

(19)



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

(10) **SI/EP 1971329 T1**

(12)

PREVOD ZAHTEVKOV EVROPSKEGA PATENTA

(21) Številka predmeta: **200632225**

(51) Int. Cl. (2017.01)

(22) Datum prijave: **18.12.2006**

A61P 17/00 A61K 31/00
C07D 251/00 A61K 9/00
A61K 47/00 A61K 45/00

(46) Datum objave prevoda zahtevkov:
30.03.2018

(96) Evropska patentna prijava:
18.12.2006 EP 06829704.3

(30) Prednostna pravica:
13.01.2006 FR 0600347

(87) Objava mednarodne patentne prijave:
WO 2007/079915, 19.07.2007

(86) Mednarodna patentna prijava:
18.12.2006 WO PCT/EP2006/012183

(97) Objava evropskega patenta:
EP 1971329 B1, 11.10.2017

(72) Izumiteljja: **MOINET Gerard, F-91400 Orsay, FR;**
CRAVO Daniel, F-78500 Sartrouville, FR

(73) Imetnik: **POXEL SAS Immeuble le Sunway,**
259/261 avenue Jean Jaures, 69007 Lyon, FR

(74) Zastopnik: **ZIVKO MIJATOVIC & PARTNERS, d.o.o., Ulica stare pravde 10, 1000 Ljubljana, SI**

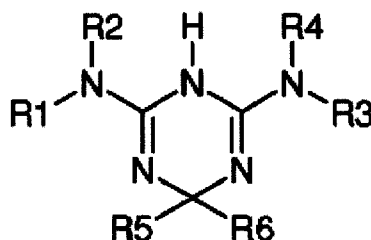
(54) **DERIVATI TRIAZINA ZA UPORABO PRI ZDRAVLJENJU CIKATRIZACIJI**

SI/EP 1971329 T1

DERIVATI TRIAZINA ZA UPORABO PRI ZDRAVLJENJU CIKATRIZACIJI

PATENTNI ZAHTEVKI

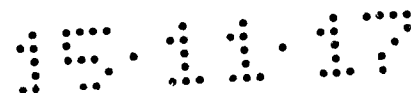
1. Derivati triazina s splošno formulo (I) spodaj:



v kateri

R1, R2, R3 in R4 so neodvisno izbrani iz naslednjih skupin:

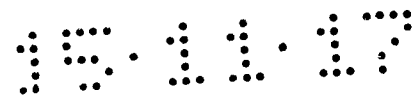
- H
- (C1-C20)alkil, po izbiri substituiran s halogenom, (C1-C5) alkil, (C1-C5) alkoksi ali (C3-C8) cikloalkil,
- (C2-C20)alkenil, po izbiri substituiran s halogenom, (C1-C5) alkil ali (C1-C5) -alkoksi
- (C2-C20)alkinil, po izbiri substituiran s halogenom, (C1-C5) alkil ali (C1-C5) -alkoksi



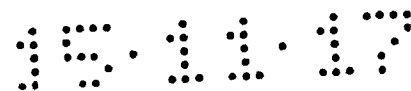
- (C3-C8)cikloalkil, po izbiri substituiran s (C1-C5)alkil ali (C1-C5)alkoksi
- hetero(C3-C8)cikloalkil, ki nosi enega ali več heteroatomov, izbranih izmed N, O in S in po izbiri substituiran s (C1-C5)alkil ali (C1-C5)alkoksi
- (C6-C14)aril (C1-C20)alkil, po izbiri substituiran z amino, hidroksil, tio, halogen, (C1-C5)alkil, (C1-C5)alkoksi, (C1-C5)alkiltio, (C1-C5)alkilamino, (C6-C14)ariloksi, (C6-C14)aril(C1-C5)alkoksi, ciano, trifluorometil, karboksil, karboksimetil ali karboksietil,
- (C6-C14)aril, po izbiri substituiran z amino, hidroksil, tio, halogen, (C1-C5)-alkil, (C1-C5)alkoksi, (C1-C5)alkiltio, (C1-C5)alkilamino, (C6-C14)ariloksi, (C6-C14) aril (C1-C5) alkoksi, ciano, trifluorometil, karboksil, karboksimetil ali karboksietil,
- (C1-C13)heteroaril, ki nosi enega ali več heteroatomov, izbranih izmed N, O in S in po izbiri substituiran z amino, hidroksil, tio, halogen, (C1-C5)alkil, (C1-C5)alkoksi, (C1-C5)alkiltio, (C1-C5)alkilamino, (C6-C14)ariloksi, (C6-C14)aril(C1-C5)alkoksi, ciano, trifluorometil, karboksil, karboksimetil ali karboksietil,

