

(19)



REPUBLIKA SLOVENIJA
MINISTRSTVO ZA GOSPODARSKI RAZVOJ IN TEHNOLOGIJO
URAD RS ZA INTELEKTUALNO LASTNINO

(10)

SI/EP 2975025 T1

(12)

PREVOD ZAHTEVKOV EVROPSKEGA PATENTA

(21) Številka predmeta: **201131491**

(51) Int. Cl. (2018.01)

(22) Datum prijave: **15.06.2011**

C07D 213/00	C07D 401/00
C07D 241/00	A61K 31/00
A61P 19/00	A61P 9/00
C07D 403/00	C07D 405/00
C07D 239/00	C07D 417/00

(46) Datum objave prevoda zahtevkov:

31.08.2018

(97) Objava evropske patentne prijave:

EP 2975025 A1, 20.01.2016

(30) Prednostna pravica:

16.06.2010 US 355491 P

(97) Objava evropskega patenta:

EP 2975025 B1, 04.04.2018

(96) Evropska patentna prijava:

15.06.2011 EP 15166826.6

(72) Izumitelji: **Ouk Samedy, San Diego, CA California 92130, US;**
Gunic Esmir, San Diego, CA California 92129, US;
Vernier Jean-Michel, San Diego, CA California 92121, US

(73) Imetnik: **Ardea Biosciences, Inc.,**
9390 Towne Centre Drive, San Diego CA 92121, US

(74) Zastopnik: **dr. Jure Marn, univ.dipl.inž., univ.dipl.prav., Ljubljanska ulica 9, 2000 Maribor, SI**

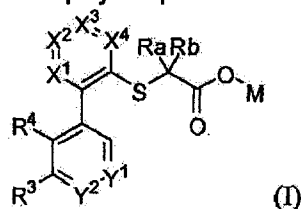
(54) **TIOACETAT SPOJINE, SESTAVKI IN POSTOPKI UPORABE**

SI/EP 2975025 T1

EP2975025

Patentni zahtevki

1. Spojina po formuli (I):



pri čemer:

R^a in R^b sta izbrana izmed H, halogen, C₁ do C₆ alkil; ali R^a in R^b, skupaj z ogljikovim atomom, na katerega sta vezana, tvorita 3-, 4-, 5- ali 6-členski obroč, opcijsko vsebujoč enega ali dva heteroatoma, izbrana izmed O, N in S;

M je H, C₁₋₃ alkil ali farmacevtsko sprejemljiv kation;

X¹ je N, CH, C(halogen) ali C(C₁-C₄ alkil);

X^2 je N ali CH;

X³ je N, CH, C(halogen) ali C(C₁-C₄ alkil);

X^4 je N ali CH; pri čemer je eden od X^1, X^2, X^3 ali X^4 N;

Y^1 je N ali CR^1 ;

Y^2 je N ali CR^2 ;

R¹ je H, CF₃, CH₃, OCH₃, F ali Cl;

R² je H, metil, etil, propil, izopropil, terc-butil, ciklopropil, ciklobutil, CF₃, OH, OCH₃, etoksi, SH, SCH₃, SCH₂CH₃, CH₂OH, C(CH₃)₂OH, Cl, F, CN, COOH, COOR^{2'}, CONH₂, CONHR^{2'} ali SO₂NH₂; pri čemer je R^{2'} H ali C₁₋₃ alkil;

R³ je H, halogen, -CN, C₁ do C₆ alkil, C₁ do C₆ alkoksi; in

R⁴ je H, halogen, -CN, C₁ do C₆ alkil, C₁ do C₆ alkoksi; ali

R³ in R⁴ skupaj z ogljikovimi atomi, na katere sta vezana, tvorita opcijsko substituiran 5- ali 6-členski obroč, opcijsko vsebujoč enega ali dva

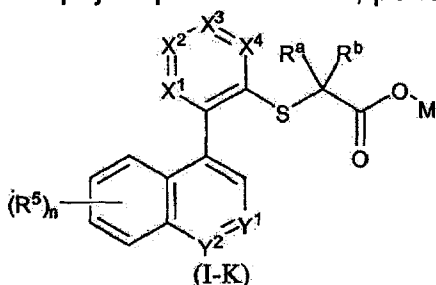
heteroatoma, izbrana izmed O, N in S, pri čemer je omenjeni 5- ali 6-členski obroč nasičen, nenasičen, ali aromatski obroč;

od pogojem, da spojina s formulo (I) ni 1-(3-(4-cianofenil)piridin-4-iltio) ciklopropankarboksilna kislina.

