



SUOMI-FINLAND  
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus  
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patentihakemus - Patentansökan	955315
(51) Kv.1k.6 - Int.c1.6	
C 07D 217/26, 207/16, A 61K 31/47	
(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag	06.11.95
(24) Alkuperäpäivä - Löpdag	26.04.94
(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig	06.11.95
(86) Kv. hakemus - Int. ansökan	PCT/US94/04621
(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet	
07.05.93 US 059038 P	

(71) Hakija - Sökande

1. Merck & Co., Inc., 126 East Lincoln avenue, Rahway, NJ 07065, USA, (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Vacca, Joseph P., 766 Eisenhower Drive, Telford, PA 19869, USA, (US)
2. Dorsey, Bruce D., 203 Continental Drive, Harleysville, PA 19438, USA, (US)
3. Guare, James P., 1600 Kumry Road, Quakertown, PA 18951, USA, (US)
4. Holloway, M. Katharine, 171 Forest Trail Drive, Landsdale, PA 19446, USA, (US)
5. Hungate, Randall W., 1925 Rampart Lane, Landsdale, PA 19446, USA, (US)
6. Levin, Rhonda B., 5 Forsythia Court, Lafayette Hille, PA 19444, USA, (US)

(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

HIV:n proteaasin inhibiittoreita, jotka ovat käyttökelpoisia AIDS'n hoitoon  
Inhibitorer av HIV proteas, som användbara vid behandling av AIDS

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Sellaisen kaavan (I) mukaiset yhdisteet, jossa R<sup>1</sup> ja R<sup>2</sup> ovat toisistaan riippumatta vety tai mahdollisesti substituoitu C<sub>1-4</sub>-alkyyli tai aryyli, ja R<sup>1</sup> muodostaa myös heterosyklin tai heterosykli-C<sub>1-4</sub>-alkyylin, ovat HIV:n proteaasin inhibiittoreita. Nämä yhdisteet ovat käyttökelpoisia HIV-infektion ehkäisemisessä tai hoidossa ja AIDS'in hoidossa joko yhdisteinä, farmaseuttisesti hyväksyttävänä suoloina, farmaseuttisen koostumuksen ainesosina katsomatta siihen käytetäänkö niitä mahdollisesti yhdessä muiden antiviraalisten aineiden, immunomodulaattorien, antibiootien tai rokotteiden kanssa vai ei. Keksinnössä on myös kuvattu menetelmiä AIDS'in hoitamiseksi ja menetelmiä HIV-infektion hoitamiseksi tai ehkäisemiseksi.

Sådana föreningar med formeln (I), vari R<sup>1</sup> och R<sup>2</sup> oberoende av varandra är väte eller eventuellt substituerad C<sub>1-4</sub>-alkyl eller aryl, och R<sup>1</sup> även bildar en heterocykel eller en heterocykel-C<sub>1-4</sub>-alkyl, är HIV-proteasinhämmare. Dessa föreningar är användbara vid profylax och behandling av HIV-infektion och vid behandling av AIDS antingen som föreningar, farmaceutiskt godtagbara salter, som ingredienser i en farmaceutisk komposition oberoende av om de eventuellt användes tillsammans med andra antivirala ämnen, immunomodulatorer, antibiotika eller vacciner eller ej. I uppfinningen har även beskrivits metoder för behandling av AIDS och metoder för profylax och behandling av HIV-infektion.

