



[A] TIIVISTELMÄ - SAMMANDRAG

SUOMI-FINLAND
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 925875

(51) Kv.1k.5 - Int.cl.5

C 07F 9/6541

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 23.12.92

(24) Alkupäivä - Löpdag 23.12.92

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 28.06.93

(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet

27.12.91 US 814741 P

(71) Hakija - Sökande

1. Sterling Winthrop Inc., 90 Park Avenue, New York, N.Y. 10016, USA, (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Desai, Ranjit Chimanlal, 9 Rafaillo Drive, Latham, N.Y. 12110, USA, (US)

2. Court, John Joseph, 26 Elmhurst Avenue, Albany, N.Y. 12205, USA, (US)

3. Hlasta, Dennis John, 3 Maurice Lane, Clifton Park, N.Y. 12065, USA, (US)

4. Subramanyam, Chakrapani, 2102 Coventry Lane, East Greenbush, N.Y. 12061, USA, (US)

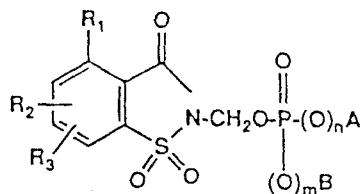
(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

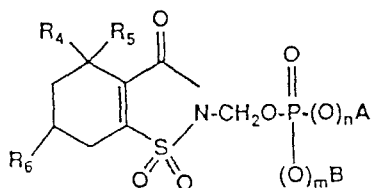
Menetelmä uusien proteolyyttisten entsyymien inhibiittoreina käyttökelpoisten 2-sakkarinyylimetyyli- ja 4,5,6,7-tetrahydro-2-sakkarinyylimetyylifosfaattien, -fosfonaattien ja -fosfinaattien valmistamiseksi
Förfarande för framställning av nya som inhibitorer av proteolytiska enzymer användbara 2-sakkarinylmetyl- och 4,5,6,7-tetrahydro-2-sakkarinylmetylfosfater, -fosfonater och -fosfinater

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

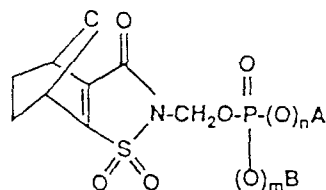
Keksintö koskee uusien I, II ja IIA mu-
kaisten 4-R₁-R₂-R₃-2-sakkarinyylimetyyli-,
4-R₄-4-R₅-6-R₆-4,5,6,7-tetrahydro-2-sakka-
rinyylimetyyli- ja 4,7-C-4,5,6,7-tetrahyd-
ro-2-sakkarinyylimetyylifosfaattien, -fos-
fonaattien, ja -fosfinaattien valmistamis-
ta,



I



II



IIA

joissa substituenttien merkitykset on esi-
tetty patenttivaatimuksissa. Nämä yhdis-
teet inhiboivat proteaasientsyymien aktii-
visuutta ja ne ovat käyttökelpoisia rap-
peuttavien tautien hoidossa.

Uppfinningen avser framställning av nya 4-
R₁-R₂-R₃-2-sakkarinylmetyl-, 4-R₄-4-R₅-6-R₆-
4,5,6,7-tetrahydro-2-sakkarinylmetyl- och
4,7-C-4,5,6,7-tetrahydro-2-sakkarinylme-
tylfosfater, -fosfonater, och fosfinater
enligt I, II och IIA, där betydelsen hos
substituenterna presenteras i patentkra-
ven. Dessa substanser inhiberar aktivite-
ten hos proteas-enzymet och de är använd-
bara inom vården av nedbrytande sjukdomar.