

(19) Organização Mundial da
Propriedade Intelectual
Secretaria Internacional



(10) Número de Publicação Internacional
WO 2017/193180 A8

(43) Data de Publicação Internacional
16 de Novembro de 2017 (16.11.2017) **WIPO | PCT**

(51) Classificação Internacional de Patentes:

C07D 405/14 (2006.01) *A61K 31/4192* (2006.01)
C07D 403/06 (2006.01) *A61P 31/18* (2006.01)
C07D 209/34 (2006.01) *A61P 31/12* (2006.01)
A61K 31/513 (2006.01)

(21) Número do Pedido Internacional:

PCT/BR2016/000050

(22) Data do Depósito Internacional:

10 de Maio de 2016 (10.05.2016)

(25) Língua de Depósito Internacional: Português

(26) Língua de Publicação: Português

(71) Requerente: **FUNDAÇÃO OSWALDO CRUZ** [BR/BR];
Avenida Brasil 4365, Manguinhos, 21045-900 Rio de Janeiro, RJ (BR).

(72) Inventores: **BOECHAT, Nubia**; Rua Nilkon Viana 88,
Camboinhas, Niterói, Rio de Janeiro, CEP 24358-000 (BR).

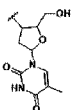
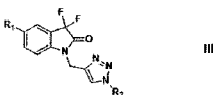
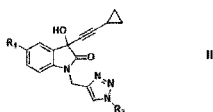
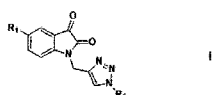
BASTOS, Mônica Macedo; Rua Guaranesia 37, apto. 102,
Vila Valqueire, Rio de Janeiro, RJ, CEP 21330-550 (BR).
LOPES E SOUZA, Thiago Moreno; Rua Cardo Santo
125, Bl. II, apto. 406, Vila Valqueire, Rio de Janeiro, RJ,
CEP 21330-210 (BR). **LEITE, Débora Inácio**; Rua Sil-
va Vale 952, casa 3, Cavalcante, Rio de Janeiro, RJ, CEP
21370-360 (BR). **BERNARDINO, Alice Maria Rolim**;
Rua Adalgisa Monteiro 568, Itaipú, Niterói, Rio de Janeiro,
CEP 24342-110 (BR).

(74) Mandatário: **KASZNAR LEONARDOS PROPRIEDA-
DE INTELECTUAL**; Rua Teófilo Otoni 63, 5th 8th floors,
CEP: 20090-080, Rio de Janeiro, RJ (BR).

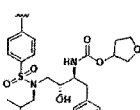
(81) Estados Designados (sem indicação contrária, para todos
os tipos de proteção nacional existentes): AE, AG, AL, AM,
AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ,
CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ,
EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR,
HU, ID, IL, IN, IR, IS, JP, KE, KG, KN, KP, KR, KZ, LA,

(54) Title: ISATIN-DERIVED COMPOUNDS, USE OF THE COMPOUNDS FOR THE TREATMENT OF AIDS AND METHOD
OF TREATMENT USING THESE COMPOUNDS

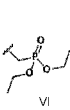
(54) Título: COMPOSTOS DERIVADOS DE ISATINA, USO DOS COMPOSTOS NO TRATAMENTO DE AIDS E MÉTODO DE
TRATAMENTO USANDO DITOS COMPOSTOS



zidovudina
AA



amprenavir
BB



fosfonato acrílico
CC

AA zidovudine
BB amprenavir
CC acrylic phosphonate

(57) Abstract: The present invention relates to HIV-inhibiting compounds consisting of isatin derivatives of formulae I, II and III, as represented below (formulae I, II and III), wherein, in the formulae I, II and III, R₁ is selected from H, CH₃ or Cl, R₂ is selected from one of the following radicals: zidovudine, amprenavir or an acyclic phosphonate chain, these compounds being represented below. The present invention also relates to the use and to the treatment method using the compounds of formulae I, II and III. The compounds according to the present invention are also used for the treatment of infection caused by HBV or co-infections caused by HIV and HBV.

(57) Resumo: A presente invenção se refere a compostos inibidores do HIV consistindo de derivados de isatina de fórmulas I, II e III, conforme representados a seguir (fórmulas I, II e III) onde nas fórmulas I, II e III, R₁ é selecionado dentre H, CH₃ ou Cl R₂ é selecionado dentre um dos seguintes radicais: zidovudina, amprenavir ou uma cadeia fosfonato acíclica, representados a seguir. A presente invenção também consiste do uso e do método de tratamento usando os compostos de fórmulas I, II e III. Os compostos da presente invenção também são usados no tratamento de uma infecção causada pelo HBV ou na coinfeção causada pelo HIV e HBV.

LC, LK, LR, LS, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN,
MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE,
PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE,
SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ,
UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

- (84) Estados Designados** (*sem indicação contrária, para todos os tipos de proteção regional existentes*): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, ST, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), Eurasiático (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), Europeu (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Publicado:

— *com relatório de pesquisa internacional (Art. 21(3))*

(48) Data de publicação da presente versão corrigida:

22 de Novembro de 2018 (22.11.2018)

(15) Informação sobre Correção:

see Notice of 22 de Novembro de 2018 (22.11.2018)