



SUOMI-FINLAND
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

[A] TIIVISTELMÄ - SAMMANDRAG

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan	921562
(51) Kv.1k.5 - Int.c1.5	
C 07F 9/38, 9/564	
(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag	08.04.92
(24) Alkuperäpäivä - Löpdag	11.10.90
(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig	08.04.92
(86) Kv. hakemus - Int. ansökan	PCT/EP90/01710
(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet	
12.10.89 IT 22004/89 P	

(71) Hakija - Sökande

1. Boehringer Mannheim Italia S.p.A., Via S. Uguzzone, 5, 20126 Milano, Italia, (IT)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Tognella, Sergio, Via S. Uguzzone, 5, 20126 Milano, Italia, (IT)
2. Livi, Valeria, Via S. Uguzzone, 5, 20126 Milano, Italia, (IT)
3. Menta, Ernesto, Via S. Uguzzone, 5, 20126 Milano, Italia, (IT)
4. Spinelli, Silvano, Via S. Uguzzone, 5, 20126 Milano, Italia, (IT)

(74) Asiamies - Ombud: Forssén & Salomaa Oy

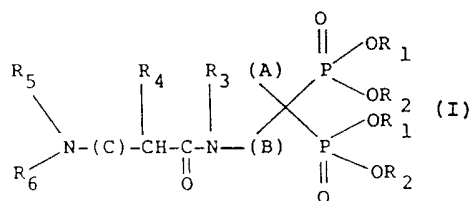
(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Gem-difosfonihapot, menetelmä niiden valmistamiseksi ja farmaseuttisetkoostumukset, jotka sisältävät niitä

Gem-difosfonsyror, förfarande för framställning av dessa och faumaceutiska sammansättningar som innehåller dem

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

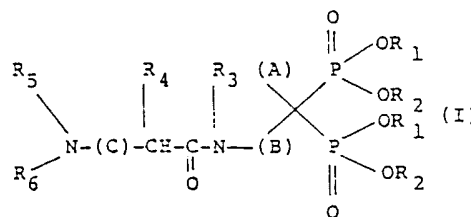
Kaavan (I) mukaiset difosfonihapot,



jossa R_1 ja R_2 ovat vetyjä tai C_1 - C_4 -alkyyli; (A) on vety, halogeeni, hydroksi tai C_1 - C_{12} -alkyyli; (B) on sidos, C_1 - C_8 -alkyleeniketju, sykloalkyyli-, kyleeniketju, alkyleeniketju, joka substituoitu sykloheksyyli- tai syklopentyyli-ryhmillä tai aralkyyli- ketju, joka sisältää heteroatomin (O,S tai $N-CH_3$) tai ureidojäännöksen

$-(CH_2)_{n1}-NHCONH-(CH_2)_{n2}$, jossa n on 1-5, R_3 on vety, C_1 - C_9 -alkyyli, C_3 - C_6 -sykloalkyyli, bentsyyli, fenyylit tai p-metoksibentsyyli; (C) on C_1 - C_5 -alkyyli, fenyylit tai aralkyyli- ketju; R_4 on vety, C_1 - C_4 -alkyyli tai aminoryhmä, joka on valinnaisesti substituoitu alkyyli-, fenyylit-, bentsyyli-, p-metoksibentsyyli-, asyyli-, aminohappo- tai peptidiryhmillä; R_5 ja R_6 ovat 2-haloetyyli tai yhdessä muodostavat 1-atsiridinyyli- jäänne, ovat käytökelnoisia kasvaimenvastaisena aineena.

Difosfonsyror med formeln (I),



där R_1 och R_2 är väte eller C_1 - C_4 -alkyl; (A) är väte, halogen, hydroxi eller C_1 - C_{12} -alkyl; (B) är en bindning, en C_1 - C_8 -alkylenkedja, en cykloalkyl-, lalkylenkedja, en alkylenkedja, som är substituerad med cyklohexyl- eller cyklopentylgrupper eller en aralkylkedja, som innehåller en heteroatom (O,S tai $N-CH_3$) eller en ureidorest

$-(CH_2)_{n1}-NHCONH-(CH_2)_{n2}$, där n är 1-5, R_3 är väte, C_1 - C_9 -alkyl, C_3 - C_6 -cykloalkyl, benzyl, fenyli eller p-metoxibenzyl; (C) är C_1 - C_5 -alkyl, fenyli eller en aralkylkedja; R_4 är väte, C_1 - C_4 -alkyl eller en aminogrupp, som är valbart substituerad med alkyl-, fenyli-, benzyl-, p-metoxibenzyl-, acyl-, aminosyra- eller peptidgrupper; R_5 och R_6 är 2-haloetyl eller tillsammans bildar de en 1-aziridinyrest, är användbara som tumormoverkande