



HU000025565T4

(19) **HU****MAGYARORSZÁG**
Szellemi Tulajdon Nemzeti Hivatala(11) Lajstromszám: **E 025 565**(13) **T4****EURÓPAI SZABADALOM**
SZÖVEGÉNEK FORDÍTÁSA(21) Magyar ügyszám: **E 07 836007**(22) A bejelentés napja: **2007. 07. 06.**(96) Az európai bejelentés bejelentési száma:
EP 20070836007(97) Az európai bejelentés közzétételi adatai:
EP 2049506 A2 **2008. 01. 24.**(97) Az európai szabadalom megadásának meghirdetési adatai:
EP 2049506 B1 **2015. 06. 17.**(51) Int. Cl.: **C07D 277/28** (2006.01)**A61K 314/27** (2006.01)**C07D 417/14** (2006.01)**A61P 31/12** (2006.01)

(86) A nemzetközi (PCT) bejelentési szám:

PCT/US 07/015604

(87) A nemzetközi közzétételi szám:

WO 08010921

(30) Elsőbbségi adatok:

903228 P	2007. 02. 23.	US
832371 P	2006. 07. 21.	US
819315 P	2006. 07. 07.	US

(72) Feltaláló(k):

DESAI, Manoj C., Pleasant Hill, CA 94523 (US)
HONG, Allen Yu, San Jose, CA 95129 (US)
LIU, Hongtao, Cupertino, CA 95014 (US)
XU, Lianhong, Palo Alto, CA 94303 (US)
VIVIAN, Randall W., San Mateo, CA 94404 (US)

(73) Jogosult(ak):

Gilead Sciences, Inc., Foster City, CA 94404
(US)

(74) Képviselő:

Mester Tamás, SWORKS Nemzetközi
Szabadalmi Ügyvivői Iroda Kft., Budapest

(54)

Therapeutikák farmakokinetikai tulajdonságainak modulátorai

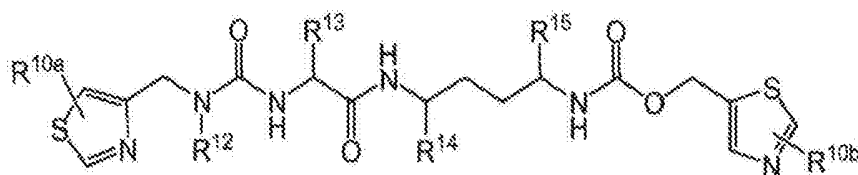
Az európai szabadalom ellen, megadásának az Európai Szabadalmi Közlönyben való meghirdetésétől számított kilenc hónapon belül, felszólalást lehet benyújtani az Európai Szabadalmi Hivatalnál. (Európai Szabadalmi Egyezmény 99. cikk (1))

A kijavított fordítást a szabadalmas az 1995. évi XXXIII. törvény 84/H. §-a szerint nyújtotta be. A fordítás tartalmi helyességét a Magyar Szabadalmi Hivatal nem vizsgálta.

A kijavított fordítás szerinti oltalom a Magyar Szabadalmi Hivatal által közölt hatósági tájékoztatástól (fordításkijavítás közzétételi napjától) hatályos. (1995. évi XXXIII. törvény 84/K § (1))

Szabadalmi igénypontok

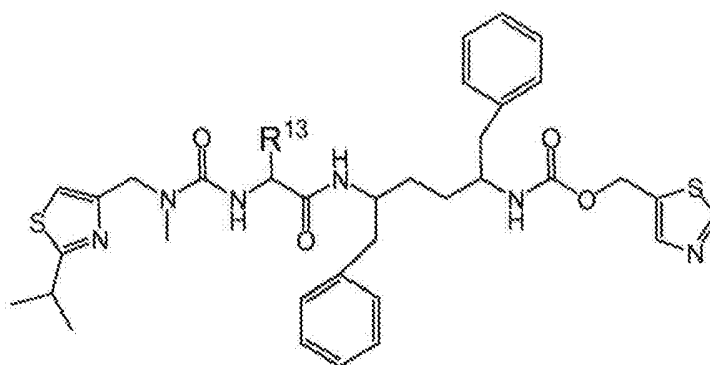
1. Képlet IIB szerinti vegyület:



