

[A] TIIVISTELMÄ – SAMMANDRAG



SUOMI-FINLAND
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus – Patentansökan	944217
(51) Kv.1k.5 – Int.c1.5	
C 07D 401/12, 401/14, 211/60	
(22) Hakemispäivä – Ansökningsdag	13.09.94
(24) Alkupäivä – Löpdag	12.03.93
(41) Tullut julkiseksi – Blivit offentlig	13.09.94
(86) Kv. hakemus – Int. ansökan	PCT/CA93/00096
(32) (33) (31) Etuoikeus – Prioritet	
13.03.92 US 850716 P	

(71) Hakija – Sökande

1. Bio-Mega/Boehringer Ingelheim Research, Inc., 2100 Cunard, Laval, Quebec H7S 2G5, Canada, (CA)

(72) Keksijä – Uppfinnare

1. Anderson, Paul Cates, 4130 Edward Higgins, Pierrefonds, Quebec H8Y 3M8, Canada, (CA)
2. Soucy, Francois, 545 Laurier, Lachenaie, Quebec J6W 5N4, Canada, (CA)
3. Yoakim, Christiane, 63 Gianchetti, Laval, Quebec H7G 4T5, Canada, (CA)
4. Lavallee, Pierre, 366 du Cheminot, Rosemere, Quebec J7A 4B2, Canada, (CA)
5. Beaulieu, Pierre Louis, 4741 St-Andre, Montreal, Quebec H2J 2Z9, Canada, (CA)

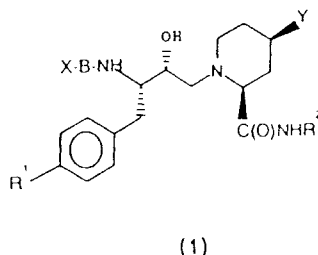
(74) Asiamies – Ombud: Leitzinger Oy

(54) Keksinnön nimitys – Uppfinningens benämning

Substituoidut pipekoliinihappojohdannaiset HIV-proteaasin estäjinä
Substituerade pipekolinsyraderivat såsom HIV-proteashämmare

(57) Tiivistelmä – Sammandrag

Keksinnön kohteena on kaavan (1) mukaiset yhdisteet



jossa X on terminaalinen ryhmä, esimerkiksi aryylioksikarbonyyli, alkanoyyli tai mahdollisesti mono- tai disubstituoitu karbamoyyli; B puuttuu tai on aminohapotähde, esimerkiksi Val tai Asn; R¹ on vety tai rengassubstituentti, esimerkiksi fluori tai metyyli; R² on alkyyl; ja Y on rengassubstituentti, esimerkiksi fenoksi, 2-pyridinyylimetoksi, fenyyllitio tai 2-pyridinyyllitio. Yhdisteet estävät ihmisen immuunikatovirus (HIV)-proteaasin aktiivisuutta ja häiritsevät HIV:n aiheuttamia sytotoogeenisiä vaikutuksia ihmisoluissa. Nämä ominaisuudet tekevät yhdisteet käyttökelpoisiksi HIV-infektioiden torjuntaan.

Uppfinningen avser föreningar med formeln (1), där X är en terminal grupp, t.ex. aryloxikarbonyl, alkanoyl eller eventuellt mono- eller disubstituerad karbamoyl; B saknas eller är en aminosyragrupp, t.ex. Val eller Asn; R¹ är väte eller en ringsubstituent, t.ex. fluor eller metyl; R² är alkyl; och Y är en ringsubstituent, t.ex. fenoxi, 2-pyridinyllitio, fenyltio eller 2-pyridinyllitio. Föreningarna förhindrar mänskans AID-virus (HIV)-proteasaktivitet och stör av HIV förorsakade cytopatogena verkningarna i mänskoceller. Dessa egenskaper gör föreningarna användbara vid bekämpning av HIV-infektioner.