



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20201616 T1



HR P20201616 T1

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

(51) MKP:

C07K 5/065 (2006.01)

A61K 38/05 (2006.01)

A61P 35/00 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 08.01.2021.

(21) Broj predmeta: P20201616T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 08.10.2020.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2016060242
Datum podnošenja međunarodne prijave: 06.05.2016.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 16722854.3
Datum podnošenja europske prijave patenta: 06.05.2016.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2016180740
Datum međunarodne objave: 17.11.2016.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3280721 A1
Datum objave europske prijave patenta: 14.02.2018.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3280721 B1
Datum objave europskog patenta: 22.07.2020.

(31) Broj prve prijave: 201507903

(32) Datum podnošenja prve prijave: 08.05.2015.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: GB

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelji:

Oncopeptides AB, Västra Trädgårdsgatan 15, 111 53 Stockholm, SE
Niklas Håkan Wahlström, c/o Chemoswed AB, Agneslundsvägen 27, 212 15 Malmö, SE
Johan Anders Wennerberg, c/o Chemoswed AB, Agneslundsvägen 27, 212 15 Malmö, SE

(74) Zastupnik:

Hraste & Partneri odvjetničko društvo, 10000 Zagreb, HR

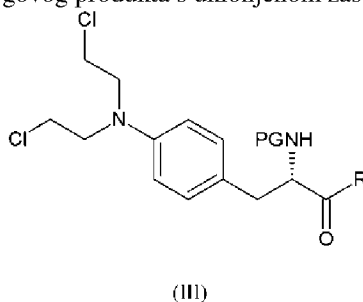
(54) Naziv izuma:

POSTUPAK PRIPRAVE DERIVATA DUŠIČNOG IPERITA

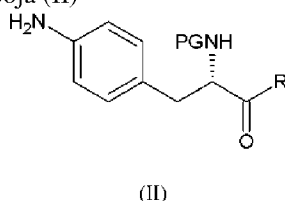
HR P20201616 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Postupak dobivanja spoja (III), ili njegovog produkta s uklonjenom zaštitom:

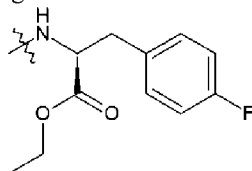


naznačen time što se sastoji u reakciji spoja (II)

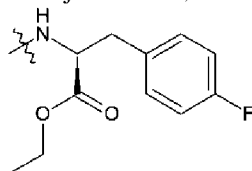


s kloroocetnom kiselinom, u prisutnosti reducensa;

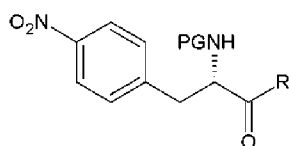
gdje je PG zaštitna skupina, a R je OH u pogodno zaštićenom obliku ili



2. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što se provodi u prisutnosti reducensa kojeg se bira iz skupine koju čine boran, kompleks boran-Lewisova baza, borohidrid, metalni hidrid, te H_2 u prisutnosti metalnog katalizatora, a po mogućnosti se bira iz skupine koju čine BH_3 i boran-dimetil-sulfid.
3. Postupak u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 ili 2, **naznačen time** što se PG bira iz skupine koju čine metiloksikarbonil, etiloksikarbonil, 9-fluorenilmetiloksikarbonil, *t*-butiloksikarbonil, benziloksikarbonil, *p*-metoksibenziloksikarbonil, 1-adamantiloksikarbonil, *p*-brombenziloksikarbonil, trifluoracetil, kloracetil, fenilacetil, benzacetil, *p*-toluensulfonil, 2-nitrobenzensulfonil, *t*-butilsulfonil, 2- ili 4-nitrobenzensulfonil, 2,4-dinitronenzesulfonil, te 2-naftalensulfonil, a po mogućnosti je *t*-butiloksikarbonil.
4. Postupak u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 3, **naznačen time** što se provodi na temperaturi u rasponu od 3 do 50 °C, od 4 do 45 °C, ili od 5 do 40 °C.
5. Postupak u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 4, **naznačen time** što se provodi u prisutnosti puferskog sredstva.
6. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 5, **naznačen time** što je pufersko sredstvo kloracetatna sol, primjerice natrijev kloracetat.
7. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 6, **naznačen time** što je molarni omjer kloroocetna kiselina:kloracetatna sol između 2:1 i 5:1, i/ili gdje je molarni omjer spoj (II):kloracetatna sol između 1:7 i 1:20.
8. Postupak u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 7, **naznačen time** što je R