Formula IIB

vagy annak gyógyszerészetileg elfogadható sója, szolvátja, sztereoizomere és/vagy észtere, ahol:

- 5 R^{10a} és R^{10b} mindegyik függetlenül H vagy $-C_{1-4}$ alkil;
 R^{12} H vagy $-CH_3$;
 R^{13} H, $-C_{1-4}$ alkil, $-(CH_2)_{0-3}CR^{17}R^{18}OR^{19}$, $-(CH_2)_{0-3}CR^{17}R^{18}NR^{20}R^{21}$, $-(CH_2)_{0-3}CR^{17}R^{18}NR^{17}C(O)NR^{20}R^{21}$, $-(CH_2)_{1-3}C(O)R^{22}$, $-(CH_2)_{1-3}S(O)_2R^{22}$ vagy $-(CH_2)_{1-3}-R^{23}$;
 R^{14} és R^{15} mindegyik függetlenül H, $-C_{1-4}$ alkil vagy arilalkil;
 10 R^{17} és R^{18} mindegyik függetlenül H vagy $-C_{1-3}$ alkil;
 R^{19} H, $-C_{1-4}$ alkil vagy arilalkil;
 R^{20} és R^{21} mindegyik függetlenül H, $-C_{1-3}$ alkil, $-C(O)R^{17}$ vagy $-S(O)_2R^{17}$; vagy
 R^{20} és R^{21} , együttvéve a nitrogén atommal, amelyhez kapcsolódnak,
 szubsztituálatlan vagy szubsztituált 5-6 tagú heterociklil gyűrűt alkotnak, amely tartalmaz 1-2
 15 heteroatomot, amely ki van választva a következőkből álló csoportból: N és O;
 R^{22} H, $-C_{1-3}$ alkil, $-OR^{19}$ vagy $-NR^{20}R^{21}$; és
 R^{23} szubsztituálatlan vagy szubsztituált 5-6 tagú heterociklil gyűrű, amely tartalmaz 1-2
 heteroatomot, amely ki van választva a következőkből álló csoportból: N és O;
 ahol a szubsztituálatlan vagy szubsztituált 5-6 tagú heterociklil gyűrű, amelyet R^{20} és R^{21} alkot és
 20 a R^{23} szubsztituálatlan vagy szubsztituált 5-6 tagú heterociklil gyűrűje mindegyik függetlenül
 szubsztituálatlan vagy szubsztituált egy C_{1-2} alkillel.
2. Az 1. igénypont szerinti vegyület, ahol:
 R^{13} $-(CH_2)_{0-3}CR^{17}R^{18}NR^{20}R^{21}$, $-(CH_2)_{0-3}CR^{17}R^{18}NR^{17}C(O)NR^{20}R^{21}$ vagy $-(CH_2)_{1-3}-R^{23}$.
3. A 2. igénypont szerinti vegyület, ahol:
 25 R^{13} $-(CH_2)_{0-3}CR^{17}R^{18}NR^{20}R^{21}$ vagy $-(CH_2)_{0-3}CR^{17}R^{18}NR^{17}C(O)-NR^{20}R^{21}$.
4. A képlet IIC 1. igénypont szerinti vegyülete:



Formula IIC

vagy annak gyógyszerészetileg elfogadható sója, szolvátja, sztereoizomere és/vagy észtere, ahol:

R^{12} H, $-C_{1-4}$ alkil, $-(CH_2)_{0-1}CR^{17}R^{18}OR^{19}$, $-(CH_2)_{0-3}CR^{17}R^{18}NR^{20}R^{21}$, $-(CH_2)_0-3CR^{17}R^{18}NR^{17}C(O)NR^{20}R^{21}$, $-(CH_2)_{1-3}C(O)R^{22}$ vagy $-(CH_2)_{1-3}-R^{23}$;

5 R^{17} és R^{18} mindegyik függetlenül H vagy C_{1-3} alkil;

R^{19} H, $-C_{1-4}$ alkil vagy arilalkil;

