



SUOMI-FINLAND

(FI)

Patentti- ja rekisterihallitus
Patent- och registerstyrelsen

(11) (21) Patenttihakemus - Patentansökan 891716

(51) Kv.1k.4 - Int.cl.4

C 07C 125/06, C 07D 235/14, 311/68, 401/12,
C 07F 9/09, 9/44, C 07H 13/04, C 07K 5/06

(22) Hakemispäivä - Ansökningsdag 11.04.89

(24) Alkupaivä - Löpdag 11.04.89

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig 13.10.89

(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet

12.04.88 US 180507

24.08.88 US 236084

28.03.89 US 328643

(71) Hakija - Sökande

1. Merck & Co. Inc., 126 E. Lincoln Avenue, Rahway, N.J., USA, (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare

1. Sigal, Irving S., 120 East Delaware Avenue, Pennington, N.J. 08534, USA, (US)
2. Huff, Joel R., 738 Bergey Mill Road, Lederach, USA, (US)
3. Darke, Paul L., 434 West Walnut Street, Apt. 3, North Wales, Pa. 19454, USA, (US)
4. Vacca, Joseph P., 766 Eisenhower Drive, Telford, Pa. 18969, USA, (US)
5. Young, Steven D., 1280 Mark Drive, Lansdale, Pa. 19446, USA, (US)
6. DeSolms, S. Jane, 735 Port Indian Road, Norristown, Pa. 19403, USA, (US)
7. Thompson, Wayne J., Box 172, Whites Mill Road, Green Lane, Pa. 18054, USA, (US)
8. Lyle, Terry A., 570 Camp Wa Wa Road, Lederach, Pa. 19440, USA, (US)
9. Graham, Samuel L., 382 Chadwyck Circle, Harleysville, Pa. 19438, USA, (US)
10. Ghosh, Arun K., 1141 Snyder Road, Forge Gate, Apt. D-37, Lansdale, Pa. 19446, USA, (US)

(74) Asiamies - Ombud: Oy Kolster Ab

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning

HIV-proteaasi-inhibiittoreita, jotka ovat käyttökelpoisia AIDS'in hoidossa
 HIV-proteasinhäpitorer, som är användbara vid behandling av AIDS

(57) Tiivistelmä - Sammandrag

Kuvataan yhdisteitä, joiden kaava on

A-G-B-B-J

jossa A on peptidisynteesissä tavanomaisesti käytetty aminia suojaava ryhmä, G on dipeptidi-isosteerä, B on aminohappo tai mainitun analogi ja J on pieni päätyryhmä. Nämä yhdisteet ovat hyödyllisiä HIV-proteaasin inhiboimiseksi, HIV-tartunnan estämiseksi tai hoitamiseksi sekä aidsin hoitamiseksi joko sellaisenaan, farmaseuttisesti hyväksyttävänä suoloinaan, farmaseuttisen koostumuksen ainesosina; riippumatta siitä, onko ne yhdistetty muihin virusvastaisiin aineisiin, immuunisäätelijöihin, antibiootteihin tai rokotteisiin. Kuvataan niinkään menetelmiä aidsin hoitamiseksi sekä menetelmiä HIV-tartunnan estämiseksi tai hoitamiseksi.

Föreningar med formeln:

A-G-B-B-J

vari A är en allmänt i peptidsyntesen använd aminoskyddsgrupp, G är en dipeptidisoster, B är en aminosyra eller en analog därav, och J är en mindre ändgrupp, beskrivs. Dessa föreningar är användbara vid hämmandet av HIV-proteas, vid förhindrande eller behandling av infektioner genom HIV och vid behandlingen av AIDS antingen som sådana, som farmaceutiskt godtagbara salt, som farmaceutiska kompositionsingredienser i eller utan kombination med andra antiviralmedel, som immunomodulatorer, som antibiotika eller som vaccin. Förfaranden för behandling av AIDS och förfaranden för förhindrande eller behandling av infektioner genom HIV beskrivs även.