



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO



(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20130092 T4

HR P20130092 T4

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

(51) MKP:

A61P 25/18 (2006.01)
A61K 31/495 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva:

28.02.2013.

(46) Datum objave prijevoda izmijenjenih patentnih zahtjeva:

01.01.2016.

(21) Broj predmeta:

P20130092T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR:

04.02.2013.

(86) Broj međunarodne prijave:

PCT/HU2008000052

Datum podnošenja međunarodne prijave:

19.05.2008.

(96) Broj europske prijave patenta:

EP 08762655.2

Datum podnošenja europske prijave patenta:

19.05.2008.

(87) Broj međunarodne objave:

WO 2008142463

Datum međunarodne objave:

27.11.2008.

(97) Broj objave europske prijave patenta:

EP 2164572 A2

Datum objave europske prijave patenta:

24.03.2010.

(97) Broj objave europskog patenta:

EP 2164572 B1

Datum objave europskog patenta:

14.11.2012.

(97) Broj objave izmijenjenog europskog patenta:

EP 2164572 B2

Datum objave izmijenjenog europskog patenta:

16.09.2015.

(31) Broj prve prijave: 0700370

(32) Datum podnošenja prve prijave: 24.05.2007.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: HU

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelji:

Richter Gedeon NYRT, Gyömrői út 19-21, 1103 Budapest, HU
István Laszlovszky, Bartók Béla út 16, 1111 Budapest, HU
György Németh, Hűvösvölgyi u.151/a, 1021 Budapest, HU
György Andor, Ramocsa u. 5-7, 1118 Budapest, HU

(74) Zastupnik:

CPZ - CENTAR ZA PATENTE d.o.o., 10000 Zagreb, HR

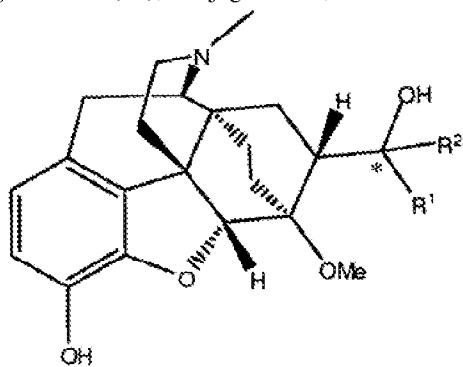
(54) Naziv izuma:

KARBAMOIL-CIKLOHEKSANI ZA LIJEČENJE AKUTNE MANIJE

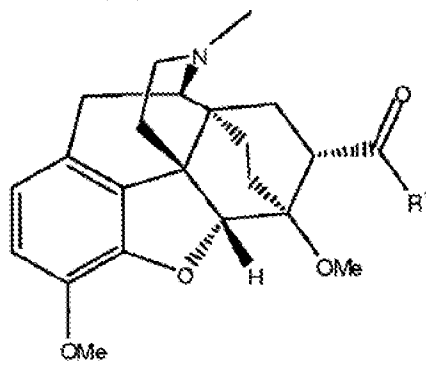
HR P20130092 T4

PATENTNI ZAHTEJEVI

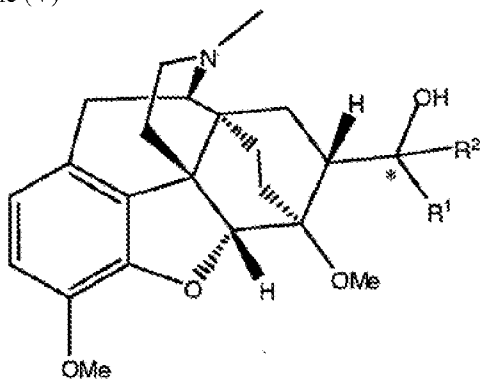
- 5 1. Postupak pripremanja spoja formule (VI), ili njegove soli,



gdje su R^1 i R^2 nezavisno C_{1-8} linearno-lančani alkil i * predstavlja (S) stereocentar, **naznačen time**, što podrazumijeva reagiranje spoja formule (IV)

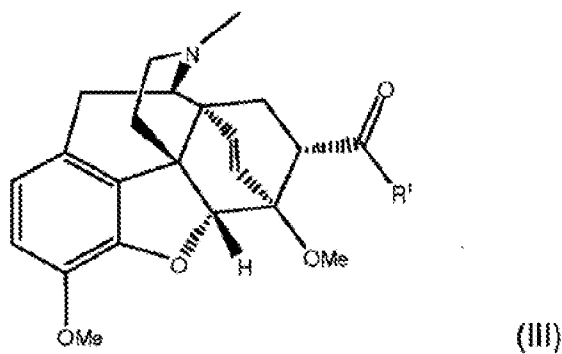


gdje je R^1 kako je ovdje ranije definirano;
sa spojem formule $R^2M(X)_p$, gdje je R^2 C_{1-8} linearno-lančani alkil, M je metal, X je halid i p je 1 ili 0
da bi se proizveo spoj formule (V)



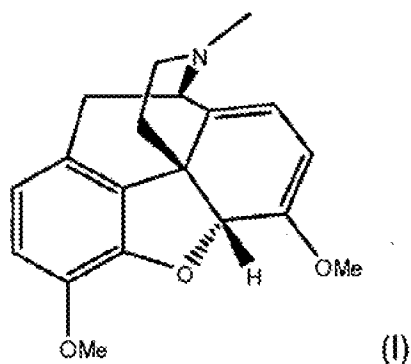
gdje su R^1 , R^2 i * kako je ovdje ranije definirano,
i hidrolizacija spomenutog spoja formule (V) da se dobije spoj formule (VI).

