(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator dokumenta: HR P20110530 T1

HR P20110530 T1

(12) PRIJEVOD PATENTNIH ZAHTJEVA EUROPSKOG PATENTA

(51) MKP:
C07D 209/08 (2006.01)
C07D 209/30 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01)
A61P 25/00 (2006.01)
A61K 31/454 (2006.01)
A61K 31/404 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 30.09.2011.

(21) Broj predmeta: P20110530T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 14.07.2011.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/IN2008000247
Datum podnošenja međunarodne prijave: 15.04.2008.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 08763731.0
Datum podnošenja europske prijave patenta: 15.04.2008.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2008136017
Datum međunarodne objave: 13.11.2008.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2155674 A1
Datum objave europske prijave patenta: 24.02.2010.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2155674 B1
Datum objave europskog patenta: 22.06.2011.

(31) Broj prve prijave: CH09402007 (32) Datum podnošenja prve prijave: 03.05.2007. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: IN

(73) Nositelj patenta: **Suven Life Sciences Limited, Serene Chambers, Road No. 7, Banjara Hills, Hyderabad 500 034, AP, IN**

(72) Izumitelj:
Ramakrishna Nirogi, SUVEN LIFE SCIENCES LIMITED Serene Chambers, Road No. 5, Avenue 7 Banjara Hills, Hyderabad 500 034, AP, IN
Rama Sastri Kambhampati, SUVEN LIFE SCIENCES LIMITED Serene Chambers, Road No. 5, Avenue 7 Banjara Hills, Hyderabad 500 034, AP, IN
Anil Karbhari Shinde, SUVEN LIFE SCIENCES LIMITED Serene Chambers, Road No. 5, Avenue 7 Banjara Hills, Hyderabad 500 034, AP, IN
Anand Vijaykumar Daulatabad, SUVEN LIFE SCIENCES LIMITED Serene Chambers, Road No. 5, Avenue 7 Banjara Hills, Hyderabad 500 034, AP, IN
Adi Reddy Dwarampudi, SUVEN LIFE SCIENCES LIMITED Serene Chambers, Road No. 5, Avenue 7 Banjara Hills, Hyderabad 500 034, AP, IN
Nagaraj Vishwottam Kandikere, SUVEN LIFE SCIENCES LIMITED Serene Chambers, Road No. 5, Avenue 7 Banjara Hills, Hyderabad 500 034, AP, IN
Santosh Vishwakarma, SUVEN LIFE SCIENCES LIMITED Serene Chambers, Road No. 5, Avenue 7 Banjara Hills, Hyderabad 500 034, AP, IN

HR P20110530 T1

(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator dokumenta: HR P20110530 T1

HR P20110530 T1

(12) PRIJEVOD PATENTNIH ZAHTJEVA EUROPSKOG PATENTA

Venkateswarlu Jasti, SUVEN LIFE SCIENCES LIMITED Serene Chambers, Road No. 5, Avenue 7 Banjara Hills, Hyderabad 500 034, AP, IN

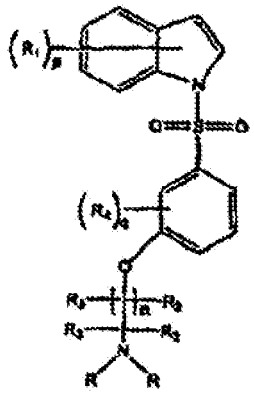
(74) Zastupnik: FORINPRO d.o.o., 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma: **SPOJEVI AMINOALKOKSI ARIL SULFONAMIDA I NJIHOVA UPOTREBA KAO LIGANDI 5-HT6**

HR P20110530 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

1. Spoj formule (I)



(I)

naznačen time, što

R_1 predstavlja vodik, hidroksil, halogen, (C_1-C_3)alkiltio, (C_1-C_3)alkil, halo(C_1-C_3)alkil, (C_1-C_3)alkoksi, halo(C_1-C_3)alkoksi, ciklo(C_3-C_6)alkil, ciklo(C_3-C_6)alkoksi ili cikloalkil (C_3-C_6)alkoksi;

R, R_1, R_3 i R_4 mogu biti isti ili različiti i svaki nezavisno predstavlja vodik, halogen, (C_1-C_3)alkil, halo(C_1-C_3)alkil, (C_1-C_3)alkoksi, halo(C_1-C_3)alkoksi ili cikloalkil(C_3-C_6)alkoksi;

"n" predstavlja 0 do 4;

"p" predstavlja 0 do 6;

"q" predstavlja 0 do 4.