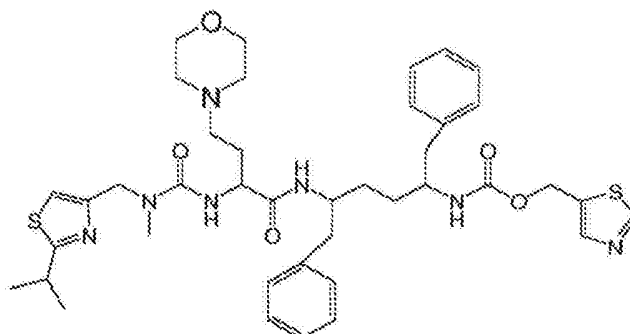
R^{20} és R^{21} mindegyik függetlenül H, $-C_{1-3}$ alkil, $-C(O)R^{17}$ vagy $-S(O)_2R^{17}$; vagy

10 R^{20} és R^{21} , együttvéve a nitrogén atommal, amelyhez kapcsolódnak, egy 5-6 tagú heterociklil gyűrűt alkotnak, amely tartalmaz 1-2 heteroatomot, amely ki van választva a következőkből álló csoportból: N és O;

R^{22} H, $-C_{1-3}$ alkil, $-OR^{19}$ vagy $-NR^{20}R^{21}$; és

R^{23} szubsztituálatlan vagy szubsztituált 5-6 tagú heterociklil gyűrű, amely tartalmaz 1-2 heteroatomot, amely ki van választva a következőkből álló csoportból: N és O.

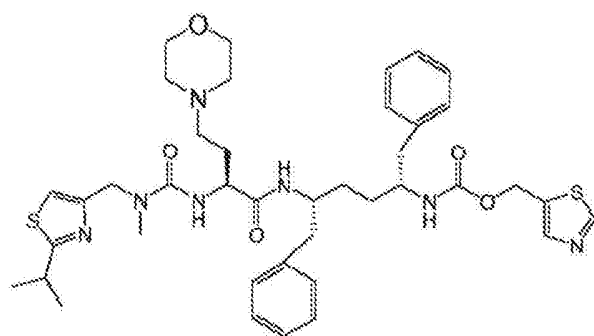
5. A 1. igénypont szerinti vegyület, amelynek képlete



15

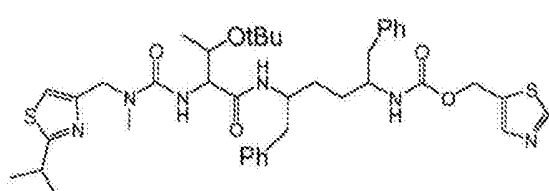
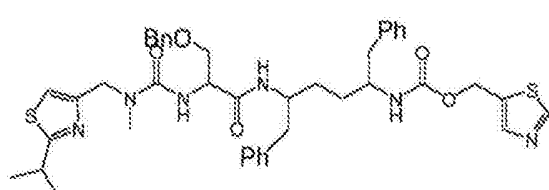
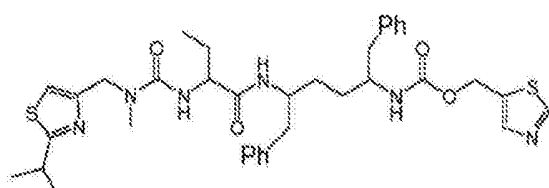
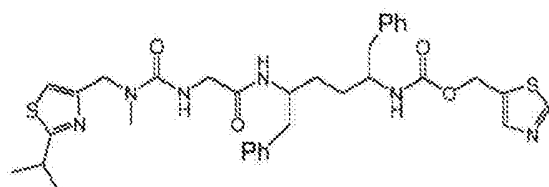
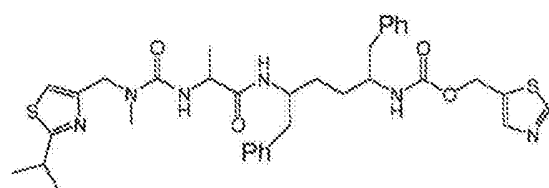
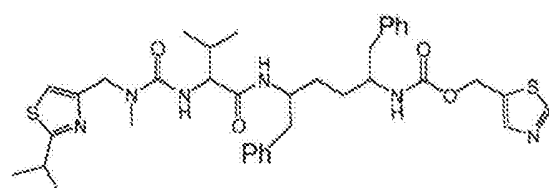
vagy annak gyógyszerészetileg elfogadható sója, sztereoizomere és/vagy szolvátja.

