



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20140621 T1

HR P20140621 T1

(12) **PRIJEVOD PATENTNIH ZAHTEJEVA
EUROPSKOG PATENTA**

(51) MKP:

A61K 31/4965 (2006.01)
C07D 213/82 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 21.11.2014.

(21) Broj predmeta: P20140621T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 30.06.2014.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2010046537
Datum podnošenja međunarodne prijave: 24.08.2010.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 10814260.5
Datum podnošenja europske prijave patenta: 24.08.2010.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2011028548
Datum međunarodne objave: 10.03.2011.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2470182 A1
Datum objave europske prijave patenta: 04.07.2012.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2470182 B1
Datum objave europskog patenta: 04.06.2014.

(31) Broj prve prijave: 236477 P

(32) Datum podnošenja prve prijave: 24.08.2009.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelji:

Neuralstem, Inc., 9700 Great Seneca Highway, Rockville, MD 20850, US
Sripathy Venkatraman, 23 A Knights Bridge, Guilderland, NY 12084, US
Syed Mahmood, 2000 Inwood Terrace, Schenectady, NY 12303, US
Bingidimi, I. Mobeles, 208 Concord Hill Drive, Altamont, NY 12009, US
Olga Lapina, 22 Orchard Park Drive, Clifton Park, NY 12065, US
Kellie Vercoe, 11D Downing Square, Guilderland, NY 12084, US
Ying Li, 401 Briant Park Drive, Springfield, NJ 07081, US
Jonathan Salsbury, 1 Jacobs Court, Madison, WI 53711, US
Mark McLaws, 8 North Ridge, Ballston Lake, NY 12019, US
FORINPRO d.o.o., 10000 Zagreb, HR

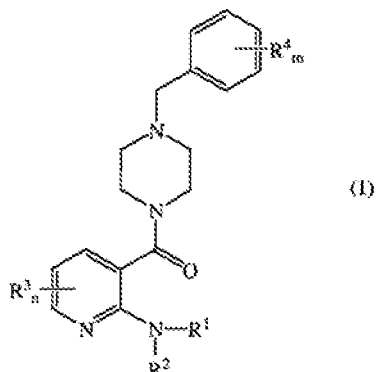
(74) Zastupnik:

(54) Naziv izuma: **SINTEZA NEUROSTIMULATIVNOG PIPERAZINA**

HR P20140621 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Metoda sintetiziranja spoja čija je formula:



gdje je

R^1 je alkil;

R^2 je H ili alkil;

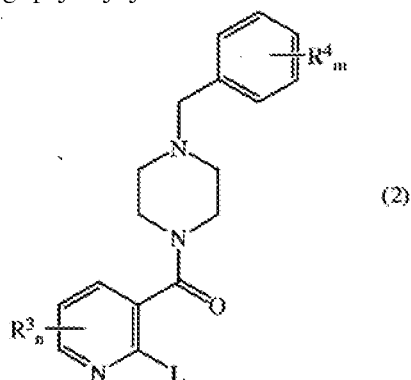
svaki R^3 i R^4 je neovisno alkil, alkenil, halo, aril, heteroaril, arilalkil, heteroarilalkil, NR_2 , SR, ili OR

gdje je R alkil ili aril;

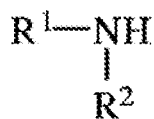
n je 0, 1 ili 2;

m je 0, 1, 2 ili 3;

koja metoda uključuje reakciju jednog spoja čija je formula



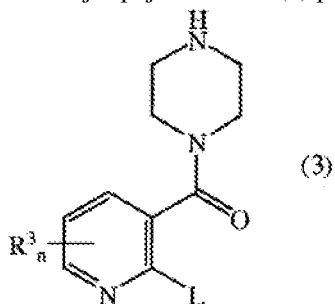
gdje su R^3 , R^4 , m i n ono što je definirano u formuli (1) a L je jedna odlazeća skupina sa spojem čija je formula



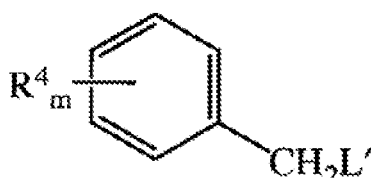
gdje su R^1 i R^2 ono što je definirano u formuli (1);

pri čemu je alkil jedan ravni lanac, razgranati lanac ili ciklički monovalentni zasićeni hidrokarbilni radikal od najviše 10C.

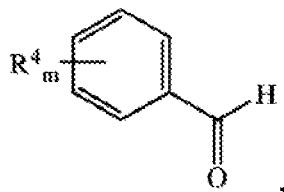
2. Metoda prema zahtjevu 1, **naznačena time** da je spoj iz formule (2) pripravljen reakcijom spoja čija je formula



gdje su R^3 i n ono što je definirano u formuli (1) a L je jedna odlazeća skupina sa spojem čija je formula

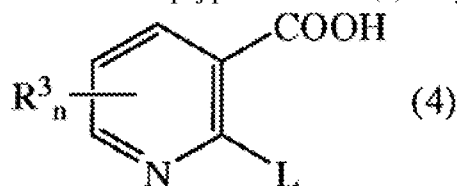


gdje su R^4 i m ono što je definirano u formuli (1) a L je jedna odlazeća skupina sa spojem čija je formula

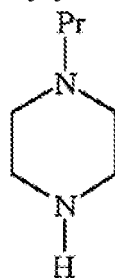


da bi se stvorio jedan imin nakon čega slijedi reduciranje tog imina.

- 5 3. Metoda prema zahtjevu 2 **naznačena time** da se spoj prema formuli (3) dobije reakcijom spoja čija je formula



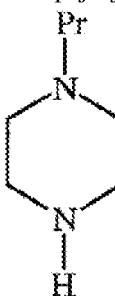
gdje su R^3 i n ono što je definirano u formuli (1) a L je jedna odlazeća skupina sa spojem čija je formula



naznačena time da je Pr jedna zaštitna skupina, u nazočnosti nekog sredstva za spajanje peptina, nakon čega slijedi uklanjanje te zaštitne skupine;

selektivnim povezivanjem spoja iz formule(4) s nezaštićenim piperazinom; ili

konvertiranjem spoja iz formule (4) u benzoil klorid i spajanjem tog klorida sa spojem čija je formula



nakon čega slijedi uklanjanje zaštitne skupine.

- 15 4. Metoda prema bilo kojem od zahtjeva 1-3, **naznačena time** da su m i n 0.
 5. Metoda prema bilo kojem od zahtjeva 1-3, **naznačena time** da su R^3 i/ili R^4 alkil.
 6. Metoda prema bilo kojem od zahtjeva 1-3, **naznačena time** da su L i L' neovisno halo, OTs ili OTf.
 7. Metoda prema bilo kojem od zahtjeva 1-3, **naznačena time** da je Pr Boc ili Fmoc.
 8. Metoda prema bilo kojem od zahtjeva 1-3, **naznačena time** da su L i L' neovisno halo.
 20 9. Metoda prema zahtjevu 1 koja nadalje uključuje konvertiranje spoja iz formule (1) u neku farmaceutski prihvatljivu sol.
 10. Metoda prema zahtjevu 9 **naznačena time** da je ta sol fosfatna sol.