2. Spoj prema patentnom zahtjevu 1, **naznačen time**, što

R_1 je vodik, hidroksil. halogen, (C_1-C_3)alkiltio (C_1-C_3)alkil, halo(C_1-C_3)alkil, (C_1-C_3)alkoksi, cikloalkil(C_3-C_6)alkoksi ili halo(C_1-C_3)alkoksi;

ili pri čemu je

R_2 vodik, halogen, (C_1-C_3)alkil. halo(C_1-C_3)alkil, (C_1-C_3)alkoksi, cikloalkil(C_3-C_6) alkoksi ili halo (C_1-C_3)alkoksi;

ili pri čemu je

R_3 vodik, halogen, (C_1-C_3) alkil, halo(C_1-C_3)alkil, (C_1-C_3)alkoksi, cikloalkil(C_1-C_3)alkoksi ili halo(C_1-C_3)alkoksi;

ili pri čemu je

R_4 vodik, halogen, (C_1-C_3)alkil, halo(C_1-C_3)alkil, (C_1-C_3)alkoksi, cikloalkil (C_3-C_6)alkoksi ili halo(C_1-C_3)alkoksi;

ili pri čemu je

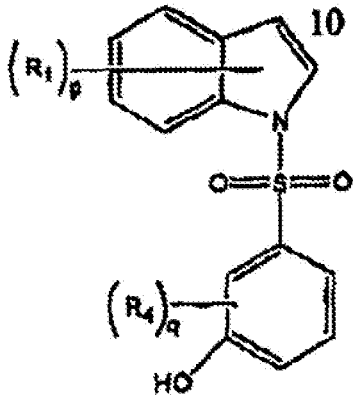
R vodik, halogen, (C_1-C_3)alkil, halo(C_1-C_3)alkil, (C_1-C_3)alkoksi, ciklo alkil(C_3-C_6)alkoksi ili halo(C_1-C_3)alkoksi.

3. Spoj prema patentnom zahtjevu 1, **naznačen time**, što je izabran iz grupe koja se sastoji od:

1-[3'-(N,N-dimetilamin etoksi)benzensulfonil]-1H-indol;
5-Fluor-1-[3'-(N,N-dimetilamin etoksi)benzensulfonil]-1H-indol;
5-Brom-1-(3'-[N,N dimetilamin etoksi)benzensulfonil]-1H-indol;
5-Fluor-1-[3'-(N,N-dimetilamin propoksi benzensulfonil]-1H-indol;
5-Brom-1-[3'-(N,N-dimetilamin propoksi)benzensulfonil]-1H-indol;
1-[3'-(N,N-dimetilamin propoksi)benzensulfonil]-5-metoksi-1H-indol;
1-[4'-Metil-3'-(N,N-dimetilamin etoksi)benzensulfonil]-9H-indol;
5-Fluor-1-[4'-metil-3'-(N,N-dimetilamin etoksi)benzensulfonil]-1H-indol;
5-Brom-1-[4'-metil-3'-(N,N-dimetilamin etoksi)benzensulfonil]-1H-indol;
1-[4'-Metil-3'-(N,N-dimetilamin etoksi)benzensulfonil]-5-metoksi-1H-indol;
5-Etoksi-1-[4'-metil-3-(N,N-dimetilamin etoksi)benzensulfonil]-1H-indol;
6-Klor-1-[4'-metil-3'-(N,N-dimetilamin etoksi)benzensulfonil]-1H-indol;
1-[4'-Metil-3'-(N,N-dimetilamin propoksi)benzensulfonil]-1H-indol;
5-Fluor-1-[4'-Metil-3'-(N,N-dimetilamin propoksi)benzensulfonil]-1H-indol;
5-Brom-1-[4'-Metil-3'-(N,N-dimetilamin propoksi)benzensulfonil]-1H-indol;
1-[4'-Metil-3'-(N,N-dimetilamin propoksi)benzensulfonil]-5-metoksi-1H-indol;
5-Etoksi-1-[4'-metil(-3'-(N,N-dimetilamin propoksi)benzensulfonil]-1H-indol;
6-Klor-1-[4'-metil-3'-(N,N-dimetilamin propoksi)benzensulfonil]-1H-indol;
1-[4'-Etil-3'-(N,N-dimetilamin etoksi)benzensulfonil]-1H-indol;

