



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20110964 T1

HR P20110964 T1

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

(51) MKP:

C07D 413/04 (2006.01)
A61K 31/454 (2006.01)
A61P 3/04 (2006.01)
A61P 3/10 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 31.01.2012.

(21) Broj predmeta: P20110964T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 21.12.2011.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/GB2008050011
Datum podnošenja međunarodne prijave: 04.01.2008.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 08700184.8
Datum podnošenja europske prijave patenta: 04.01.2008.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2008081205
Datum međunarodne objave: 10.07.2008.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2114931 A1
Datum objave europske prijave patenta: 11.11.2009.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2114931 B1
Datum objave europskog patenta: 02.11.2011.

(31) Broj prve prijave: 0700124
0708740
0719762

(32) Datum podnošenja prve prijave: 04.01.2007.
08.05.2007.
10.10.2007.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: GB
GB
GB

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelji:

PROSIDION LTD, Windrush Court Watlington Road, OX4 6LT Oxford, GB
Lisa Sarah Bertram, Prosidion Limited, Windrush Court, Watlington Road, Oxford, Oxfordshire OX4 6LT, GB
Matthew Colin Thor Fyfe, Prosidion Limited, Windrush Court, Watlington Road, Oxford, Oxfordshire OX4 6LT, GB
Revathy Perpetua Jeevaratnam, Prosidion Limited, Windrush Court, Watlington Road, Oxford, Oxfordshire OX4 6LT, GB
John Keily, Prosidion Limited, Windrush Court, Watlington Road, Oxford, Oxfordshire OX4 6LT, GB
Simon Andrew Swain, Prosidion Limited, Windrush Court, Watlington Road, Watlington, Oxfordshire OX4 6LT, GB

(74) Zastupnik:

PETOŠEVIĆ d.o.o., 10000 Zagreb, HR

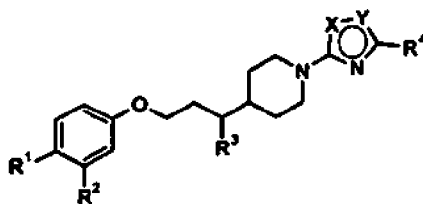
(54) Naziv izuma:

PIPERIDINSKI AGONISTI GPCR-a

HR P20110964 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

- 5 1. Spoj formule (I), ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol:



(I)

naznačen time, da jedan između X i Y predstavlja O, a drugi predstavlja N;

R¹ je -CONHR⁵;

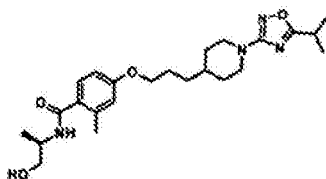
R² je vodik, halo ili metil;

10 R³ je vodik ili metil;

R⁴ je C₂₋₅alkil; a

R⁵ je vodik, C₁₋₃ alkil ili C₂₋₃ alkil supstituiran s hidroksi.

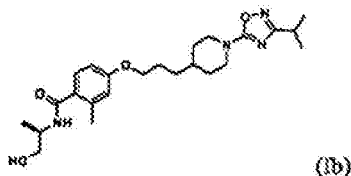
2. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, **naznačen time**, da X je O.
3. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, **naznačen time**, da Y je O.
- 15 4. Spoj u skladu s jednim od patentnih zahtjeva 1 do 3, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, **naznačen time**, da R² je vodik, fluoro, kloro ili metil.
5. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 4, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, **naznačen time**, da R² je vodik.
6. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 4, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, **naznačen time**, da R² je fluoro.
7. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 4, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, **naznačen time**, da R² je kloro.
- 20 8. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 4, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, **naznačen time**, da R² je metil.
9. Spoj u skladu s jednim od patentnih zahtjeva 1 do 8, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, **naznačen time**, da R³ je vodik.
10. Spoj u skladu s jednim od patentnih zahtjeva 1 do 8, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, **naznačen time**, da R³ je metil.
- 25 11. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 10, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, **naznačen time**, da R³ je metil, a dobiveni stereocentar ima (R)-konfiguraciju.
12. Spoj u skladu s jednim od patentnih zahtjeva 1 do 11, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, **naznačen time**, da R⁴ je C₃₋₄ alkil.
13. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 12, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, **naznačen time**, da R⁴ je n-propil, izopropil ili tert-butil.
- 30 14. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 13, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, **naznačen time**, da R⁴ je C₃ alkil.
15. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 14, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, **naznačen time**, da R⁴ je izopropil.
16. Spoj u skladu s jednim od patentnih zahtjeva 1 do 15, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, **naznačen time**, da R⁵ je C₁₋₃ alkil ili C₂₋₃ alkil supstituiran s hidroksi.
- 35 17. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 16, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, **naznačen time**, da R⁵ je C₂₋₃ alkil supstituiran s hidroksi.
18. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 17, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, **naznačen time**, da R⁵ je 2-hidroksietil, 2-hidroksi-1-metiletil, 2,3-dihidroksipropil ili 2-hidroksi,-1-hidroksimetiletil.
- 40 19. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 18, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, **naznačen time**, da R⁵ je 2-hidroksi-1-metiletil.
20. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 18, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, **naznačen time**, da R⁵ je (R) 2-hidroksi-1 -metiletil.
21. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time**, da je to spoj