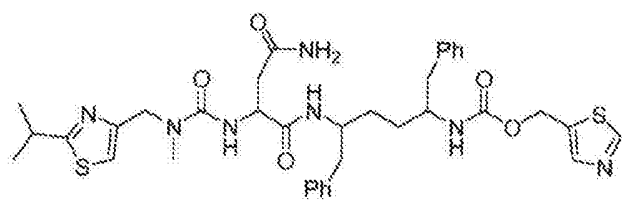
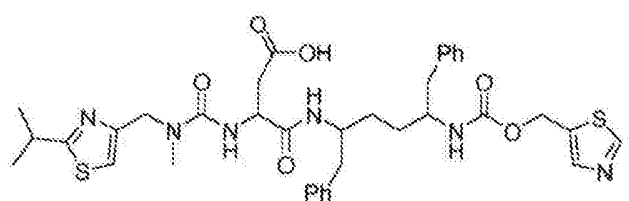
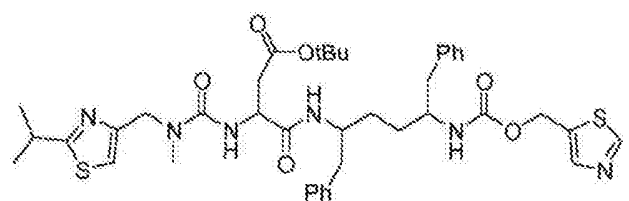
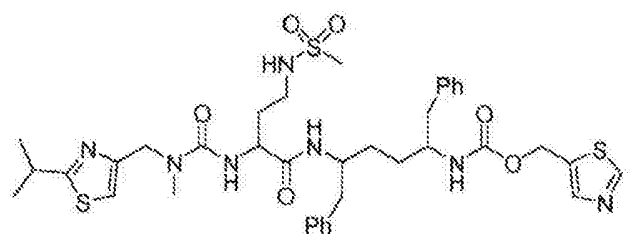
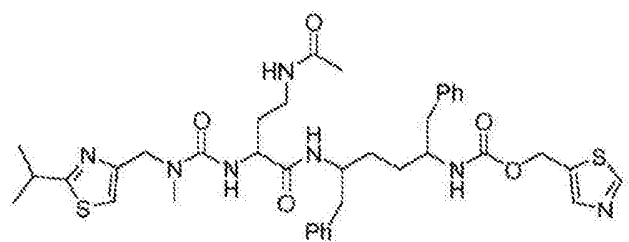
6. Az 5. igénypont szerinti vegyület, amely:



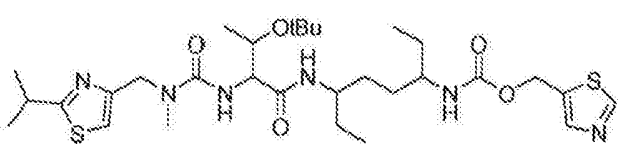
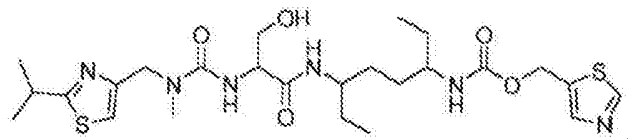
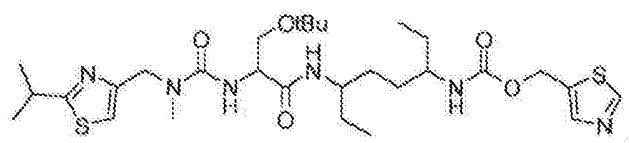
vagy annak gyógyszerészetileg elfogadható sója.

