



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20161797 T1



HR P20161797 T1

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

(51) MKP:

C07D 413/14 (2006.01)
A61K 31/4439 (2006.01)
A61P 1/04 (2006.01)
A61P 3/00 (2006.01)
A61P 25/06 (2006.01)
A61P 25/14 (2006.01)
A61P 25/18 (2006.01)
A61P 25/22 (2006.01)
A61P 25/28 (2006.01)
A61P 29/00 (2006.01)

A61K 31/5355 (2006.01)
A61P 1/14 (2006.01)
A61P 9/12 (2006.01)
A61P 25/08 (2006.01)
A61P 25/16 (2006.01)
A61P 25/20 (2006.01)
A61P 25/24 (2006.01)
A61P 25/36 (2006.01)
A61P 37/02 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 24.02.2017.

(21) Broj predmeta: P20161797T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 27.12.2016.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/JP2013066322
Datum podnošenja međunarodne prijave: 13.06.2013.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 13804876.4
Datum podnošenja europske prijave patenta: 13.06.2013.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2013187467
Datum međunarodne objave: 19.12.2013.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2862860 A1
Datum objave europske prijave patenta: 22.04.2015.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2862860 B1
Datum objave europskog patenta: 21.12.2016.

(31) Broj prve prijave: 2012135277 (32) Datum podnošenja prve prijave: 15.06.2012. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: JP

(73) Nositelj patenta:

TAISHO PHARMACEUTICAL CO., LTD, 24-1 Takada 3-chome Toshima-ku, 170-8633 Tokyo, JP

(72) Izumitelj:

Aya Futamura, c/o TAISHO PHARMACEUTICAL CO. LTD.24-1 Takada 3-chomeToshima-ku, 170-8633 Tokyo , JP
Yuko Araki, c/o TAISHO PHARMACEUTICAL CO. LTD.24-1 Takada 3-chomeToshima-ku, 170-8633 Tokyo , JP
Masahito Abe, c/o TAISHO PHARMACEUTICAL CO. LTD.24-1 Takada 3-chomeToshima-ku, 170-8633 Tokyo , JP
Hiroshi Ohta, c/o Taisho Pharmaceutical Co. Ltd., 24-1 Takada 3-chome Toshima-ku, 170-8633 Tokyo, JP
Ryo Suzuki, c/o TAISHOPHARMACEUTICAL CO. LTD.24-1 Takada 3-chomeToshima-ku, 170-8633 Tokyo , JP
Dai Nozawa, c/o Taisho Pharmaceutical Co. Ltd. 24-1 Takada 3-chome Toshima-ku, 170-8633 Tokyo, JP

(74) Zastupnik:

PRODUCTA d.o.o., 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma:

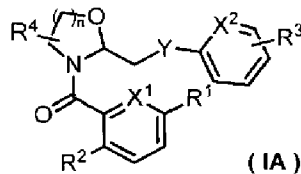
SPOJEVI 1,3-OKSAZOLIDINA ILI 1,3-OKSAZINANA KAO ANTAGONISTI RECEPTORA OREKSINA

HR P20161797 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

- 5 1. Spoj predstavljen s formulom (IA):

[Formula 1]

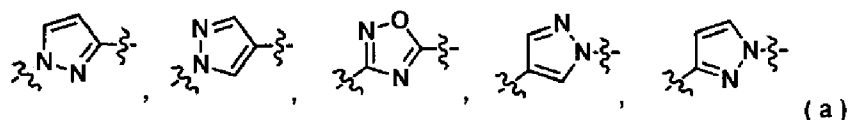


naznačen time da,

X¹ i X² su isti ili različiti i predstavljaju dušikov atom ili formulu CH;

Y predstavlja bilo koju od struktura iz slijedeće skupine formula (a):

[Formula 2]



n predstavlja 1 ili 2;

R¹ predstavlja vodikov atom, halogeni atom ili skupinu C₁₋₆ alkil;

R² predstavlja triazolil skupinu, piridil skupinu ili pirimidinil skupinu;

R³ predstavlja vodikov atom, halogeni atom ili skupinu C₁₋₆ alkil, pri čemu skupina C₁₋₆ alkil može proizvoljno biti supstituirana s 1 do 3 halogenih atoma; i

R⁴ predstavlja vodikov atom ili skupinu C₁₋₆ alkil;

ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

2. Spoj ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol prema zahtjevu 1, naznačen time da, u gornjoj formuli (IA),

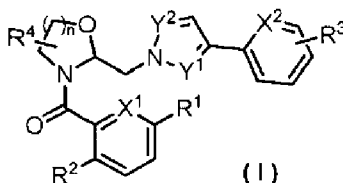
R² je skupina triazolil ili skupina pirimidinil; i

R³ je halogeni atom.

3. Spoj ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol prema zahtjevu 1 ili 2, naznačen time da, u gornjoj formuli (IA), n je 2.