(Ia)

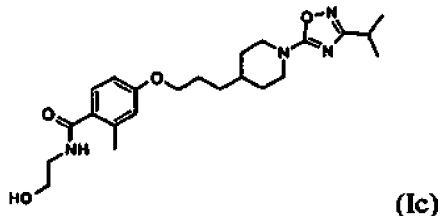
45 ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol.

22. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time**, da je to spoj



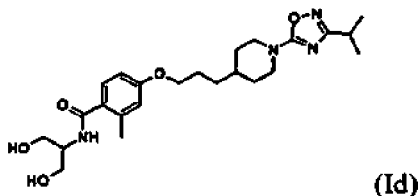
ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol.

23. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time**, da je to spoj



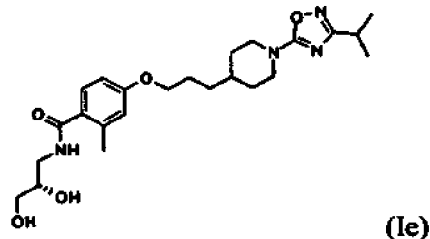
ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol.

24. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time**, da te spoj is



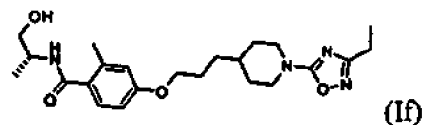
ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol.

25. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time**, da je to spoj



ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol.

26. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time**, da je to spoj



ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

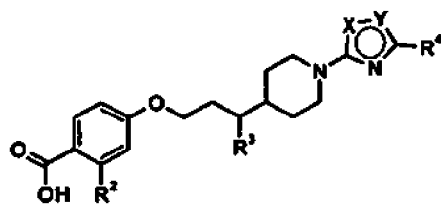
27. Farmaceutski pripravak **naznačen time**, da sadrži spoj u skladu s jednim od patentnih zahtjeva 1 do 26, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol i farmaceutski prihvatljiv nosač.

28. Spoj u skladu s jednim od patentnih zahtjeva 1 do 26, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, **naznačen time**, da se koristi za regulaciju sitosti, za liječenje pretilosti, za liječenje dijabetesa ili za liječenje metaboličkog sindroma (sindrom X), poremećene tolerancije na glukozu, hiperlipidemije, hipertrigliceridemije, hiperkolesterolemije, niskih razina HDL ili hipertenzije.

29. Spoj u skladu s jednim od patentnih zahtjeva 1 do 26, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, **naznačen time**, da se koristi kao lijek.

30. Spoj u skladu s jednim od patentnih zahtjeva 1 do 26, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, **naznačen time**, da se koristi za proizvodnju lijeka za liječenje ili sprječavanje bolesti ili stanja kako su definirani u patentnom zahtjevu 28.

31. Postupak za proizvodnju spoja formule (I) kako je definiran u patentnom zahtjevu 1, ili njegova farmaceutska prihvatljiva sol, **naznačen time**, da taj postupak uključuje sprežanje spoja formule (XIV):



(XIV)

s aminom formule R^5NH_2 , pri čemu su R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , X i Y definirani jednako kao u patentnom zahtjevu 1.