7. Az 1. igénypont szerinti vegyület, amely ki van választva a következőkből álló csoportból:

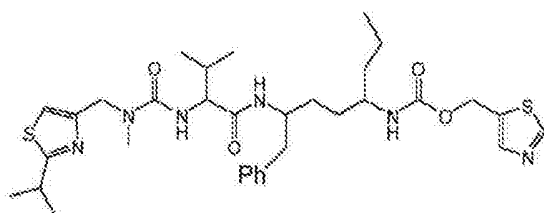
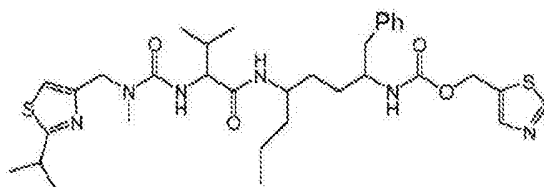
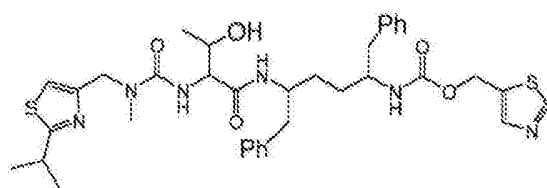




5

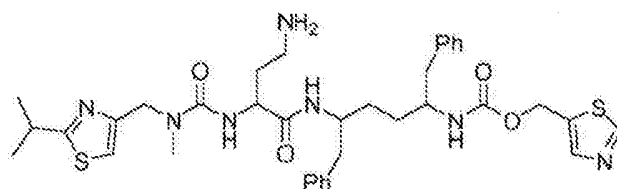
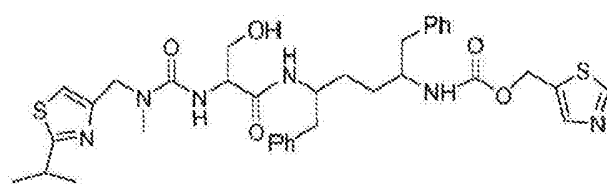
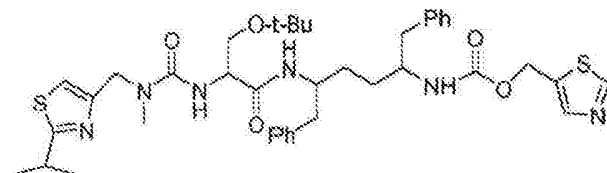


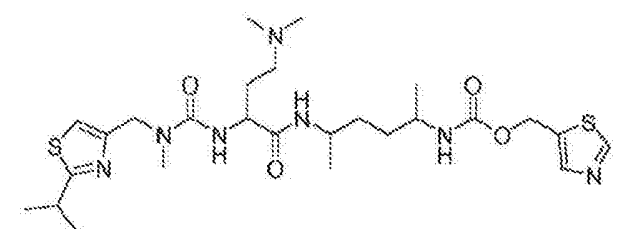
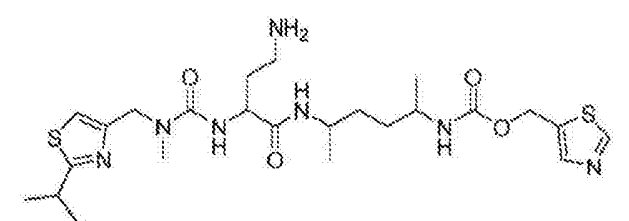
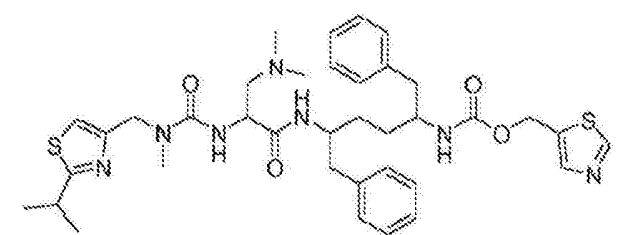
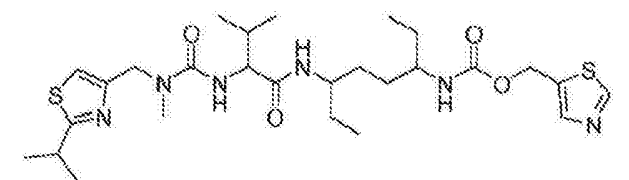
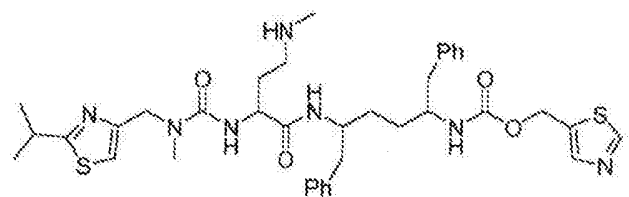
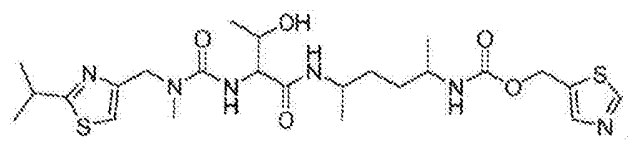
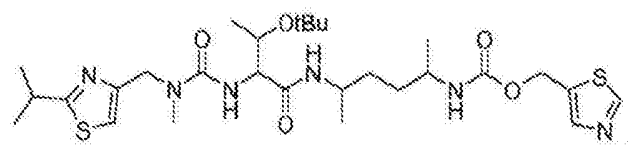
-4-