2. Spojina po zahtevku 1, pri čemer
 R^3 je H, CH_3 , OCH_3 , CF_3 , F ali Cl; in
 R^4 je H, CH_3 , OCH_3 , CF_3 , F ali Cl.

3. Spojina po zahtevku 1, pri čemer R^3 in R^4 skupaj z ogljikovimi atomi, na katere sta vezana, tvorita opsijsko substituiran 5- ali 6-členski obroč, opsijsko vsebujoč enega ali dva heteroatoma, izbrana izmed O, N in S, pri čemer je omenjeni 5- ali 6-členski obroč morda nasičen, nenasičen ali aromatski obroč.

4. Spojina po zahtevku 3, po formuli (I-K):

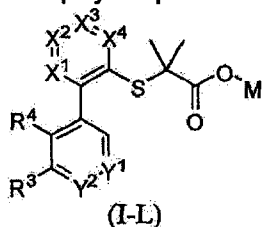


pri čemer je n 1, 2, 3 ali 4; in

vsak R^5 je neodvisno izbran izmed H, metila, etila, propila, izopropila, terc-butila, ciklopropila, ciklobutila, CF_3 , OH, OCH_3 , etoksi, SH, SCH_3 , SCH_2CH_3 , CH_2OH , $C(CH_3)_2OH$, Cl, F, CN, COOH, $COOR^{5'}$, $CONCH_2$, $CONHR^{5'}$ ali SO_2NH_2 ; pri čemer $R^{5'}$ je H ali C_{1-3} alkil.

5. Spojina po zahtevku 1, pri čemer
 R^a je H ali CH_3 ; in
 R^b je H ali CH_3 .

6. Spojina po zahtevku 5, po formuli (I-L):



pri čemer

X^1 je CH;

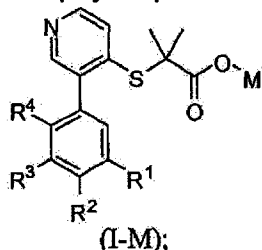
X^2 je N;

X^3 je CH; in

X^4 je CH; in opcijsko, pri čemer je Y^1 CR¹ in

Y^2 je CR².

7. Spojina po zahtevku 6, po formuli (I-M):



in opcijsko, pri čemer so R¹, R³ in R⁴ vsi H.

8. Spojina po zahtevku 1, pri čemer R^a in R^b skupaj z ogljikovim atomom, na katerega sta vezana, tvorita 3-, 4-, 5- ali 6-členski obroč, opcijsko vsebujoč enega ali dva heteroatoma, izbrana izmed O, N in S.

9. Spojina po zahtevku 1, pri čemer M je H.

10. Spojina s formulo (I) po kateremkoli od zahtevkov 1 do 9 za uporabo pri zniževanju ravni sečne kisline v serumu pri človeku, zdravljenju hiperurikemije pri človeku s protinom, zdravljenju hiperurikemije pri človeku, zdravljenju protina pri človeku, zdravljenju ali preprečevanju stanja, označenem z nenormalnim nivojem sečne kisline v tkivu ali organu pri posamezniku, in opcijsko, pri čemer se spojina uporablja v kombinaciji z drugim sredstvom, učinkovitim za zdravljenje protina.

11. Spojina po formuli (I), kot določena po zahtevkih 1-9 za uporabo po zahtevku 10, pri čemer je stanje protin, ponavljajoči napad protina, protinski artritis, hiperurikemija, hipertenzija, kardiovaskularna bolezen, koronarna srčna bolezen, Lesch -Nyhanov sindrom, Kelley-Seegmillerjev sindrom, ledvična bolezen, ledvični kamni, odpoved ledvic, vnetje sklepov, artritis, urolitiza, plumbizem, hiperparatiroidizem, psoriza, sarkoidoza, pomanjkanje hipoksantin-gvaninfosforiboziltransferaze (HPRT) ali njih kombinacija.

12. Spojina po formuli (I), kot določena po zahtevkih 1-9 za uporabo po zahtevku 10, pri čemer je drugo sredstvo inhibitor URAT 1, inhibitor ksantin oksidaze, ksantin dehidrogenaza, inhibitor ksantin oksidoreduktaze ali njih kombinacije; ali, pri čemer je drugo sredstvo alopurinol, febuksostat, FYX-051 ali njih kombinacije.