

Title (en)
DIHYDROPYRIMIDINE NUCLEOSIDES WITH ANTIVIRAL PROPERTIES.

Title (de)
DIHYDROPYRIMIDIN NUCLEOSIDE MIT ANTIVIRALE AKTIVITÄT.

Title (fr)
NUCLEOSIDES DE DIHYDROPYRIMIDINE A PROPRIETES ANTIVIRALES.

Publication
EP 0626970 A1 19941207 (EN)

Application
EP 94902577 A 19931220

Priority
• CA 9300553 W 19931220
• US 99372692 A 19921218

Abstract (en)
[origin: WO9414831A1] Pharmaceutical compounds of general formula (I) have been prepared and non-toxic pharmaceutically acceptable salts thereof, wherein R1 is a halogen substituent; R2 is a member selected from the group consisting of alkoxy, hydroxy and azido; and X-Y is a member selected from the group consisting of CH(N3)-CH2, CH(F)-CH2 and CH = CH. Halogen denotes an iodo, bromo, chloro and fluoro atom. Alkoxy denotes a straight or branched chain moiety having 1-16 carbon atoms. Compounds of formula (I) can exist as the (5R, 6R), (5S, 6S), (5R, 6S) and (5S, 6R) diastereomers which differ in configuration at positions C-5 and C-6. These compounds exhibit anti-human immunodeficiency virus activity (anti-HIV) and are useful in the treatment of acquired immunodeficiency syndrom (AIDS) and AIDS-related complex.

Abstract (fr)
On a préparé des composés pharmaceutiques de formule générale (I), ainsi que certains de leurs sels non toxiques pharmaceutiquement acceptables, où R1 représente un substituant halogène; R2 représente un élément sélectionné dans le groupe consistant en alcoxy, hydroxy et azido; et X-Y représente un élément sélectionné dans le groupe consistant en CH(N3)-CH2, CH(F)-CH2 et CH = CH. L'halogène représente un atome iodo, bromo, chloro et fluoro. L'alcoxy représente une fraction à chaîne droite ou ramifiée dotée de 1 à 16 atomes de carbone. Ces composés de formule (I) peuvent exister sous forme de diastéréomères (5R, 6R), (5S, 6S), (5R, 6S) et (5S, 6R) dont la configuration diffère aux positions C-5 et C-6. Ces composés présentent une activité contre le virus de l'immunodéficience humaine (anti-VIH) et se révèlent utiles pour le traitement du syndrome d'immunodéficience acquise (SIDA) et du para-sida.

IPC 1-7
C07H 19/06; A61K 31/70

IPC 8 full level
C07D 405/04 (2006.01); **C07H 19/06** (2006.01)

CPC (source: EP)
C07D 405/04 (2013.01); **C07H 19/06** (2013.01)

Citation (search report)
See references of WO 9414831A1

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

DOCDB simple family (publication)
WO 9414831 A1 19940707; AU 5691094 A 19940719; CA 2130265 A1 19940707; EP 0626970 A1 19941207

DOCDB simple family (application)
CA 9300553 W 19931220; AU 5691094 A 19931220; CA 2130265 A 19931220; EP 94902577 A 19931220