

Title (en)
HIV PROTEASE INHIBITORS.

Title (de)
INHIBITOREN DER HIV-PROTEASE.

Title (fr)
INHIBITEURS DE PROTEASE DE L'HIV (VIRUS DE L'IMMUNODEFICIENCE HUMAINE).

Publication
EP 0594586 A1 19940504 (EN)

Application
EP 91903689 A 19910109

Priority
• US 9100178 W 19910109
• US 46266990 A 19900109
• US 46989190 A 19900123

Abstract (en)
[origin: WO9110442A1] Compounds of the formula A-(C)b-(D)c-M-(X)e-Y-Z wherein: A is BocNH, CbzNH, H, R'R''N, R''CONR', or if a, b and c are 0 and Y is a covalent bond, then A is H, Boc, Cbz, R' or R''CO; C and D are the same or different and are Ala, beta-Ala, D-Ala, Phe, Phg or Val; X is Ala, Ile, Leu, Val; Y is Ala, Ile, Leu, Val or is a covalent bond; Z is CO₂R''', CONR'R''', COR', CH₂OR''', CH₂OC(O)R'' or H, or if e is 0 and Y is a covalent bond, Z is OR'''' or NR'R''''; b, c and e are each independently 0 or 1, provided that c and e are not simultaneously 0; M is (alpha), wherein: R1 is independently, C1-5Alk, C3-5alkenyl or benzyl; R' and R'' are H or C1-5Alk; R''' is H, C1-5Alk, C3-6cycloalkyl, (CH₂)_nC₆H₅, (CH₂)_nC₅H₄N, (CH₂)_nOH, (CH₂)_nNH₂, or (CH₂)_nNHC(NH)NH₂; inhibit the HIV-1 protease and are useful in the treatment of AIDS.

Abstract (fr)
L'invention se rapporte à des composés représentés par la formule: (I); où: A représente BocNH, CbzNH, H, R'R''N, R''CONR', ou , lorsque a, b et c ont la valeur 0 et Y est une liaison covalente, alors A représente H, Boc, Cbz, R' ou R''CO; C et D sont identiques ou différents et représentent Ala, beta-Ala, D-Ala, Phe, Phg ou Val; X représente Ala, Ile, Leu, Val; Y représente Ala, Ile, Leu, Val ou une liaison covalente; Z représente Co₂OR''', CHONR'R'', COR', CH₂OR''', CH₂OC(O)R'' ou H, ou, lorsque e est égal à 0 et Y est une liaison covalente, alors Z représente OR'''' ou NR'R''''; b, c et e ont chacun séparément la valeur 0 ou 1 à condition que c et e n'aient pas simultanément la valeur 0; M représente (alpha); où: R1 représente séparément AlkC1-5, un alcényle C3-5 ou un benzyle, R' et R'' représentent H ou AlkC1-5; R''' représente H, AlkC1-5, un cycloalkyle C3-6, (CH₂)_nC₆H₅, (CH₂)_nC₅H₄N, (CH₂)_nOH, (CH₂)_nNH₂, ou (CH₂)_nNHC(NH)NH₂. Ces composés sont des inhibiteurs de la prothéase de l'HIV-1 et sont utiles dans le traitement du SIDA.

IPC 1-7
A61K 37/02; **C07K 5/06**; **C07K 5/08**; **C07K 5/10**

IPC 8 full level
A61K 31/16 (2006.01); **A61K 31/195** (2006.01); **A61K 31/22** (2006.01); **A61K 38/00** (2006.01); **A61P 31/12** (2006.01); **C07C 237/22** (2006.01); **C07C 271/22** (2006.01); **C07C 279/08** (2006.01); **C07C 279/12** (2006.01); **C07F 7/18** (2006.01); **C07K 5/02** (2006.01); **C07K 5/06** (2006.01); **C07K 7/02** (2006.01); **C07K 14/81** (2006.01)

CPC (source: EP)
A61P 31/12 (2017.12); **C07C 271/22** (2013.01); **C07F 7/1804** (2013.01); **C07K 5/021** (2013.01); **C07K 7/02** (2013.01); **A61K 38/00** (2013.01)

Designated contracting state (EPC)
AT BE CH DE DK ES FR GB IT LI LU NL SE

DOCDB simple family (publication)
WO 9110442 A1 19910725; EP 0594586 A1 19940504; EP 0594586 A4 19940817; JP H05503703 A 19930617

DOCDB simple family (application)
US 9100178 W 19910109; EP 91903689 A 19910109; JP 50387291 A 19910109