



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO



(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20191932 T1

HR P20191932 T1

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

(51) MKP:

C07F 5/04 (2006.01)
C07F 5/02 (2006.01)
A01N 55/08 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 24.01.2020.

(21) Broj predmeta: P20191932T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 23.10.2019.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2015028613
Datum podnošenja međunarodne prijave: 30.04.2015.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 15788682.1
Datum podnošenja europske prijave patenta: 30.04.2015.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2015171430
Datum međunarodne objave: 12.11.2015.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3140310 A1
Datum objave europske prijave patenta: 15.03.2017.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3140310 B1
Datum objave europskog patenta: 07.08.2019.

(31) Broj prve prijave: 201461988690 P (32) Datum podnošenja prve prijave: 05.05.2014. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelj patenta: **Rempex Pharmaceuticals, Inc., 300 TriState International, Suite 272,
Lincolnshire, IL, US**

(72) Izumitelji: **Scott Hecker, 4802 Rancho Viejo Dr., Del Mar, CA 92014, US**
Serge Boyer, 5112 Castle Hills Drive, San Diego, CA 92109, US

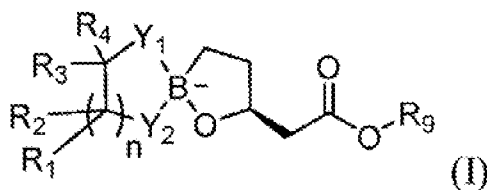
(74) Zastupnik: **ZMP IP d.o.o., 10000 Zagreb, HR**

(54) Naziv izuma: **SINTEZA BORONATNIH SOLI I NJIHOVE UPORABE**

HR P20191932 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

1. Spoj formule (I)



5 ili njegova sol, u kojem:

n je 0 ili 1;

Y₁ je O ili N⁺R₅R₆;

Y₂ je O ili NR₁₀;

R₁ i R₂ su neovisno izabrani iz grupe koja se sastoji od H, izborno supstituiranog fenila i izborno supstituiranog C₁₋₄ alkila, ili R₁ i R₂ zajedno s atomima za koje su vezani, formiraju =O;

R₃ je izabran iz grupe koja se sastoji od H, izborno supstituiranog fenila i izborno supstituiranog C₁₋₄ alkila, ili R₃ i R₅, zajedno s atomima za koje su vezani, formiraju heteroaril prsten; ili R₃ i R₄ zajedno s atomima za koje su vezani, formiraju =O;

R₄, R₅, R₆, i R₁₀ su neovisno izabrani iz grupe koja se sastoji od H, izborno supstituiranog fenila i izborno supstituiranog C₁₋₄ alkila; i

R₉ je izabran iz grupe koja se sastoji od izborno supstituiranog C₁-C₁₂ alkila, izborno supstituiranog C₃-C₈ cikloalkila, izborno supstituiranog C₂-C₁₂ alkenila, izborno supstituiranog C₂-C₁₂ alkinila, izborno supstituiranog arila i izborno supstituiranog heteroarila.

2. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, naznačen time što Y₁ je O.

3. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, naznačen time što Y₁ je N⁺R₅R₆.

4. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, naznačen time što Y₂ je O.

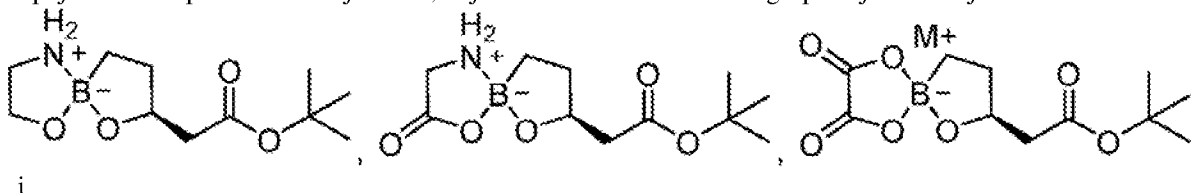
5. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, naznačen time što Y₂ je NR₁₀.

6. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, naznačen time što R₁ i R₂ su oba H.

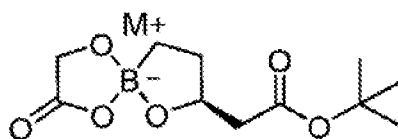
7. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, naznačen time što R₁ i R₂ zajedno s atomima za koje su vezani, formiraju =O i gdje R₃ i R₄ zajedno s atomima za koje su vezani, formiraju =O.

8. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, naznačen time što R₃ i R₄ su oba H.

9. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, koji ima strukturu izabranu iz grupe koja se sastoji od:



i

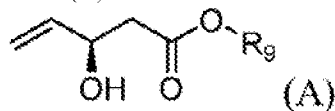


gdje:

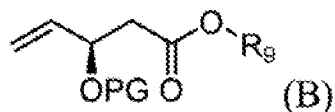
M⁺ je kation izabran iz grupe koja se sastoji od litija, natrija, kalija, kalcija, amonija, trietilamonija i aluminija.