R1 in R2, na eni strani in R3 in R4, po drugi strani, po možnosti tvorita z atomom dušika n-členski obroč (n med 3 in 8), ki po izbiri vsebuje en ali več heteroatomov, izbranih izmed N, O in S in je lahko substituiran z eno ali več izmed naslednjih skupin: amino, hidroksil, tio, halogen, (C1-C5)alkil, (C1-C5)alkoksi, (C1-C5)alkiltio, (C1-C5)alkilamino, (C6-C14)ariloksi, (C6-C14)aril(C1-C5)alkoksi, ciano, trifluorometil, karboksil, karboksimetil ali karboksietil,

R5 in R6 sta neodvisno izbrana iz naslednjih skupin:



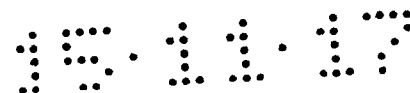
- H,
- (C1-C20)alkil po izbiri substituiran z amino, hidroksil, tio, halogen, (C1-C5)alkil, (C1-C5)alkoksi, (C1-C5)alkiltio, (C1-C5)alkilamino, (C6-C14)ariloksi, (C6-C14)aril(C1-C5)alkoksi, ciano, trifluorometil, karboksil, karboksimetil ali karboksietil,
- (C2-C20)alkenil po izbiri substituiran z amino, hidroksil, tio, halogen, (C1-C5)alkil, (C1-C5)alkoksi, (C1-C5)alkiltio, (C1-C5)alkilamino, (C6-C14)ariloksi, (C6-C14)aril(C1-C5)alkoksi, ciano, trifluorometil, karboksil, karboksimetil ali karboksietil,
- (C2-C20)alkinil po izbiri substituiran z amino, hidroksil, tio, halogen, (C1-C5)alkil, (C1-C5)alkoksi, (C1-C5)alkiltio, (C1-C5)alkilamino, (C6-C14)ariloksi, (C6-C14)aril(C1-C5)alkoksi, ciano, trifluorometil, karboksil, karboksimetil ali karboksietil,
- (C3-C8)cikloalkil po izbiri substituiran z amino, hidroksil, tio, halogen, (C1-C5)alkil, (C1-C5)alkoksi, (C1-C5)alkiltio, (C1-C5)alkilamino, (C6-C14)ariloksi, (C6-C14)aril(C1-C5)alkoksi, ciano, trifluorometil, karboksil, karboksimetil ali karboksietil,
- hetero(C3-C8)cikloalkil ki nosi enega ali več heteroatomov, izbranih izmed N, O in S in po izbiri substituiran s hidroksil, tio, halogen, (C1-C5)alkil, (C1-C5)alkoksi, (C1-C5)alkiltio, (C1-C5)alkilamino, (C6-C14)ariloksi, (C6-C14)aril(C1-C5)alkoksi, ciano, trifluorometil, karboksil, karboksimetil ali karboksietil,
- (C6-C14)aril po izbiri substituiran z amino, hidroksil, tio, halogen, (C1-C5)alkil, (C1-C5)alkoksi, (C1-C5)alkiltio, (C1-C5)alkilamino, (C6-C14)ariloksi, (C6-C14)aril(C1-C5)alkoksi, ciano, trifluorometil, karboksil, karboksimetil ali karboksietil,



- (C1-C13)heteroaril ki nosi enega ali več heteroatomov, izbranih izmed N, O in S po izbiri substituiran z amino, hidroksil, tio, halogen, (C1-C5)alkil, (C1-C5)alkoksi, (C1-C5)alkiltio, (C1-C5)alkilamino, (C6-C14)ariloksi, (C6-C14)aril(C1-C5)alkoksi, ciano, trifluorometil, karboksil, karboksimetil ali karboksietil,
- (C6-C14)aril(C1-C5)alkil po izbiri substituiran z amino, hidroksil, tio, halogen, (C1-C5)alkil, (C1-C5)alkoksi, (C1-C5)alkiltio, (C1-C5)alkilamino, (C6-C14)ariloksi, (C6-C14)aril(C1-C5)alkoksi, ciano, trifluorometil, karboksil, karboksimetil ali karboksietil,
- R5 in R6 po možnosti tvorita atomom ogljika na katerega sta vezana m-členski obroč (m med 3 in 8) po izbiri vsebuje enega ali več heteroatomov izbranih izmed N, O in S in je po možnosti substituiran z amino, hidroksil, tio, halogen, (C1-C5)alkil, (C1-C5)alkoksi, (C1-C5)alkiltio, (C1-C5)alkilamino, (C6-C14)ariloksi, (C6-C14)aril(C1-C5)alkoksi, ciano, trifluorometil, karboksil, karboksimetil ali karboksietil,