4. Spoj ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol prema zahtjevu 1 prikazan s formulom (I):

[Formula 3]



naznačen time da,

X¹ i X² su isti ili različiti i predstavljaju dušikov atom ili formulu CH;

bilo koji od Y¹ i Y² predstavlja dušikov atom, dok drugi predstavlja CH;

n predstavlja 1 ili 2;

R¹ predstavlja vodikov atom, halogeni atom ili skupinu C₁₋₆ alkil;

R² predstavlja triazolil skupinu, piridil skupinu ili pirimidinil skupinu;

R³ predstavlja vodikov atom, halogeni atom ili skupinu C₁₋₆ alkil, pri čemu skupina C₁₋₆ alkil može proizvoljno biti supstituirana s 1 do 3 halogena atoma; te

R⁴ predstavlja vodikov atom ili skupinu C₁₋₆ alkil;

ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

5. Spoj ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol prema zahtjevu 4, naznačen time da, u gornjoj formuli (I),

R² je skupina triazolil ili skupina pirimidinil; i

R³ je halogeni atom.

6. Spoj ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol prema zahtjevu 4 ili 5, naznačen time da, u gornjoj formuli (I), n je 2.

7. Spoj ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol prema zahtjevu 1, naznačen time da je vrsta ili mješavina dviju ili više vrsta koje su odabrane iz skupa koji sadrži:

(-)-(2-{[3-(5-fluorpiridin-2-il)-1H-pirazol-1-il]metil}-1,3-oksazolidin-3-il)[5-metil-2-(2H-1,2,3-triazol-2-il)fenil]metanon,

(-)-(2-{[4-(5-fluorpiridin-2-il)-1H-pirazol-1-il]metil}-1,3-oksazolidin-3-il)[5-metil-2-(2H-1,2,3-triazol-2-il)fenil]metanon,