10. Postupak za pripremu spoja formule (I), ili njegove soli, koji sadrži korake:

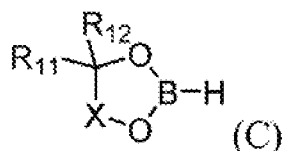
(a) zaštite hidroksi grupe spoja formule (A):



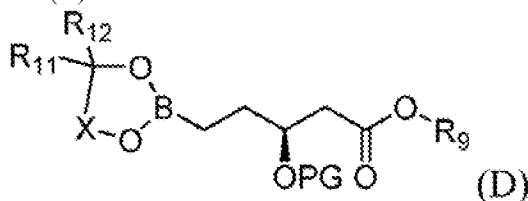
da bi se formirao spoj formule (B):



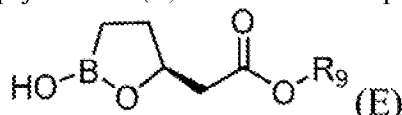
(b) reakcije spoja formule (B) sa spojem formule (C):



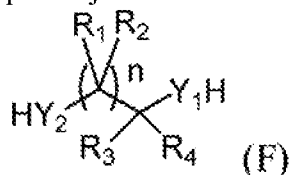
da bi se formirao spoj formule (D):



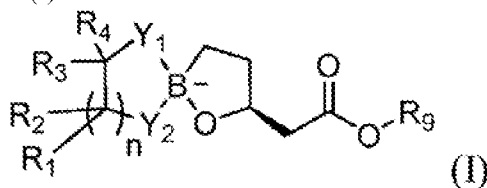
(c) uklanjanja zaštitne grupe spoja formule (D) da bi se formirao spoj formule (E):



(d) reakcije spoja formule (E) s kompleksirajućim sredstvom formule (F):



da bi se formirao spoj formule (I):



gdje:

PG je hidroksil zaštitna grupa;

n je 0 ili 1;

Y₁ je O ili N⁺R₅R₆

Y₂ je O ili NR₁₀;

R₁ i R₂ su neovisno izabrani iz grupe koja se sastoji od H, izborno supstituiranog fenila i izborno supstituiranog C₁₋₄ alkila, ili R₁ i R₂ zajedno s atomima za koje su vezani, formiraju =O;

R₃ je izabran iz grupe koja se sastoji od H, izborno supstituiranog fenila i izborno supstituiranog C₁₋₄alkila ili R₁ i R₃ zajedno s atomima za koje su vezani formiraju aril ili heteroaril prsten; ili

R₃ i R₄ zajedno s atomima za koje su vezani, formiraju =O;

R₄, R₅, R₆, i R₁₀ su neovisno izabrani iz grupe koja se sastoji od H, izborno supstituiranog fenila i izborno supstituiranog C₁₋₄ alkila;

R₉ je izborno supstituirani C₁-C₁₂ alkil, izborno supstituirani C₃-C₈ cikloalkil, izborno supstituirani C₂-C₁₂ alkenil, izborno supstituirani C₂-C₁₂ alkinil, izborno supstituirani aril ili izborno supstituirani heteroaril;

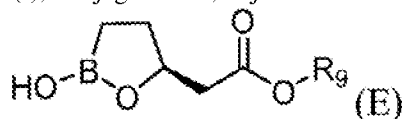
R₁₁ je izabran iz grupe koja se sastoji od supstituiranih ili nesupstituiranih varijanti od sljedećih: C₁-C₁₂ alkil, C₂-C₁₂ alkenil, C₂-C₁₂ alkinil, C₃-C₁₂ cikloalkil, C₃-C₁₂ cikloalkenil, C₃-C₁₂ cikloalkinil, C₃-C₁₂ heterociklil, aril, heteroaril, arilalkil, heteroarilalkil i (cikloalkil)alkil, i

X je izabran iz grupe koja se sastoji od supstituiranih ili nesupstituiranih varijanti od sljedećih: C₁-C₄ alkil, C₂-C₄ alkenil i C₂-C₄ alkinil; i

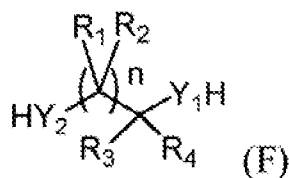
R₁₂ je izabran iz grupe koja se sastoji od supstituiranih ili nesupstituiranih varijanti od sljedećih: C₁-C₁₂ alkil, C₂-C₁₂ alkenil, C₂-C₁₂ alkinil, C₃-C₁₂ cikloalkil, C₃-C₁₂ cikloalkenil, C₃-C₁₂ cikloalkinil, C₃-C₁₂ heterociklil, aril, heteroaril, arilalkil, heteroarilalkil i (cikloalkil)alkil.

11. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 10, naznačen time što R₉ je izborno supstituirani C₁-C₁₂ alkil.

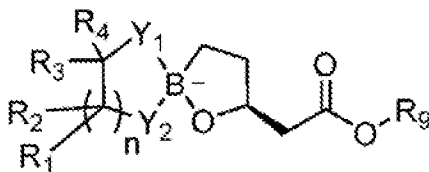
12. Postupak za pripremu spoja formule (I), ili njegove soli, koji sadrži korake: reakcije spoja formule (E):



s kompleksirajućim sredstvom formule (F):



da bi se formirao spoj formule (I):



gdje

- 5 n je 0 ili 1,
 Y₁ je O ili N⁺R₅R₆
 Y₂ = O ili NR₁₀,
 R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, i R₁₀ su neovisno izabrani iz grupe koja se sastoji od H, izborno supstituiranog fenila i izborno supstituiranog C₁₋₄ alkila; ili
- 10 pri čemu neovisno dva geminalna R₁, R₂, R₃, R₄ zajedno s atomima za koje su vezani, formiraju =O; i
 pri čemu R₉ je izborno supstituirani C₁-C₁₂ alkil, izborno supstituirani C₃-C₈ cikloalkil, izborno supstituirani C₂-C₁₂ alkenil, izborno supstituirani C₂-C₁₂ alkinil, izborno supstituirani aril ili izborno supstituirani heteroaril.
13. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 12, naznačen time što R₁ i R₂ zajedno s atomima za koje su vezani, formiraju =O i naznačen time da R₃ i R₄ zajedno s atomima za koje su vezani, formiraju =O.