5-Brom-1-[4'-etil-3'-(N,N-dimetilamin etoksi)benzensulfonil]-1H-indol;
1-[4'-Etil-3'-(N,N-dimetilamin etoksi)benzensulfonil]-5-metoksi-1H-indol;
6-Klor-1-[4'-Etil-3'-(N,N-dimetilamin etoksi)benzensulfonil]-1H-indol;
1-[4'-Etil-3'-(N,N- dimetilamin etoksi)benzensulfonil]-5-fluor-1H-indol;
1-[4'-Etil-3'-(N,N-dimetilamin propoksi)benzensulfonil]-1H-indol;
5-Brom-1-[4'-Etil-3'-(N,N-dimetilamin propoksi)benzensulfonil]-1H-indol;
1-[4'-Etil-3'-(N,N-dimetilamin propoksi)benzensulfonil]-6-klor-1H-indol;
1-[4'-Etil-3'-(N,N-dimetilamin propoksi)benzensulfonil]-5-metoksi-1H-indol;
1-[4'-Etil-3'-(N,N-dimetilamin propoksi)benzensulfonil]-5-fluor-1H-indol;
1-[4'-Izopropil-3'-(N,N-dimetilamin etoksi)benzensulfonil]-1H-indol;
1-[4'-Izopropil-3'-(N,N-dimetilamin etoksi)benzensulfonil]-5-metoksi-3-metil-1H-indol;
1-[4'-Izopropil-3'-(1-dimetilamin-2-Propioksi)benzensulfonil]-1H-indol;
1-[4'-Izopropil-3'-(2-dimetilamin-1-propoksi)benzensulfonil]-1H-indol;
1-[4'-Izopropil-3'-(N,N-dimetilamin etoksi)benzensulfonil]-3-metil-1H-indol:
1-[4'-Izopropil-3'-(N,N-dimetilamin propoksi)benzensulfonil]-3-metil-1H-indol;
1-[4'-Izopropil-3'-(N,N-dimetilamin etoksi)benzensulfonil]-5-metoksi-1H-indol;
1-[4'-Izopropil-3'-(N,N-dimetilamin propoksi)benzensulfonil]-5-Metoksi-1H-indol;
1-[4'-Izopropil-3'-(2-dimetilamin propoksi)benzensulfonil)-5-Metoksi-l H-indol
1-[4'-Izopropil-3'-(1-dimetilamin-2-propoksi)benzensulfonil]-5-metoksi-1H-indol;
1-[4'-Izopropil-3'-(N,N-dimetilamin etoksi)benzensulfonil]-5-fluor-1H-indol;
1-[4'-Izopropil-3'-(N,N-dimetilamin propoksi)benzensulfonil]-5-fluor-1H-indol;
1-[4'-Izopropil-3'-(2-dimetilamin propoksi)benzensulfonil]-5-fluor-1H-indol;
1-[4'-Izopropil-3'-(1-dimetilamin-2-propoksi)benzensulfonil]-5-fluor-1H-indol;
1-[4'-Izopropil-3'-(N,N-dimetilamin etoksi)benzensulfonil]-5-fluor-3-metil-1H-indol;
1-[4'-Izopropil-3'-(N,N-dimetilamin propoksi)benzensulfonil]-5-fluor-3-metil-1H-indol;
4-Klor-1-[4'-Metil-3'-(N,N- dimetilamin propoksi)benzensulfonil]-1H-indol;
5-Metoksi-1-[3'-(N,N-dimetilamin etoksi)benzensulfonil]-1H-indol;
1-[3'-(N,N-dimetilamin propoksi)benzensulfonil]-1H-Indol;
1-[4'-Izopropil-3'-(N,N-dimetilamin propoksi)benzensulfonil]-1H-indol;
njihovih stereoizomera;
i njihovih soli.

4. Postupak za pripremu spoja formule (I) u skladu sa patentnim zahtjevom 1, obuhvaća doticanje spoja formule (a)



(a)

sa amino derivatima, koristeći pogodnu bazu u prisutnosti inertnog otapala na temperaturi okoline kako bi se dobio spoj formule (I), **naznačen time**, što svi supstitutenti su definirani kao u patentnom zahtjevu 1.

5. Postupak u skladu sa patentnim zahtjevom 4, **naznačen time**, što je navedena baza izabrana iz kalijevog karbonata, natrijevog bikarbonata i natrijevog hidrida. ili pri čemu je navedeno inertno otapalo izabrano iz tetrahidrofurana, toluena. etil acetata. vode, dimetilformamida, dimetil sulfoksida i dimetil etera.
6. Spoj formule (I) u skladu sa patentnim zahtjevom 1, **naznačen time**, što se koristi u prevenciji ili liječenju od Alzheimerove bolesti, Parkinsonove bolesti, šizofrenije, depresije, poremećaja nedostatka pažnje, opsesivno kompulzivnog poremećaja, ili pretilosti.
7. Farmaceutski pripravak, **naznačen time**, što sadrži spoj kao što je definirano u patentnom zahtjevu 1 i farmaceutski prihvatljivu podlogu.
8. Spoj formule (I), u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 3 **naznačen time**, što je namijenjen upotrebi kao medikament.

9. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 1, **naznačen time**, što za upotrebu ispitivanja antagonista i antagonista sa selektivnošću za receptor 5-HT_6 obuhvaća davanje spoja zahtjeva 1 i promatranje navedenih životinjskih odgovora i usporedbu odgovora za kontrolu životinja; i davanje drugih spojeva nepoznatih aktivnosti navedenim pokusnim životinjama.
10. Spoj formule (I) u skladu sa patentnim zahtjevom 1, **naznačen time**, što se koristi u prevenciji ili liječenju poremećaja središnjeg živčanog sustava, poremećaja ishrane, gastrointestinalnih poremećaja, hematološkog poremećaja, bola, respiratorne bolesti, genito-urinarnih poremećaja, kardiovaskularnih bolesti i karcinoma.