



SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(71) Hakija - Sökande

1. Chiron Corporation, 4560 Horton Street, Emeryville, CA 94608, USA, (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Rosenberg, Steve, 2323 Bywood Drive, Oakland, CA 94602, USA, (US)
2. Spear, Kerry L., 5832 Colton Boulevard, Oakland, CA 94611, USA, (US)
3. Martin, Eric J., 1601 Navellier Street, El Cerrito, CA 94530, USA, (US)

(74) Asiamies - Ombud: Ruska & Co Oy, Runeberginkatu 5, 00100 Helsinki

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

Urokinaasireseptorin ligandeja
Ligander för urokinasreceptorer

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Tämän keksinnön mukaiset yhdisteet inhiboivat urokinaasi-plasminogeenin aktivaattoria tai uPARia, ja niitä esittää yleiskaava (I), missä R_{10} on $-CH(R_9)XCH(R_i)(R_{11})$ tai suojaava ryhmä, missä X on NR_{12} , $CR_{12}R_{15}$, O, S, SR_{12} tai $SR_{12}R_{15}$, R_1 , R_9 , R_{11} , R_{12} , R_{15} ovat kukin erikseen H, alempi alkyyli, alempi alkenyyli, alempi alkynyli, aryyli, aralkyyli, aryylialkenyyli, aryylialkynyli, aryyli sykloalkyyli, substituoituja jollain seuraavista: 0-3-halo, OH, NH_2 , alempi alkyyli, halo-alempi alkyyli, alempi alkoksi, alempi alkyyliamino, alempi alkyyliitio, CN tai NO_2 , R_{16} on $-CH(R_3)C(=O)NH_2$, H, alempi alkyyli, sykloalkyyli tai alempi alkenyyli, R_2 on aryyli tai aralkyyli, joka substituoiaton tai substituoitu jollain seuraavista: 1-3-halo, OH, NH_2 , CN, NO_2 , alempi alkyyli, halo-alempi alkyyli, alempi alkoksi, alempi alkyyliamino, alempi alkyyliitio tai sykloalkyyli, R_3 ja R_5 ovat kumpikin erikseen H tai alempi alkyyli, R_4 on $-CH_2C(=O)NR_{13}R_{14}$, missä R_{13} on H, alempi alkyyli, fenyyli tai bentsyyli, ja R_{14} on H, aryyli tai aralkyyli, missä R_6 ja R_7 ovat kumpikin erikseen H, OH, NH_2 , CN, NO_2 , alempi alkyyli, halo-alempi alkyyli, alempi alkoksi, alempi alkyyliamino, alempi alkyyliitio tai sykloalkyyli, ja n ja m ovat kumpikin erikseen kokonaislukuja välillä 1 - 3, sekä näiden farmaseuttisesti hyväksyttävät happoaddukti suolat.

Uppfinningen avser föreningar vilka inhiberar urokinasplasminogenaktivator eller uPAR, och representeras av den allmänna formeln (I), vari R_{10} är $-CH(R_9)XCH(R_i)(R_{11})$ eller en skyddsgrupp vari X är NR_{12} , $CR_{12}R_{15}$, O, S, SR_{12} eller $SR_{12}R_{15}$, R_1 , R_9 , R_{11} , R_{12} , R_{15} är var för sig H, lägre alkyl, lägre alkenyl, lägre alkynyl, aryl, aralkyl, arylalkenyl, arylalkynyl, arylcykloalkyl, substituerade med någon av följande: 0-3-halo, OH, NH_2 , lägre alkyl, halo-lägre alkyl, lägre alkoxi, lägre alkylamino, lägre alkyltio, CN eller NO_2 ; R_{16} är $-CH(R_3)C(=O)NH_2$, H, lägre alkyl, cykloalkyl eller lägre alkenyl, R_2 är aryl eller aralkyl, antingen osubstituerad eller substituerad med någon av följande: 1-3-halo, OH, NH_2 , CN, NO_2 , lägre alkyl, halo-lägre alkyl, lägre alkoxi, lägre alkylamino, lägre alkyltio eller cykloalkyl, R_3 och R_5 är var för sig H eller lägre alkyl, R_4 är $-CH_2C(=O)NR_{13}R_{14}$, vari R_{13} är H, lägre alkyl, fenyl eller benzyl, och R_{14} är H, aryl eller aralkyl, vari R_6 och R_7 är var för sig H, OH, NH_2 , CN, NO_2 , lägre alkyl, halo-lägre alkyl, lägre alkoxi, lägre alkylamino, lägre alkyltio eller cykloalkyl, och n och m är var för sig heltal inom intervallet 1 - 3; samt farmaceutiskt acceptabla syraadditionssalter av dessa.