2. Postupak prema zahtjevu 1, **naznačen time**, što je spomenuti spoj formule (IV) pripremljen reduciranjem spoja formule (III)

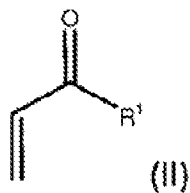


gdje je R^1 kako je ovdje ranije definirano.

3. Postupak prema zahtjevu 2, **naznačen time**, što je spomenuti spoj formule (III) pripremljen reakcijom spoja formule (I)

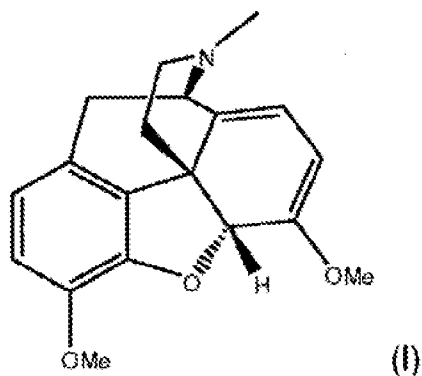


sa spojem formule (II)

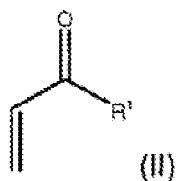


gdje je R^1 C_{1-8} linearno-lančani alkil.

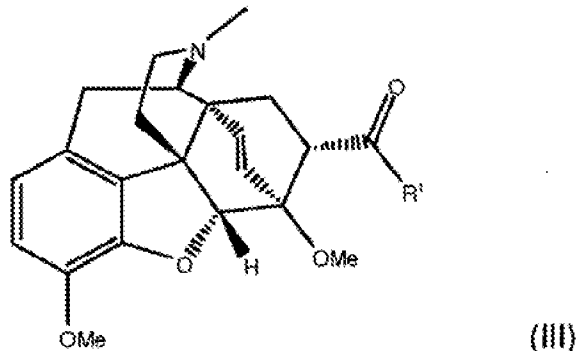
4. Postupak prema zahtjevu 1, **naznačen time**, što podrazumijeva: reagiranje spoja formule (I)



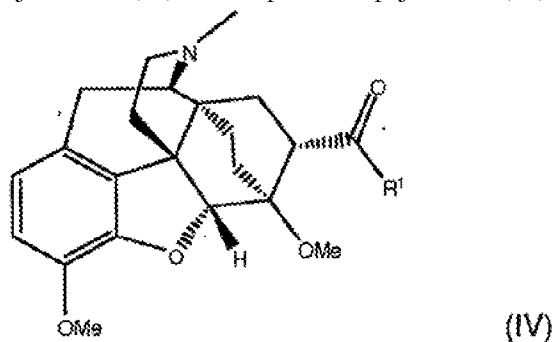
sa spojem formule (II)



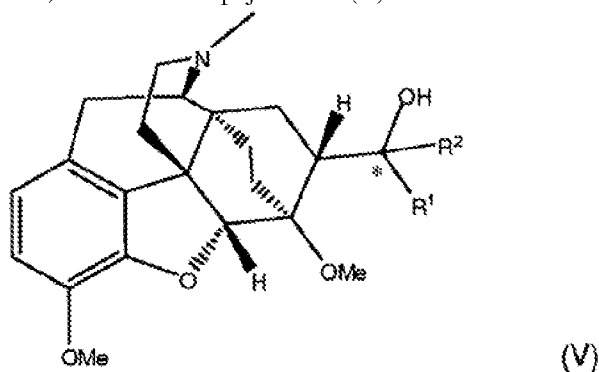
gdje je R^1 C_{1-8} linearno-lančani alkil, da bi se dobio spoj formule (III)



gdje je R^1 kako je ovde ranije definirano,
reduciranje spomenutog spoja formule (III) da bi se proizveo spoj formule (IV)



gdje je R^1 kako je ovdje ranije definirano,
reagiranje spomenutog spoja formule (IV) sa spojem formule $R^2M(X)_p$ gdje je R^2 C_{1-8} linearno-lančani alkil, M je metal, X je halid i p je 1 ili 0, da bi se dobio spoj formule (V)



gdje su R^1 , R^2 i * kako je ovdje ranije definirano,
i hidrolizacija spoja formule (V) da bi se proizveo spoj formule (VI).

