

(19)



REPUBLIKA SLOVENIJA
Urad RS za intelektualno lastnino

(10) **SI 9010633 B**

(12)

PATENT S SPREMENJENIMI ZAHTEVKI *

** V tem dokumentu so objavljeni spremenjeni zahtevki patenta **9010633 A**.
Zahtevki so bili spremenjeni na podlagi ugotovitevne odločbe, izdane po drugi točki 73. člena Zakona o industrijski lastnini.*

(21) Številka prijave: **9010633**

(51) MPK⁶: **C07D 475/02**, **C07D 475/06**,
A61K 31/495

(22) Datum prijave: **29.03.1990**

(46) Datum objave spremenjenih zahtevkov:
30.06.1999

(30) Prednostna pravica:
30.03.1989 FR 8904193

(45) Datum objave patenta (9010633 A):
28.02.1997

(60) Prijava pri ZZP:
YU 633/90, 29.03.1990 (31.10.1991)

(72) Izumitelji: **Ferrand Gerard, Lyon, FR;**
Dumas Herve, Villefontaine, FR;
Depin Jean-Claude, Lyon, FR;
Quentin Yvette, Lyon, FR

(73) Nosilec: **Lipha, Lyonnaise industrielle pharmaceutique,**
34, rue Saint-Romain, F-69008 Lyon Cedex 08, FR

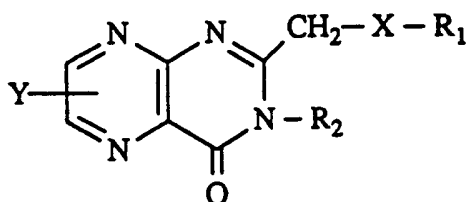
(74) Zastopnik: **Patentna pisarna d.o.o., Čopova 14 p.p. 322, 1000 Ljubljana, SI**

(54) **POSTOPKI ZA PRIDOBIVANJE PTERIDIN-4(3H)-ONOV IN ZDRAVILNI PRIPRAVKI, KI JIH VSEBUJEJO**

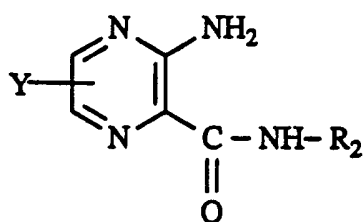
SI 9010633 B

Patentni zahtevki

1. Postopek za pripravo pteridin-4(3H)-onov s formulo

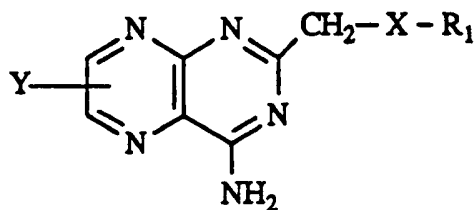


v kateri je X atom kisika ali žvepla, je Y atom vodika, (C₁-C₄) alkilni radikal, zlasti metilni radikal v položaju 6 ali hidroksi skupina v položaju 7, je R₁ atom vodika, (C₁-C₄) alkilni radikal, fenilni radikal po izbiri substituiran z eno do tremi skupinami, izbranimi izmed (C₁-C₄) alkila, (C₁-C₄) alkoksi, halogena, hidroksi ali acetila, benzilni radikal, metoksimetilna skupina, acetilna skupina, 2-acetoksietilna skupina ali 2,2,2-trifluoroetilna skupina, in je R₂ atom vodika ali (C₁-C₄) alkilni radikal, zlasti metilni radikal; in njihovih farmacevtsko sprejemljivih alkalijskih soli, označen s tem, da 3-aminopirazin-2-karboksamid s formulo



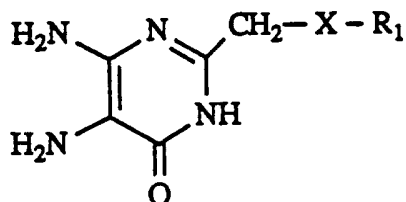
obdelamo z ortoestrom s formulo R₁XCH₂C(OR₃)₃, kjer imajo X, Y, R₁ in R₂ predhodno podane pomene in je R₃ alkilni radikal, ali

kadar je R_2 atom vodika, 4-aminopteridin s formulo



kjer imajo X, Y in R_1 predhodno definirane pomene, hidroliziramo v alkalni vodi, ali

kadar sta Y in R_2 atoma vodika, 5,6-diaminopirimidin-4(3H)-on s formulo



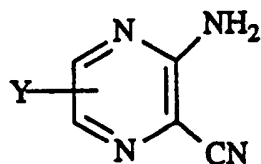
kjer sta X in R_1 kot sta definirana predhodno, obdelamo z glioksalom.

