



SUOMI—FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

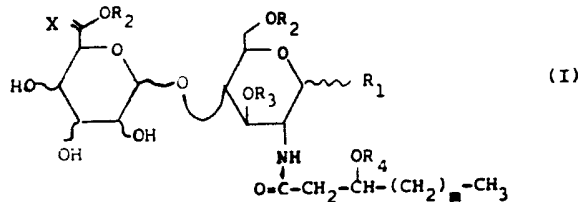
PATENTTIHAKEMUS—PATENTANSÖKAN
[A] TIIVISTELMÄ—SAMMANDRAG

(11) (21) Patenttihakemus-Patentansökan 860747
(51) Kv.lk./Int.Cl.⁴ C 07 H 5/06, 13/04, 15/04
(22) Hakemispäivä-Ansökningsdag 20.02.86
(23) Alkupäivä-Löpdag
(41) Tullut julkiseksi-Blivit offentlig 23.08.86
(86) Kv. hakemus-Int. ansökan
(30) Etuoikeus-Prioritet 22.02.85 NL 85.00499

- (71) Hakija/Sökande: Akzo N.V., Velperweg 76, Arnhem, Alankomaat
(72) Keksijät/Uppfinnare: 1. Van Boeckel, Constant Adriaan Anton 2. Beetz, Tom
(74) Asiamies/Ombud: Kolster
(54) Keksinnön nimitys/Uppfinningens benämning: Uusia "Lipid A"-tyyppisiä disakkaridi- ja trisakkaridijohdannaisia. Nya "Lipid A"-typ disackarid- och trisackaridderivat.

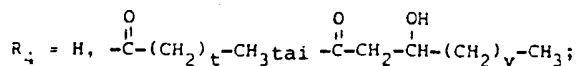
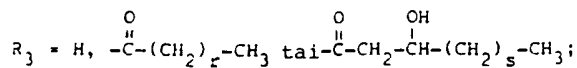
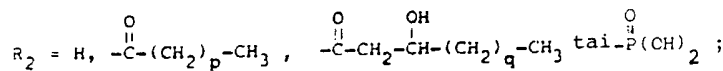
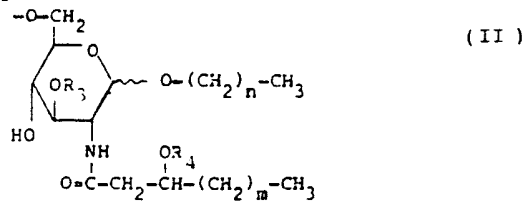
(57) Tiivistelmä

Keksintö koskee uusia lipidi A -tyyppisiä disakkaridi- ja trisakkaridi -johdannaisia, joiden yleiskaava I on



jossa

$R_1 = \text{OH}$, ryhmä $\text{O}-(\text{CH}_2)_n-\text{CH}_3$ tai β -1,6-sidoksinen glukosiamiini -johdannainen, jonka kaava II on



m, q, s ja c ovat kukin itsenäisesti 6-14, n, p, r ja t ovat kukin itsenäisesti 0-16 ja X merkitsee kahta vetyatomia tai - kun $R_2 = \text{H}$ - myös happea.

Kaavan (I) mukaisilla yhdisteillä on immunomoduloivia, erikoisesti immunostimuloivia ominaisuuksia.

Keksintö koskee myös kaavan (I) mukaisten yhdisteiden valmistusta sekä farmaseuttisia valmisteita, jotka sisältävät kaavan (I) mukaista yhdistettä.

Jatkuu seur. sivulla
Forts. nästa sida

(57) Sammandrag

Uppfinningen avser nya disackarid- och trisackarid-derivat av lipid A-typ med den allmänna formeln (I), vari R = OH, gruppen $-(CH_2)_n-CH_3$ eller ett β -1,6-bundet glukosaminderivat med formeln (II)

R_2 är H, $-\overset{\overset{O}{\parallel}}{C}-(CH_2)_p-CH_3$, $-\overset{\overset{O}{\parallel}}{C}-CH_2-\overset{\overset{OH}{|}}{CH}-(CH_2)_q-CH_3$ eller $-\overset{\overset{O}{\parallel}}{P}(OH)_2$;

R_3 är H, $-\overset{\overset{O}{\parallel}}{C}-(CH_2)_r-CH_3$ eller $-\overset{\overset{O}{\parallel}}{C}-CH_2-\overset{\overset{OH}{|}}{CH}-(CH_2)_s-CH_3$;

R_4 är H, $-\overset{\overset{O}{\parallel}}{C}-(CH_2)_t-CH_3$ eller $-\overset{\overset{O}{\parallel}}{C}-CH_2-\overset{\overset{OH}{|}}{CH}-(CH_2)_v-CH_3$;

m, q, s och v är var och en självständigt 6-14

n, p, r och t är var och en självständigt 0-16, och

X betecknar två väteatomer eller - då R_2 är H - även syre, samt farmaceutiskt godtagbara salt därav.

Föreningarna med formeln (I) har immunomodulerande, speciellt immunostimulerande egenskaper.

Uppfinningen avser även framställning av föreningarna med formeln (I) samt farmaceutiska kompositioner, vilka innehåller en förening med formeln (I).