- (-)-(2-{[3-(5-fluorpiridin-2-il)-1H-pirazol-1-il]metil}-1,3-oksazinan-3-il)[5-metil-2-(2H-1,2,3-triazol-2-il)fenil]metanon,
- (-)-(2-{[4-(5-fluorpiridin-2-il)-1H-pirazol-1-il]metil}-1,3-oksazinan-3-il)[5-metil-2-(2H-1,2,3-triazol-2-il)fenil]metanon,
- 5 (-)-[(2S,5S)-2-{[4-(5-fluorpiridin-2-il)-1H-pirazol-1-il]metil}-5-metil-1,3-oksazolidin-3-il] [5-metil-2-(2H-1,2,3-triazol-2-il)fenil]metanon,
- (-)-[(2S,5R)-2-{[4-(5-fluorpiridin-2-il)-1H-pirazol-1-il]metil}-5-metil-1,3-oksazolidin-3-il] [5-metil-2-(2H-1,2,3-triazol-2-il)fenil]metanon,
- 10 [(2S,4R)-2-{[3-(5-fluorpiridin-2-il)-1H-pirazol-1-il]metil}-4-metil-1,3-oksazolidin-3-il] [5-metil-2-(2H-1,2,3-triazol-2-il)fenil]metanon,
- (-)-[(2S,4S)-2-{[3-(5-fluorpiridin-2-il)-1H-pirazol-1-il]metil}-4-metil-1,3-oksazolidin-3-il] [5-metil-2-(2H-1,2,3-triazol-2-il)fenil]metanon,
- (±)-2-{[3-(5-fluorpiridin-2-il)-1H-pirazol-1-il]metil}-1,3-oksazolidin-3-il] [5-metil-2-(pirimidin-2-il)fenil]metanon,
- (±)-(2-{[3-(5-fluorpiridin-2-il)-1H-pirazol-1-il]metil}-1,3-oksazolidin-3-il)[5-fluor-2-(pirimidin-2-il)fenil]metanon,
- 15 (±)-(2-{[3-(4-fluorfenil)-1H-pirazol-1-il]metil}-1,3-oksazolidin-3-il)[5-metil-2-(2H-1,2,3-triazol-2-il)fenil]metanon,
- (±)-(2-{[4-(4-fluorfenil)-1H-pirazol-1-il]metil}-1,3-oksazolidin-3-il)[5-metil-2-(2H-1,2,3-triazol-2-il)fenil]metanon,
- (±)-(2-{[4-(4-fluorfenil)-1H-pirazol-1-il]metil}-1,3-oksazolidin-3-il)[5-metil-2-(pirimidin-2-il)fenil]metanon,
- (-)-(2-{[3-(4-fluorfenil)-1H-pirazol-1-il]metil}-1,3-oksazolidin-3-il)[6-metil-3-(2H-1,2,3-triazol-2-il)piridin-2-il]metanon,
- 20 (-)-(2-{[3-(4-fluorfenil)-1H-pirazol-1-il]metil}-1,3-oksazinan-3-il)[6-metil-3-(2H-1,2,3-triazol-2-il)piridin-2-il]metanon,
- (-)-(2-{[3-(4-fluorfenil)-1H-pirazol-1-il]metil}-1,3-oksazinan-3-il)[6-metil-3-(pirimidin-2-il)piridin-2-il]metanon,
- (-)-(2-{[3-(5-fluorpiridin-2-il)-1H-pirazol-1-il]metil}-1,3-oksazinan-3-il)[5-fluor-2-(2H-1,2,3-triazol-2-il)fenil]metanon,
- 25 (-)-(2-{[3-(5-fluorpiridin-2-il)-1H-pirazol-1-il]metil}-1,3-oksazinan-3-il)[5-metil-2-(pirimidin-2-il)fenil]metanon,
- (-)-(2-{[4-(4-fluorfenil)-1H-pirazol-1-il]metil}-1,3-oksazinan-3-il)[6-metil-3-(2H-1,2,3-triazol-2-il)piridin-2-il]metanon,
- (-)-(2-{[4-(4-fluorfenil)-1H-pirazol-1-il]metil}-1,3-oksazinan-3-il)[6-metil-3-(pirimidin-2-il)piridin-2-il]metanon,
- (-)-[2-{[3-(5-fluorpiridin-2-il)-1H-pirazol-1-il]metil}-1,3-oksazinan-3-il] [5-fluor-2-(pirimidin-2-il)fenil]metanon,
- 30 (-)-[2-{[4-(4-fluorfenil)-1H-pirazol-1-il]metil}-1,3-oksazinan-3-il] [5-metil-2-(2H-1,2,3-triazol-2-il)fenil]metanon,
- (-)-[2-{[5-(5-fluorpiridin-2-il)-1,2,4-oksadiazol-3-il]metil}-1,3-oksazinan-3-il] [5-metil-2-(2H-1,2,3-triazol-2-il)fenil]metanon,
- (-)-[2-{[5-(4-fluorfenil)-1,2,4-oksadiazol-3-il]metil}-1,3-oksazinan-3-il] [5-metil-2-(2H-1,2,3-triazol-2-il)fenil]metanon,
- 35 (-)-[2-{[5-(4-fluorfenil)-1,2,4-oksadiazol-3-il]metil}-1,3-oksazinan-3-il] [6-metil-3-(2H-1,2,3-triazol-2-il)piridin-2-il]metanon,
- [(2S,4S)-2-{[4-(5-fluorpiridin-2-il)-1H-pirazol-1-il]metil}-4-metil-1,3-oksazinan-3-il][5-metil-2-(2H-1,2,3-triazol-2-il)fenil]metanon,
- (-)-[(2S*,5S*)-2-{[4-(5-fluorpiridin-2-il)-1H-pirazol-1-il]metil}-5-metil-1,3-oksazinan-3-il] [5-metil-2-(2H-1,2,3-triazol-2-il)fenil]metanon,
- 40 (-)-[2-{[3-(4-fluorfenil)-1H-pirazol-1-il]metil}-1,3-oksazinan-3-il] [5-metil-2-(pirimidin-2-il)fenil]metanon,
- (±)-[2-{[1-(5-fluorpiridin-2-il)-1H-pirazol-4-il]metil}-1,3-oksazinan-3-il] [5-metil-2-(pirimidin-2-il)fenil]metanon,
- (-)-[2-{[4-(4-fluorfenil)-1H-pirazol-1-il]metil}-1,3-oksazinan-3-il] [5-metil-2-(pirimidin-2-il)fenil]metanon,
- (-)-[2-{[1-(5-fluorpiridin-2-il)-1H-pirazol-4-il]metil}-1,3-oksazinan-3-il] [5-fluor-2-(pirimidin-2-il)fenil]metanon,
- 45 (-)-[2-{[1-(5-fluorpiridin-2-il)-1H-pirazol-3-il]metil}-1,3-oksazolidin-3-il] [5-metil-2-(2H-1,2,3-triazol-2-il)fenil]metanon,
- (-)-[2-{[1-(5-fluorpiridin-2-il)-1H-pirazol-4-il]metil}-1,3-oksazolidin-3-il] [5-metil-2-(2H-1,2,3-triazol-2-il)fenil]metanon,
- (-)-[2-{[1-(5-fluorpiridin-2-il)-1H-pirazol-4-il]metil}-1,3-oksazinan-3-il] [5-metil-2-(2H-1,2,3-triazol-2-il)fenil]metanon,
- 50 (-)-[(2S*,5R*)-2-{[4-(5-fluorpiridin-2-il)-1H-pirazol-1-il]metil}-5-metil-1,3-oksazinan-3-il] [5-metil-2-(2H-1,2,3-triazol-2-il)fenil]metanon.
8. Farmaceutski pripravak naznačen time da kao aktivni sastojak sadrži spoj ili njegovu farmaceutski prihvatljivu sol prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 7.
- 55 9. Lijek koji kao aktivni sastojak sadrži spoj ili njegovu farmaceutski prihvatljivu sol prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 7, naznačen time da je za upotrebu za liječenje ili prevenciju bolesti, kao što su poremećaj spavanja, depresija, anksioznost, poremećaj panike, shizofrenija, ovisnost o lijekovima, Alzheimerova bolest, Parkinsonova bolest, Huntingtonova bolest, poremećaj hranjenja, glavobolja, migrena, bol, gastrointestinalna bolest, epilepsija, upala, imunološka bolest, endokrina bolest ili hipertenzija.