

[A] TIIVISTELMÄ - SAMMANDRAG



(11) (21) Patentihakemus - Patentansökan 964985

(51) Kv.lk.6 - Int.kl.6

A 61K 47/48

S U O M I - F I N L A N D
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 12.12.96

(24) Alkupäivä - Löpdag 14.06.95

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 16.12.96

(86) Kv. hakemus - Int. ansökan PCT/US95/07555

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

14.06.94 US 259413 P

(71) Hakija - Sökande

1. Shearwater Polymers Inc., 2307 Spring Branch Road, Huntsville, AL 35801, USA, (US)
2. Amgen Boulder Inc., 3200 Walnut Street, Boulder, CO 80301, USA, (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Kohno, Tadahiko, 1557 Hays Court, Louisville, CO 80027, USA, (US)
2. Kachinsky, Dave, 4658 Chatham Street, Boulder, CO 80301, USA, (US)
3. Harris, Milton, 3119 Highland Plaza, Huntsville, AL 35801, USA, (US)

(74) Asiamies - Ombud: Kolster Oy Ab, Iso Roobertinkatu 23, 00120 Helsinki

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Pegylointireagensseja ja niillä muodostettuja yhdisteitä
Pegylatingsreagenser och med dessa framställda föreningar

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Biologisesti aktiivisia konjugaatteja, jotka muodostetaan biologisesti aktiivisen molekylin tiolirakenneosan reaktiolla sellaisen ei-peptidipolymeerin kanssa, jossa on aktiivinen sulfonirakenneosa, esitetään. Myös esitetään yhdisteitä, joilla on kaava R_1-X-R_2 , jossa ainakin toinen R_1 :stä ja R_2 :sta on biologisesti aktiivinen molekyili, jossa on reaktiivinen tiolirakenneosa, joka muodostaa kovalenttisen sidoksen X:n, Michaelin akseptorilla aktivoidun ei-peptidipolymeerin kanssa. Lisäksi esitetään menetelmiä näiden konjugaattien tekemiseksi ja tämän keksinnön mukaisia yhdisteitä sekä niitä sisältäviä farmaseuttisia koostumuksia. Lisäksi esitetään aktivoituja polymeerejä, jotka ovat sopivia liittäviksi joukkoon eri molekyylejä ja pintoja.

Uppfinningen avser biologiskt aktiva konjugat, som framställas genom att låta tioldelen av en biologiskt aktiv molekyl reagera med en icke-peptidpolymer, som innehåller en aktiv sulfondel. Uppfinningen avser även föreningar med formeln R_1-X-R_2 , vari åtminstone den ena av grupperna R_1 och R_2 är en biologiskt aktiv molekyl, som innehåller en reaktiv tioldel, som bildar en kovalent bindning med X, som är en med en Michael-acceptor aktiverad icke-peptidpolymer. Uppfinningen avser dessutom förfaranden för framställning av dessa konjugat och föreningar enligt föregående uppfinning samt farmaceutiska kompositioner innehållande dem. Uppfinningen avser dessutom aktiverade polymerer lämpliga för bindning vid olika slags molekyler och ytor.