

Title (en)  
4-AMINO-3-HYDROXYCARBOXYLIC ACID DERIVATIVES.

Title (de)  
4-AMINO-3-HYDROXYCARBONSÄURE-DERIVATE.

Title (fr)  
DERIVES D'ACIDE 4-AMINO-3-HYDROXYCARBOXYLIQUE.

Publication  
**EP 0594656 A1 19940504 (EN)**

Application  
**EP 92913821 A 19920630**

Priority  
• EP 9201471 W 19920630  
• GB 9114261 A 19910702  
• GB 9123721 A 19911107  
• GB 9203884 A 19920224

Abstract (en)  
[origin: WO9301166A1] The invention concerns the compounds of formula (I) wherein A and B independently are a bond or optionally substituted aminoacyl; R1 is hydrogen; an amino protecting group; or a group of formula R6Y- wherein R6 is hydrogen or an optionally substituted alkyl, alkenyl, alkynyl, aryl, arylalkyl, heteroaryl, heteroarylalkyl, heterocyclyl or heterocyclalkyl group; and Y is -CO-; -NHCO-; NHCS-; -SO2-; -O-CO-; or -O-CS-; R2 is the side chain of a natural amino acid; an alkyl, arylalkyl, heteroarylalkyl or cycloalkylalkyl group; or trimethylsilylmethyl, 2-thienylmethyl or styrylmethyl; R3 is an optionally substituted alkyl, alkenyl, alkynyl, cyloalkyl, aryl, arylalkyl, heteroaryl or heteroarylalkyl group; R4 is a group of formula -OR7 or -NHR7 wherein R7 has the significance indicated above for R6; and X is -S- or -NR5- wherein R5 is hydrogen, methyl, formyl or acetyl; in free form and, where such forms exist, in salt form. They can be obtained by a process comprising epoxide ring opening, appropriate substitution and/or deprotection or saponification. They have antiviral activity, particularly HIV-1 proteinase inhibiting activity, and are thus indicated for use in the treatment of retroviral diseases.

Abstract (fr)  
Composés répondant à la formule (I), dans laquelle A et B représentent, indépendamment l'un de l'autre, une liaison ou aminoacyle éventuellement substitué; R1 représente hydrogène; un groupe protecteur amino; ou un groupe répondant à la formule R6Y- dans laquelle R6 représente hydrogène ou un groupe alkyle, alcényle, alcynyle, aryle, arylalkyle, hétéroaryle, hétéroarylalkyle, hétérocyclyle ou hétérocyclalkyle éventuellement substitué; et Y représente -CO-; -NHCO-; -NHCS-; -SO2-; -O-CO-; ou -O-CS-; R2 représente la chaîne latérale d'un acide aminé naturel; un groupe alkyle, arylalkyle, hétéroarylalkyle ou cycloalkylalkyle; ou triméthylsilylméthyle, 2-thiénylméthyle ou styrylméthyle; R3 représente un groupe alkyle, alcényle, alcynyle, cycloalkyle, aryle, arylalkyle, hétéroaryle ou hétéroarylalkyle éventuellement substitué; R4 représente un groupe répondant à la formule -OR7 ou -NHR7 dans laquelle R7 a la même notation que R6; et X représente -S- ou -NR5- où R5 représente hydrogène, méthyle, formyle ou acétyle; sous forme libre et, lorsque de telles formes existent, sous forme de sel. On peut les obtenir à l'aide d'un procédé comportant l'ouverture du cycle époxyde, une substitution appropriée et/ou la déprotection ou la saponification. Ils présentent une activité antivirale, notamment une activité d'inhibition de la protéinase du VIH-1, et sont de ce fait indiqués pour l'utilisation lors du traitement des maladies rétrovirales.

IPC 1-7  
**C07C 271/22; A61K 31/325; C07K 5/02; C07C 237/22; A61K 37/02**

IPC 8 full level  
**A61K 31/195** (2006.01); **A61K 31/40** (2006.01); **A61K 31/403** (2006.01); **A61K 31/404** (2006.01); **A61K 31/44** (2006.01); **A61K 31/4402** (2006.01); **A61K 31/4406** (2006.01); **A61K 31/4409** (2006.01); **A61K 31/4418** (2006.01); **A61K 31/4427** (2006.01); **A61K 31/47** (2006.01); **A61P 31/12** (2006.01); **A61P 43/00** (2006.01); **C07C 237/22** (2006.01); **C07C 271/22** (2006.01); **C07C 317/26** (2006.01); **C07C 323/59** (2006.01); **C07C 323/60** (2006.01); **C07C 327/20** (2006.01); **C07C 327/38** (2006.01); **C07D 209/14** (2006.01); **C07D 209/16** (2006.01); **C07D 209/20** (2006.01); **C07D 213/30** (2006.01); **C07D 213/38** (2006.01); **C07D 213/40** (2006.01); **C07D 213/56** (2006.01); **C07D 215/36** (2006.01); **C07D 215/48** (2006.01); **C07D 233/54** (2006.01); **C07D 235/12** (2006.01); **C07D 235/14** (2006.01); **C07D 401/12** (2006.01); **C07K 5/02** (2006.01); **A61K 38/00** (2006.01)

CPC (source: EP)  
**A61P 31/12** (2017.12); **A61P 43/00** (2017.12); **C07C 271/22** (2013.01); **C07C 323/59** (2013.01); **C07C 323/60** (2013.01); **C07D 209/16** (2013.01); **C07D 209/20** (2013.01); **C07D 213/30** (2013.01); **C07D 213/38** (2013.01); **C07D 213/40** (2013.01); **C07D 215/36** (2013.01); **C07D 233/64** (2013.01); **C07D 235/12** (2013.01); **C07D 235/14** (2013.01); **C07K 5/0205** (2013.01); **A61K 38/00** (2013.01); **Y02P 20/55** (2015.11)

Citation (search report)  
See references of WO 9301166A1

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

DOCDB simple family (publication)  
**WO 9301166 A1 19930121**; AU 2194492 A 19930211; CA 2109326 A1 19930103; EP 0594656 A1 19940504; IE 922143 A1 19930113; IL 102362 A0 19930114; JP H07501786 A 19950223; MX 9203836 A 19930101; TW 221686 B 19940311

DOCDB simple family (application)  
**EP 9201471 W 19920630**; AU 2194492 A 19920630; CA 2109326 A 19920630; EP 92913821 A 19920630; IE 922143 A 19920701; IL 10236292 A 19920630; JP 50193792 A 19920630; MX 9203836 A 19920630; TW 81105274 A 19920703