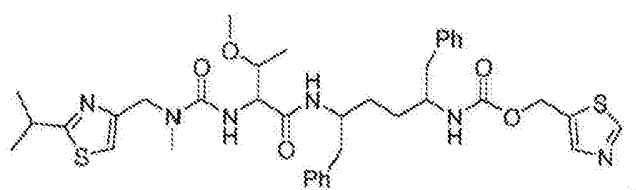
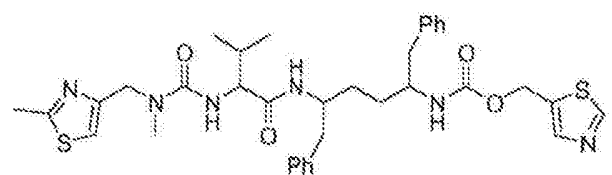
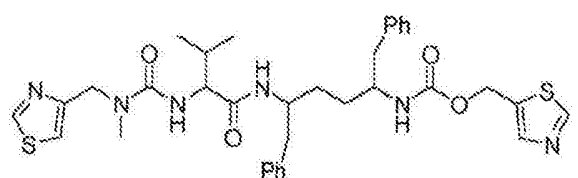
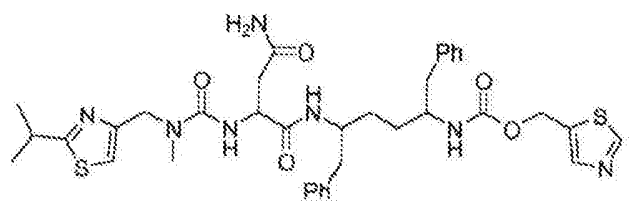
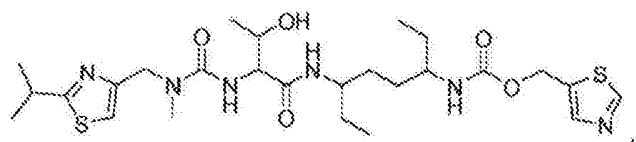
vagy

5. annak gyógyszerészetileg elfogadható sói, szolvátjai, észterei és/vagy sztereoizomerei.
8. Az 1. igénypont szerinti vegyület, amely ki van választva a következőkből álló csoportból:

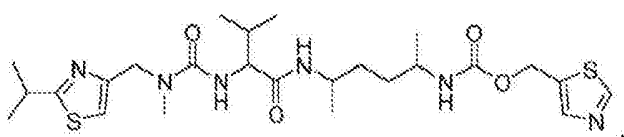
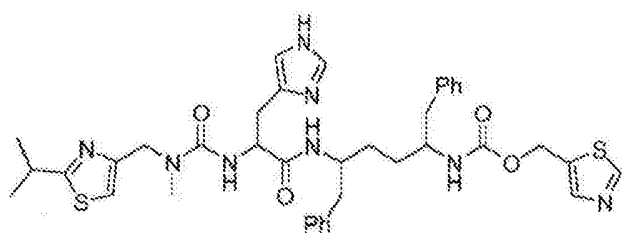
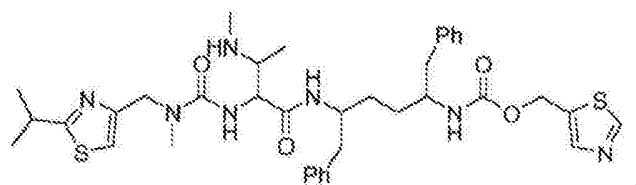