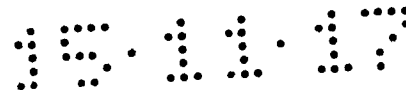
ali po možnosti tvori z ogljikovim atomom C10-C30 policiklični ostanek, po izbiri substituiran z amino, hidroksil, tio, halogen, (C1-C5)alkil, (C1-C5)alkoksi, (C1-C5)alkiltio, (C1-C5)alkilamino, (C6-C14)ariloksi, (C6-C14)aril(C1-C5)alkoksi, ciano, trifluorometil, karboksil, karboksimetil ali karboksietil,

R5 in R6 skupaj lahko tudi predstavljata skupino =O ali =S, atom dušika heterocikloalkilne ali heteroarilne skupine, ki je po možnosti substituirana z (C1-C5)alkil, (C3-C8)cikloalkil, (C6-C14)aril, (C6-C14)aril(C1-C5)alkil ali (C1-C6)acilno skupino,



in tudi racemne oblike, tautomere, enantiomere, diastereoizomere, epimere in polimorfe ter njihove mešanice in njihove farmacevtsko sprejemljive soli, za uporabo pri zdravljenju cikatrizaciji.

2. Derivati triazina za uporabo po zahtevku 1, kjer je R5 vodik.
3. Derivati triazina za uporabo po zahtevkih 1 in 2, kjer sta R5 in R6 neodvisno izbrana izmed H in (C1-C20)alkilne skupine, po izbiri substituirane z amino, hidroksil, tio, halogen, (C1-C5)alkil, (C1-C5)alkoksi, (C1- C5)alkiltio, (C1-C5)alkilamino, (C6-C14)ariloksi, (C6-C14)aril(C1-C5)alkoksi, ciano, trifluorometil, karboksil, karboksimetil ali karboksietil.
4. Derivati triazina za uporabo po katerem koli od prejšnjih zahtevkov, kjer so R1, R2, R3 in R4 neodvisno izbrani izmed H in (C1-C20)alkilnih skupin, po izbiri substituiranih s halogen, (C1-C5)alkil, (C1-C5)alkoksi ali (C3-C8)cikloalkil.
5. Derivati triazina za uporabo po katerem koli od prejšnjih zahtevkov, kjer sta R1 in R2 metilna skupina in R3 in R4 predstavljata vodik.
6. Derivati triazina za uporabo po katerem koli izmed predhodnih zahtevkov, za uporabo zdravljenju cikatrizaciji ran diabetikov.
7. Derivati triazina za uporabo po katerem koli od prejšnjih zahtevkov, **označeni s tem**, da je spojina s formulo (I) 2-amino-3,6-dihidro-4-dimetilamino-6-metil-1,3,5-triazin.



8. Derivati triazina za uporabo po katerem koli od prejšnjih zahtevkov, **označeni s tem**, da je spojina s formulo (I) (-)-2-amino-3,6-dihidro-4-dimetil-amino-6-metil-1,3,5-triazin.
9. Derivati triazina za uporabo po katerem koli od zahtevkov 1 do 8, **označeni s tem**, da je uporabljena spojina s formulo (I) (+)-2-amino-3,6-dihidro-4-dimetilamino-6-metil-1,3,5-triazin.
10. Derivati triazina za uporabo po katerem koli od predhodnih zahtevkov, kjer je spojina s formulo (I) v obliki hidroklorida.
11. Derivati triazina za uporabo po katerem koli od predhodnih zahtevkov, **označeni s tem**, da je zdravilo v farmacevtski obliki za lokalno uporabo.
12. Derivati triazina za uporabo po katerem koli od predhodnih zahtevkov, **označeni s tem**, da zdravilo vsebuje od 0,02 mas.% do 2 mas.% spojine s formulo (I) ali njegove farmacevtsko sprejemljive soli in ustreznega ekscipienta.
13. Derivati triazina za uporabo po katerem koli od prejšnjih zahtevkov, **označeni s tem**, da je spojina s formulo (I) ali njena farmacevtsko sprejemljiva sol v kombinaciji z enim ali več drugimi antibiotiki, protiglivičnimi ali protivirusnimi aktivnimi snovmi.
14. Farmacevtski sestavek za topikalno uporabo pri zdravljenju cikatrizaciji, ki kot aktivno sredstvo obsega terapevtsko učinkovito količino spojine s splošno

formulo (I), kot je definirano v katerem koli od zahtevkov 1 do 10 ali njeno farmacevtsko sprejemljivo sol v ustreznem nosilcu.

15. Sestavek za uporabo po zahtevku 14, **označen s tem**, da vsebuje eno ali več drugih aktivnih snov(i).

16. Sestavek za uporabo po zahtevku 14 ali 15, **označen s tem**, da vsebuje od 0,02 mas.% do 2 mas.% spojine s formulo (I) ali njene farmacevtsko sprejemljive soli.