



SUOMI—FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

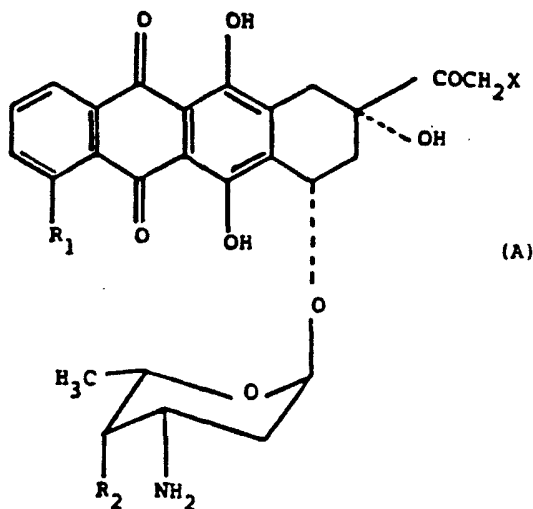
PATENTTIHAKEMUS—PATENTANSÖKAN
[A] TIIVISTELMÄ—SAMMANDRAG

(11) (21) Patenttihakemus-Patentansökan 843110
(51) Kv.lk.³/Int.Cl.³ C 07 H 15/252
(22) Hakemispäivä-Ansökningsdag 08.08.84
(23) Alkupäivä-Löpdag
(41) Tullut julkiseksi-Blivit offentlig 12.02.85
(86) Kv. hakemus-Int. ansökan
(30) Etuoikeus-Prioritet 11.08.83 GB 8321676

- (71) Hakija/Sökande: Farmitalia Carlo Erba S.p.A., Via Carlo Imbonati, 24, Milano, Italia
- (72) Keksijät/Uppfinnare: 1. Suarato, Antonino 2. Penco, Sergio 3. Giuliani, Fernando 4. Arcamone, Federico
- (74) Asiamies/Ombud: Heinänen
- (54) Keksinnön nimitys/Uppfinningens benämning: 4'-halogeeniantrasykliiniglykosidi. 4'-halogenantracyklinglykosid.

(57) TIIVISTELMÄ

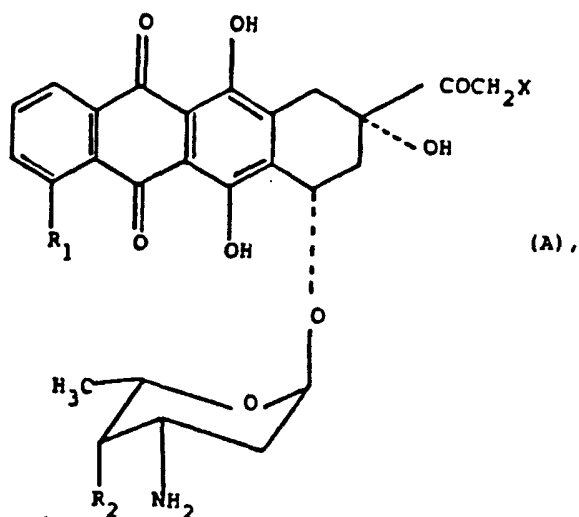
Yleisen kaavan (A) mukaiset yhdisteet ja niiden hap-
poadditiosuolat



(X = H tai OH, R₁ = H, OH tai OCH₃ ja R₂ = Br, Cl tai F) ovat käyttökelpoisia kasvainlääkkeinä. Näistä ne, joissa X = H, voidaan valmistaa 4'-epi-4'-O-trifluorimetaanisulfonyyli-N-suojattu-daunorubisiinin (tai vastaavan 4-demetyyli- tai 4-demetoksijohdannaisen) ja (C₄H₉)₄NCl:n, (C₄H₉)₄NBr:n tai CsF:n välisellä korvausreaktiolla. Näistä ne, joissa X = OH, voidaan valmistaa vastaavista yhdisteistä, joissa X = H, suorittamalla bromaus ja reaktio natriumformiaatin vesiliuoksen kanssa. Myös farmaseuttisia seoksia on selostettu.

(57) SAMMANDRAG

Föreningar med den generella formeln (A) och deras syraadditionssalter



(X = H eller OH, R₁ = H, OH eller OCH₃ och R₂ = Br, Cl eller F) kan användas som antitumörmedel. De, i vilka X = H, kan framställas genom utbytesreaktion mellan en 4'-epi-4'-O-trifluormetansulfonyl-N-skyddad-daunorubicin (eller en motsvarande 4-demetyl- eller 4-demetoxiderivat) och (C₄H₉)₄NCl, (C₄H₉)₄NBr eller CsF. De, i vilka X = OH, framställs från motsvarande föreningar, vari X = H, genom bromering och reaktion med natriumformiats vattenlösning. Farmaceutiska kompositioner beskrivs också.