



S U O M I - F I N L A N D
(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(71) Haki ja - 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 18969, USA, (US)
2. **Guare, James P.**, 1600 Kumry Road, Quakertown, PA 18951, USA, (US)
3. **Dorsey, Bruce D.**, 203 Continental Drive, Harleysville, PA 19438, USA, (US)
4. **Holloway, M. Katharine**, 171 Forest Trail Drive, Lansdale, PA 19446, USA, (US)
5. **Hungate, Randall W.**, 1925 Rampart Lane, Lansdale, PA 19446, USA, (US)

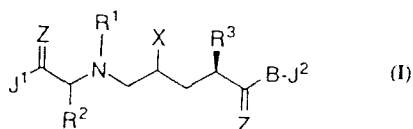
(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

HIV-proteaasin estäjiä farmaseuttisissa yhdistelmissä käytettäväksi AIDSin hoitoon
HIV proteasainhibitorer i farmaceutiska kombinationer för behandling av AIDS

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Keksintö koskee yhdisteitä, joilla on kaava (I),



jossa R_1 ja R_2 tarkoittavat toisistaan riippumatta vetyä tai mahdollisesti substituoitua C_{1-4} -alkyyliä tai aryyliä, tai R_1 ja R_2 ovat liittyneet yhteen muodostaen monosyklisen tai bisyklisen rengassysteemin; ja jotka yhdisteet ovat HIV-proteasiin estäjiä. Nämä yhdisteet ovat käyttökelpoisia HIV-infektion ehkäisemiseen tai hoitoon ja AIDSin hoitoon joko yhdisteinä, yhdisteiden farmaseuttisesti hyväksyttävienä suoloina tai farmaseuttisen koostumuksen aineosina, yhdistettynä tai ei-yhdistettynä muiden antiviraalisten aineiden, immunomodulaattoreiden, antibioottien tai rokotteiden kanssa. Edelleen kuvataan menetelmiä AIDSin hoitamiseksi ja menetelmiä HIV-infektion ehkäisemiseksi tai estämiseksi.

Uppfinningen avser föreningar med formeln (I), vari R_1 och R_2 är oberoende väte eller valbart substituerad C_{1-4} -alkyl eller aryl eller R_1 och R_2 är bundna tillsammans bildande ett monocykliskt eller bicykliskt ringssystem; och vilka föreningar förhindrar HIV-proteas. Dessa föreningar är användbara vid förhindrandet eller behandlingen av HIV-infektion och behandlingen av AIDS, antingen som föreningar, föreningarnas farmaceutiskt godtagbara salter eller farmaceutiska sammansättningar, tillsammans med eller utan andra antivirala ämnen, immunomodulatorer, antibioter eller vacciner. Uppfinningen beskriver även förfaranden för behandlingen av AIDS och förfarande för förhindrandet eller profylax av HIV-infektion.