5. Postupak prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 4, **naznačen time**, što je M magnezij ili litij.

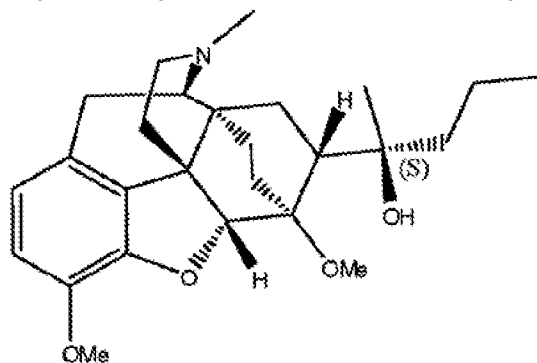
6. Postupak prema zahtjevu 5, **naznačen time**, što je $R^2M(X)_p$ R^2MgCl , R^2MgBr , R^2MgI ili R^2Li .

15 7. Postupak prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 6, **naznačen time**, što podrazumijeva još i korak kristalizacije spomenutog spoja formule (VI).

8. Postupak prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 7, **naznačen time**, što je R^1 C_{3-5} alkil.

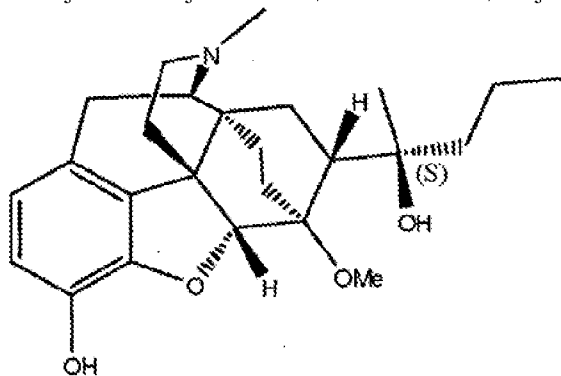
9. Postupak prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 8, **naznačen time**, što je R^1 n-propil.

10. Postupak prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 9, **naznačen time**, što je R^2 C_{1-2} alkil.
 11. Postupak prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 10, **naznačen time**, što je R^2 metil.
 12. Postupak prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 11, **naznačen time**, što se spoj formule (V) proizvodi u diastereomernom višku od najmanje 90%.
 5 13. Postupak prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 12, **naznačen time**, što je spoj formule (V):



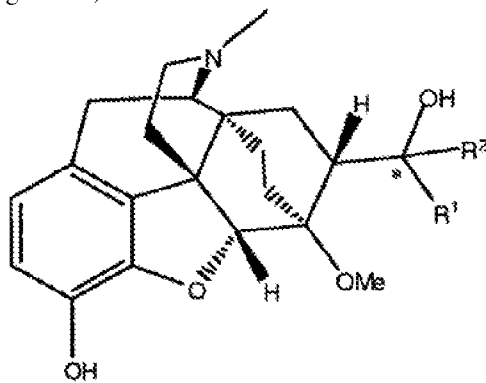
(V-a).

14. Postupak prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 13, **naznačen time**, što je spoj formule (VI):



(VI-a).

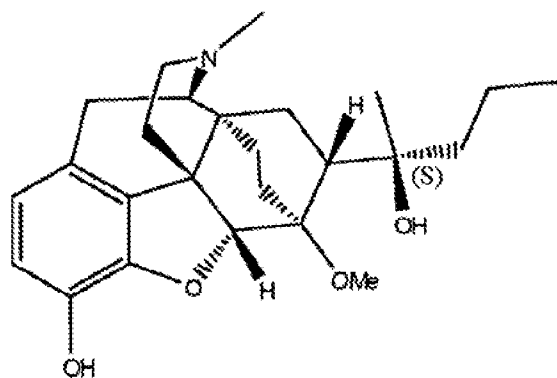
15. Spoj formule (VI), ili njegova sol,



(VI)

naznačen time, što su R^1 i R^2 nezavisno C_{1-8} linearno-lančani alkil i * predstavlja (S) stereocentar.

16. Spoj prema zahtjevu 15 formule (VIa), ili njegova sol, **naznačen time**, što je



(VIa).

17. Spoj prema zahtjevu 15 ili zahtjevu 16, **naznačen time**, što je u obliku slobodne baze.
18. Spoj prema zahtjevu 15 ili zahtjevu 16, **naznačen tim**, što je u vidu farmaceutski prihvatljive soli.
19. Spoj prema zahtjevu 18, **naznačen tim**, što je u vidu soli klorovodične kiseline.
- 5 20. Farmaceutska smjesa, **naznačena time**, što sadrži spoj prema bilo kojem od zahtjeva 15 do 19.
21. Smjesa prema zahtjevu 20, **naznačena time**, što je u doznoj formi pogodnoj za transdermalnu primjenu.
22. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 15 do 19, **naznačen time**, što se koristi u medicini.
23. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 15 do 19, **naznačen time**, što se koristi kao analgetik.
24. Uporaba spoja prema bilo kojem od zahtjeva 15 do 19, **naznačena time**, što se spoj upotrebljuje za izradu
- 10 medikamenta za liječenje boli.