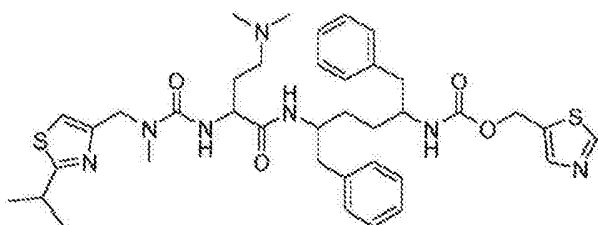
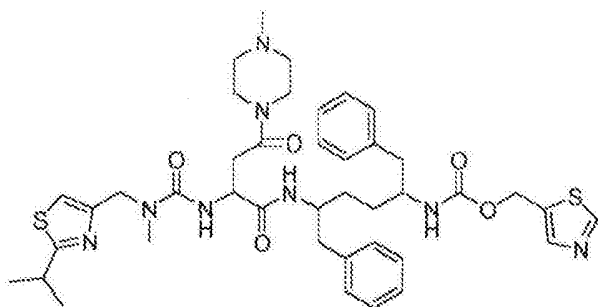
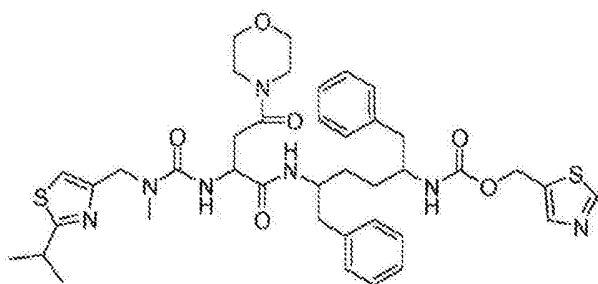
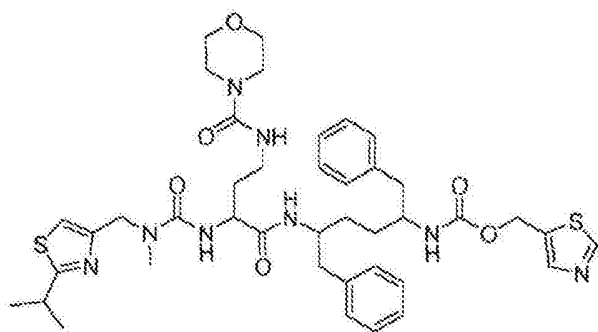
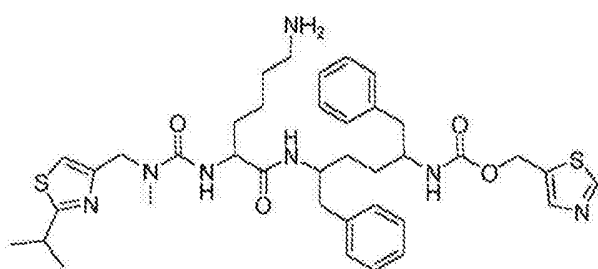


