

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