2. Postopek po zahtevku 1, označen s tem, da so pteridin-4(3H)-oni tisti, v katerih je X atom kisika, je Y atom vodika ali hidroksi skupina v položaju 7 in je R_2 atom vodika; in njihove farmacevtsko sprejemljive alkalijske soli.
3. Postopek po zahtevku 1, označen s tem, da so pteridin-4(3H)-oni tisti, v katerih je R_1 (C_1 - C_4) alkilni radikal, fenilni radikal ali benzilni radikal, in njihove farmacevtsko sprejemljive alkalijske soli.
4. Postopek po zahtevku 1, označen s tem, da je pteridin-4(3H)-on 2-(metoksimetil)pteridin-4(3H)-on in njegove farmacevtsko sprejemljive alkalijske soli.
5. Postopek po zahtevku 1, označen s tem, da je pteridin-4(3H)-on 2-(etoksimetil)pteridin-4(3H)-on in njegove farmacevtsko sprejemljive alkalijske soli.

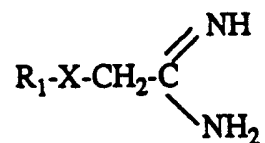
6. Postopek po zahtevku 1, označen s tem, da je pteridin-4(3H)-on 2-(propoksimetil)pteridin-4(3H)-on in njegove farmacevtsko sprejemljive alkalijske soli.
7. Postopek po zahtevku 1, označen s tem, da je pteridin-4(3H)-on 2-(fenoksimetil)-pteridin-4(3H)-on in njegove farmacevtsko sprejemljive alkalijske soli.
8. Postopek po zahtevku 1, označen s tem, da je pteridin-4(3H)-on 2-(benziloksimetil)-pteridin-4(3H)-on in njegove farmacevtsko sprejemljive alkalijske soli.
9. Postopek po zahtevku 1, označen s tem, da je pteridin-4(3H)-on 2-(etoksimetil)-7-hidroksipteridin-4(3H)-on in njegove farmacevtsko sprejemljive alkalijske soli.
10. Postopek za pripravo spojin s formulo



kjer imajo X, Y in R₁ pomene podane v zahtevku 1, ki so intermediat v postopku priprave po zahtevku 1, označen s tem, da 3-aminopirazin-2-karbonitril s formulo

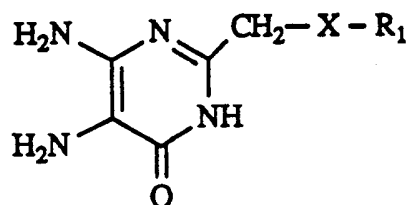


kondenziramo z acetamidinom s formulo

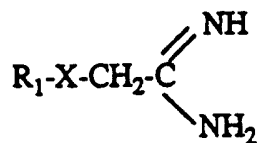


kjer so X, Y in R₁ kot so definirani predhodno.

11. Postopek za pripravo 5,6-diaminopirimidin-4(3H)-onov s formulo

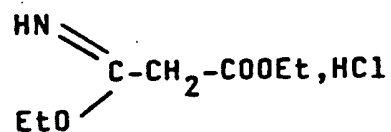


kjer sta X in R₁ definirana kot v zahtevku 1, ki so intermediat v postopku priprave po zahtevku 1, označen s tem, da acetamidin s formulo

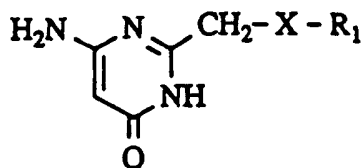


kjer sta X in R₁ kot sta definirana predhodno,

kondenziramo z iminoetrom etil-cianoacetata s formulo

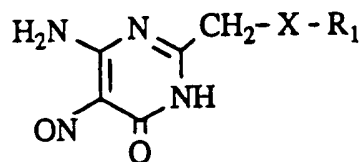


da dobimo 6-aminopirimidin-4(3H)-on s formulo



kjer sta X in R₁ definirana kot predhodno,

katerega nitroziramo, tako da dobimo 6-amino-5-nitrozopirimidin-4(3H)-on s formulo



kjer sta X in R₁ kot sta definirana predhodno, katerega redukcija zagotovi 5,6-diaminopirimidin-4(3H)-on.

12. Postopek za pripravo farmacevtskih pripravkov, označen s tem, da zmešamo vsaj eno spojino po zahtevku 1 s farmacevtsko sprejemljivim ekscipientom.
13. Postopek po zahtevku 12, označen s tem, da je ekscipient primeren za pripravo pripravkov v obliki aerosolov, tablet, obloženih tablet, želatinskih kapsul, raztopin za injekcije, mazil, praškov, raztopin ali supozitorijev.