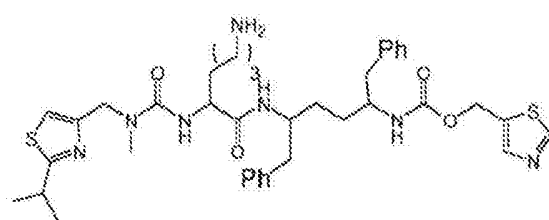
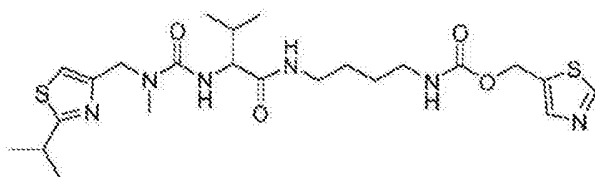
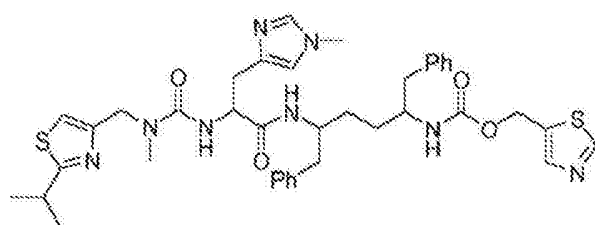
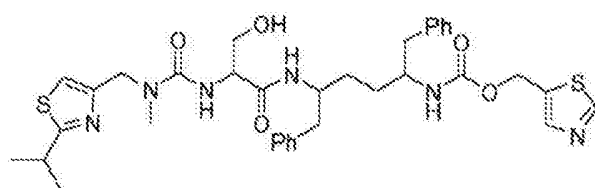
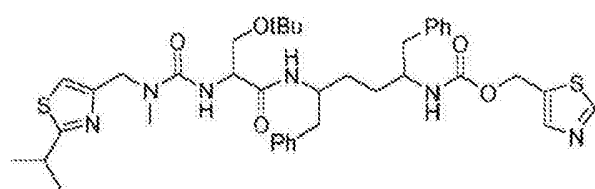
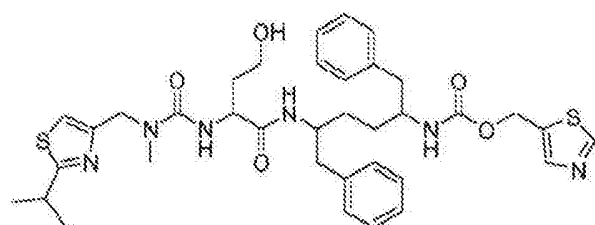
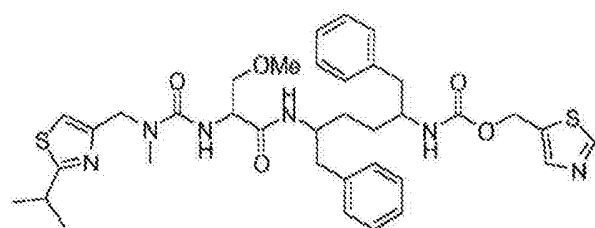
-6-



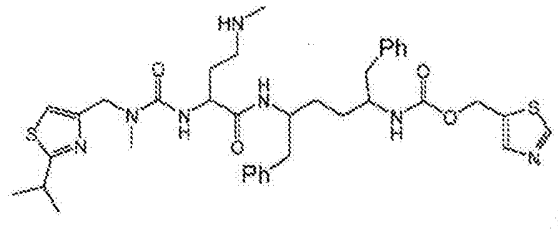
5







5



vagy

annak gyógyszerészetileg elfogadható sói, szolvátjai, észterei és/vagy sztereoizomerei.

9. Gyógyszerészeti kompozíció, amely tartalmazza az 1-8. igénypontok bármelyike szerinti vegyületet, vagy annak gyógyszerészetileg elfogadható sóját, szolvátját és/vagy észterét és gyógyszerészetileg elfogadható hordozóanyagot vagy excipientet.
10. Az 1-8. igénypont bármelyike szerinti vegyület felhasználásra terápiában.
11. Az 1-8. igénypont bármelyike szerinti felhasználásra gyógyszer farmakokinetikájának javítására, amely citokróm P450 monooxigenáz által van metabolizálva, egy gyógyszer vérplazma szintje növelésére, amely citokróm P450 monooxigenáz által van metabolizálva, citokróm P450 monooxigenáz inhibítálására, HIV infekció kezelésére vagy HCV infekció kezelésére páciensben.
12. A 11. igénypont szerinti vegyület, ahol a citokróm P450 monooxigenáz citokróm P450 monooxigenáz 3A.

15

20

25

30