



SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan	942061
(51) Kv.1k.5 - Int.c1.5	
C 07K 5/04	
(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag	04.05.94
(24) Alkupäivä - Löpdag	29.10.92
(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig	04.05.94
(86) Kv. hakemus - Int. ansökan	PCT/EP92/02472
(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet	
04.11.91 GB 9123326 P	

(71) Hakija - Sökande

1. Sandoz Ltd., Lichtstrasse 35, 4002 Basel, Switzerland, (CH)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Heng, Richard, Landoltstrasse 63, 3006 Bern, Switzerland, (CH)
2. Payne, Trevor Glyn, Dalmazirain 26, 3005 Bern, Switzerland, (CH)
3. Revesz, Laszlo, ob dem Fichtenrain 7, 4106 Therwil, Switzerland, (CH)
4. Weidmann, Beat, Ulmenstrasse 12, 4123 Allschwil, Switzerland, (CH)

(74) Asiamies - Ombud: Papula Rein Lahtela Oy

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

IL-1 beta vapautumista estäviä peptidejä
Peptider som inhiberar frigöring av IL-1 beta

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksintö koskee di-, tri- ja tetrapeptidejä, joissa viimeinen α -aminohappo perustuu arparaglinihappoon ja on liittynyt lähteeseen A_3 , joka on H; CF_3 ; $-Z_1-Z_2-Y_2$, jossa sekä Z_1 että Z_2 tarkoittavat toisistaan riippumatta suoraa sidosta tai α -aminohappotähdettä ja Y_2 on NH_2 , C_{1-4} alkyyliamino, di- $(C_{1-4}$ alkyyli)-amino tai heterosyklinen radikaali, joka on liittynyt tyypestä Z_2 :een; $-CH_2-X_1-Y_3$, jossa X_1 on O tai S ja Y_3 on heteroaryyli; $-CH_2-Y_3$; substituoitu fenyyli; rengassubstituoitu fenoksimetyleni tai fenyyli-tiometyleni; rengassubstituoitu pyridyylioksimetyyleeni; tai radikaali $-CH_2-X_1-CO-Y_4$, jossa X_1 on O tai S ja Y_4 on trialkyylimetyyli tai substituoitu fenyyli tai pyridyyli, vapaassa muodossa tai suolan muodossa. Peptideillä on farmakologista aktiivisuutta, esim. IL-1 β vapautumista estäviä ominaisuuksia.

Uppfinningen avser di, tri, och tetrapeptider, i vilka den sista α -aminosyran baserar sig på asparaginsyra och är fäst vid en rest A_3 , vilken är H; CF_3 ; $-Z_1-Z_2-Y_2$, vari både Z_1 och Z_2 oberoende av varandra är en direkt bindning eller en α -aminosyrarest och Y_2 är NH_2 , C_{1-4} alkylamino, di- $(C_{1-4}$ alkyl)amino eller en heterocyklisk radikal, vilken via kväve är fäst till Z_2 ; $-CH_2-X_1-Y_3$, vari X_1 är O eller S och Y_3 är heteroaryl; $-CH_2-Y_3$; substituerad fenyl; ringsubstituerad fenoximetylen eller fenyltiometylen; ringsubstituerad pyridyloximetylen; eller en radikal $-CH_2-X_1-CO-Y_4$, vari X_1 är O eller S och Y_4 är trialkylmetyl eller substituerad fenyl eller pyridyl, i fri form eller i form av ett salt. Peptiderna har farmakologisk aktivitet, t.ex. IL-1 β frigörande förhindrande egenskaper.