



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20130969 T1

HR P20130969 T1

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

(51) MKP:

C07D 495/20 (2006.01)
A61K 31/438 (2006.01)
A61P 25/00 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 22.11.2013.

(21) Broj predmeta: P20130969T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 11.10.2013.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2010056449
Datum podnošenja međunarodne prijave: 12.11.2010.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 10782486.4
Datum podnošenja europske prijave patenta: 12.11.2010.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2011060217
Datum međunarodne objave: 19.05.2011.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2501704 A1
Datum objave europske prijave patenta: 26.09.2012.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2501704 B1
Datum objave europskog patenta: 18.09.2013.

(31) Broj prve prijave: 09382245
298628 P

(32) Datum podnošenja prve prijave: 16.11.2009.
27.01.2010.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: EP
US

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelji:

Eli Lilly and Company, Lilly Corporate Center, Indianapolis, IN 46285, US
Ana Belen Benito Collado, Lilly S.A., Avenida de la Industria 30, 28108
Alcobendas, Madrid, ES
Nuria Diaz Buezo, Lilly S.A., Avenida de la Industria 30, 28108
Alcobendas, Madrid, ES
Alma Maria Jimenez-Aguado, Lilly S.A., Avenida de la Industria 30, 28108
Alcobendas, Madrid, ES
Celia Lafuente Blanco, Lilly S.A., Avenida de la Industria 30, 28108
Alcobendas, Madrid, ES
Maria Angeles Martinez-Grau, Lilly S.A., Avenida de la Industria 30,
28108 Alcobendas, Madrid, ES
Concepcion Pedregal-Tercero, Lilly S.A., Avenida de la Industria 30,
28108 Alcobendas, Madrid, ES
Miguel Angel Toledo Escribano, Lilly S. A., Avenida de la Industria 30,
28108 Alcobendas, Madrid, ES
Hraste & Partneri odvjetničko društvo, 10000 Zagreb, HR

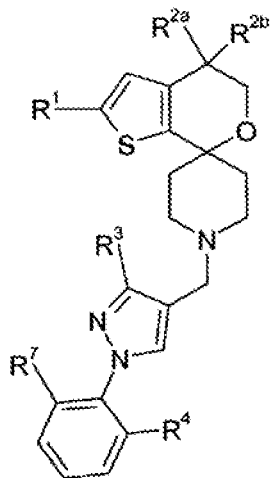
(74) Zastupnik:

(54) Naziv izuma: **SPOJEVI SPIROPIPERIDONA KAO ANTAGONISTI RECEPTORA ORL-1**

HR P20130969 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Spoj formule:



naznačen time što

R¹ je fluor ili klor;

svaki od R²ᵃ i R²ᵇ je vodik ili fluor;

R³ je vodik, metil, hidroksimetil ili (C₁-C₃) alkoksimetil;

R⁴ se bira iz skupine koju čine fluor, klor, cijano, cijanometil, (C₁-C₃) alkil, ciklopropil, hidroksimetil, metoksi, metoksimetil, aminokarboniloksimetil, metilaminokarboniloksimetil, dimetilaminokarboniloksimetil, metilkarbonil, aminokarbonil, metilaminokarbonil, dimetilaminokarbonil, -NR⁵R⁶, -CH₂-NR⁵R⁶, morfolin-4-il, morfolin-4-ilmetil, Ar¹, -CH₂Ar¹, 3,3-difluorazetidin-1-ilmetil, pirolidin-1-ilmetil, 1-aminociklopropil, 1-metilaminociklopropil i 1-dimetilaminociklopropil;

R⁵ je vodik, C₁-C₄ alkil, ciklopropil, hidroksietil, metoksietil, -C(O)CH₃ ili -C(O)O(C₁-C₃) alkil;

R⁶ je vodik ili metil;

R⁷ je vodik, fluor, klor, metil, hidroksimetil ili metoksi; i

Ar¹ je ostatak kojeg se bira iz skupine koju čine imidizol-1-il, imidizol-2-il, 2-metilimidizol-1-il, 1-metilimidizol-2-il i 1,2,4-triazol-3-il; ili

njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

2. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što R¹ je klor, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

3. Spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 ili 2, **naznačen time** što svaki od R²ᵃ i R²ᵇ je fluor, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

4. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što R¹ je fluor, a svaki od R²ᵃ i R²ᵇ je vodik, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

5. Spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 4, **naznačen time** što R³ je metil, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

6. Spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 5, **naznačen time** što R⁴ je fluor, hidroksimetil, metoksimetil, metilkarbonil ili 2-metilimidazol-1-il, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

7. Spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 6, **naznačen time** što R⁷ je fluor, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

8. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što ga se bira iz skupine koju čine
2-klor-1'-[[1-(2,6-difluorfenil)-3-metilpirazol-4-il]metil]-4,4-difluorspiro[5H-tieno[2,3-c]piran-7,4'-piperidin],
1-(2-(4-((2'-klor-4',4'-difluor-4',5'-dihidrospiro[piperidin-4,7'-tieno[2,3-c]piran]-1-il)metil)-3-metil-1H-pirazol-1-il)-3-fluorfenil)etanon,
2-klor-4,4-difluor-1'-[[1-[2-fluor-6-(2-metilimidazol-1-il)fenil]-3-metilpirazol-4-il]metil]spiro[5H-tieno[2,3-c]piran-7,4'-piperidin] i

[4-[(2-klor-4,4-difluorspiro[5*H*-tieno[2,3-*c*]piran-7,4'-piperidin]-1'-il)metil]-1-(2,6-difluorfenil)pirazol-3-il]
metanol, ili
njihove farmaceutske prihvatljive soli.

- 5 9. Farmaceutski pripravak, **naznačen time** što sadrži spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 8, ili njegovu farmaceutske prihvatljivu sol, i farmaceutske prihvatljivu podlogu, razrjeđivač ili pomoćnu tvar.
- 10 10. Farmaceutski pripravak u skladu s patentnim zahtjevom 9, **naznačen time** što dodatno sadrži najmanje jedan dodatni terapijski sastojak.
- 11 11. Farmaceutski pripravak u skladu s patentnim zahtjevom 10, **naznačen time** što je dodatni terapijski sastojak SSRI antidepressiv.
- 10 12. Spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 8, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi u terapiji.
- 13 13. Spoj ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 12, u liječenju pretilosti ili prekomjerne tjelesne težine kod čovjeka.
- 15 14. Spoj ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 12, u liječenju migrene.
- 15 15. Spoj ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 12, u liječenju depresije.