on lääkeosa; n on kokonaisluku 1 - 10; p on kokonaisluku 1 - 6; Y on O tai NH₂Cl⁻; z on 0 tai 1; q on n. 1 - n. 10; X on ligandi; ja A on Michael additioad-dukti. Keksintö koskee myös näiden yhdis-teiden valmistuksessa käyttökelpoisia vä-lituotteita, joilla on kaava (IIa)



jossa R on Michael-additioreseptori.

Uppfinningen avser ett förfarande för framställning av medicin/ligand -förening-ar med formeln (I):



(I)

där D är en medicindel; n är ett heltal från 1 till 10; p är ett heltal från 1 till 6; Y är O eller NH₂Cl⁻; z är 0 el-ler 1; q är ca 1 - ca 10; X är en ligand; och A är ett Michael additionsaddukt. Upp-finningen avser även mellanprodukter med formeln (IIa), vilka är användbara vid framställningen av dessa föreningar.