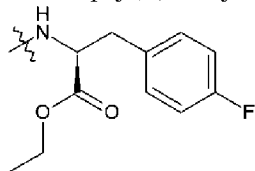


9. Postupak dobivanja soli spoja (III), ili soli produkta spoja (III) s kojeg je uklonjena zaštita, **naznačen time** što se sastoji u postupcima u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 8 i koraku dobivanja soli, primjerice koraku dobivanja hidrokloridne soli.
10. Postupak u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 9, **naznačen time** što se spoj (II) dobiva reakcijom spoja (VI):



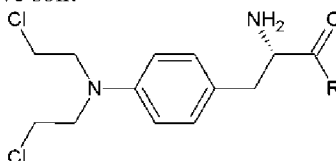
(VI)

s reducensom, gdje je PG kao što je definirano za spoj (II), a R je OH, izborno u pogodno zaštićenom obliku ili



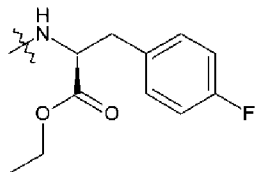
te po mogućnosti gdje je reducens vodik i katalizator, primjerice $H_2/Pd/C$.

- 5 11. Postupak dobivanja spoja (I), ili njegove soli:

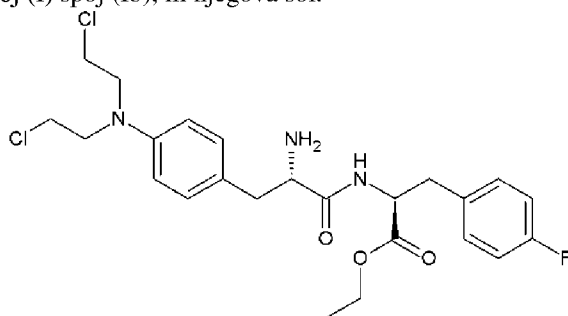


(I)

naznačen time što se sastoji u provođenju postupka u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 10, te dodatnom uklanjanju zaštite sa spoja (III) kako bi se dobilo spoj (I), ili njegovu sol, gdje je R OH, izborno u pogodno zaštićenom obliku ili

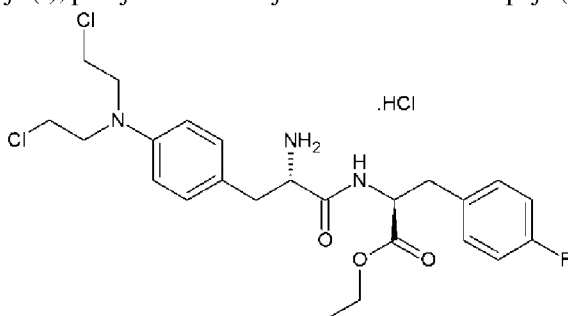


10 te po mogućnosti gdje je spoj (I) spoj (Ib), ili njegova sol:



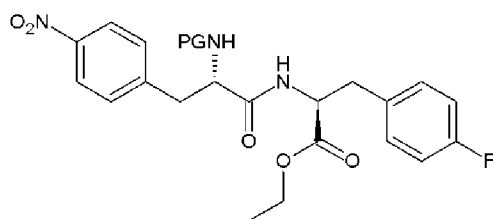
(Ib)

12. Postupak dobivanja soli spoja (I), primjerice dobivanja hidrokloridne soli spoja (Ib):



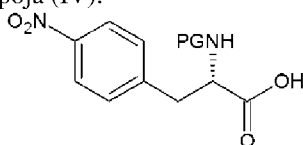
15 **naznačen time** što se sastoji u postupku u skladu s patentnim zahtjevom 11 i koraku dobivanja soli, primjerice koraku dobivanja hidrokloridne soli.

13. Postupak dobivanja spoja (VIb):



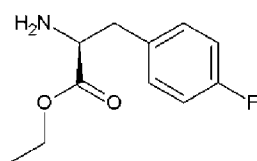
(VIb)

naznačen time što se sastoji u reakciji spoja (IV):



(IV)

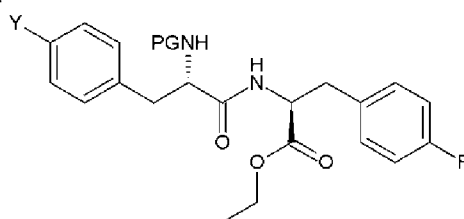
sa spojem (V):



(V)

gdje je PG zaštitna skupina.

14. Spoj koji ima sljedeću strukturu:



naznačen time što je Y NH₂ ili NO₂, a PG je zaštitna skupina.

15. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 14, **naznačen time** što je PG *t*-butiloksikarbonil.