



SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus  
Patent- och registerstyrelsen

[A] TIIVISTELMÄ - SAMMANDRAG

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 915719  
(51) Kv.1k.5 - Int.cl.5  
C 07J 9/00  
(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 04.12.91  
(24) Alkuperäpäivä - Löpdag 04.12.91  
(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 07.06.92  
(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet  
06.12.90 DE 4038833 P

(71) Hakija - Sökande

1. Hoechst Aktiengesellschaft, 6230 Frankfurt/Main 80, BRD, (DE)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Kramer, Werner, Henry-Moisand-Strasse 19, 6500 Mainz, BRD, (DE)  
2. Wess, Günther, Langenselbolder Weg 35, 6455 Erlensee, BRD, (DE)  
3. Müllner, Stefan, Friedrich-Ebert-Strasse 43, 6203 Hochheim, BRD, (DE)  
4. Neubauer, Horst, Am Eichkopf 12, 6240 Königstein/Taunus, BRD, (DE)

(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Sappihappojohdannaiset, menetelmä niiden valmistamiseksi ja tämän yhdisteen käyttö  
lääkeaineina  
Gallsyraderivat, förfarande för deras framställning och användning av denna förening som  
läkemedel

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksintö koskee yleisen kaavan I mukaisten  
sappihappojohdannaisten valmistusta,

G1 - X - G2

(I)

jossa

G1 ja G2 merkitsevät sappihapporyhmiä tai modifioituja sappihapporyhmiä, jotka ovat vapaina happoina, estereinä tai amideina, suolamuodossa sekä alkoholiryhmistä johdettuina muotoina ja X on siltaryhmä tai yksinkertainen kovalenttinen sidos, jolloin G1 ja G2 voivat olla mielivaltaisesti X:n kautta liittyneitä.

Keksinnön mukaisilla yhdisteillä on todettu korkea affiniteetti ohutsuolen spesifiseen sappihappojen kuljetussysteemiin ja ne estävät sappihappojen imeytymistä koncentraatiosta riippuvaisella ja kompetitiivisella tavalla.

Uppfinningen avser framställningen av gallsyraderivat med den allmänna formeln I

G1 - X - G2

(I)

vari

G1 och G2 betecknar gallsyrarester respektive modifierade gallsyrarester i form av de fria syror, estrarna eller amiderna, saltformerna och i alkoholgruppen derivatiserade former, och X betecknar en bryggbildning eller en kovalent enkelbindning, varvid G1 och G2, ifall önskvärt, kan vara förbundna via X.

Föreningarna enligt uppfinningen har hög affinitet gentemot det specifika gallsyra-transportsystemet i tunntarmen och de hämmar gallsyresorptionen på koncentrationsavhängigt och kompetitivt sätt.