



SUOMI-FINLAND
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patentihakemus - Patentansökan 892132
(51) Kv.1k.4 - Int.cl.4
C 07D 405/04, 473/00 // C 07H 19/04
(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 03.05.89
(24) Alkupäivä - Löpdag 03.05.89
(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 07.11.89
(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet
06.05.88 US 07/190809 07.04.89 US 333449

(71) Hakija - Sökande

1. Bristol-Myers Squibb Company, 345 Park Avenue, New York, NY 10154, USA, (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Starrett, John E., Jr., 23 Hawks Nest Circle, Middletown, Conn. 06457, USA, (US)
2. Mansuri, Muzamil M., 1320 Deer Run Road, Cheshire, Conn. 06410, USA, (US)
3. Martin, John C., 40 Brookside Place, Cheshire, Conn. 06410, USA, (US)

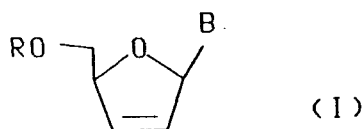
(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

2',3'-didehydro-2',3'-dideoksinukleosidien esilääkkeet
Proäläkemedel av 2',3'-didehydro-2',3'-dideoxynukloeosider

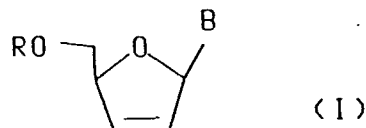
(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksintö koskee uusien kaavan (I) mukaisen 2',3'-didehydro-2',3'-dideoksinukleosidilääkeaineiden, esimerkiksi 2',3'-didehydro-2',3'-dideoksitymidiinin, esiasteiden valmistusta. Lääke-esiasteet ovat fysiologisissa olosuhteissa hydrolysoituvia, jolloin syntyy yhdisteitä, jotka ovat käyttökelpoisia antiviraalisina aineina, erityisesti immuunikatoviruksia (HIV) vastaan vaikuttavina aineina.



Kaavassa (I) R on H tai fysiologisissa olosuhteissa hydrolysoituva esteriryhmä ja B on tyyppiä sisältävä heterosyklinen ryhmä, joka on sitoutunut rengastyyppiätominsa kautta.

Uppfinningen avser framställningen av nya läkemedelsföregångare av 2',3'-didehydro-2',3'-dideoxinukleosider med formeln I, t.ex av 2',3'-didehydro-2',3'-dideoxitymidin. Läkemedelsföregångarna är hydrolyserbara under fysiologiska förhållanden för avgivande av föreningar, vilka är användbara som anti-virusmedel, speciellt som medel mot människans immunobristvirusar (HIV).



I formeln (I) betecknar R H eller en under fysiologiska förhållanden hydrolyserbar estergrupp och B är en kvävehaltig, heterocyklisk grupp, vilken är bunden vid stället för ringkväveatomen.