

(19)



REPUBLIKA SLOVENIJA
Urad RS za intelektualno lastnino

(10) **SI 21098 B**

(12)

PATENT S SPREMENJENIMI ZAHTEVKI *

** V tem dokumentu so objavljeni spremenjeni zahtevki dopolnilnega patenta 21098 A1. Zahtevki so bili spremenjeni na podlagi ugotovitvene odločbe, izdane po členu 93(1)(b) Zakona o industrijski lastnini (Uradni list RS, št. 51/2006 – uradno prečiščeno besedilo)*

(21) Številka prijave: **200100287**

(51) Int. Cl. (2009)

(22) Datum prijave: **05.11.2001**

C07D 405/00 C07D 213/00
C07D 317/00 C07D 409/00
A61K 31/4427

(46) Datum objave spremenjenih zahtevkov:

29.10.2010

(45) Datum objave dopolnilnega patenta:

30.06.2003

(72) Izumitelji: **Biediger Ronald J., Houston, TX 77095, US;**
Holland George W., North Caldwell, NJ 07006, US;
Kassir Jamal M., Houston, TX 77054, US;
Li Wen, Houston, TX 77057, US;
Market Robert V., Pearland, TX 77581, US;
Scott Ian L., Delanson, NY 12053, US;
Wu Chengde, Pearland, TX 77584, US

(73) Imetnik: **ENCYSIVE PHARMACEUTICALS, INC.,**
4848 Loop Central Drive, Suite 700, Houston, TX 77081, US

(74) Zastopnik: **Patentna pisarna d.o.o., Čopova 14, p.p. 1725, 1001 Ljubljana, SI**

(54) **DERIVATI PROPANOJSKE KISLINE, KI INHIBIRAJO VEZAVO INTEGRINOV NA NJIHOVE RECEPTORJE**

SI 21098 B

Patentni zahtevki

1. Spojina, izbrana iz skupine, ki jo sestavljajo:

- (3S)-3- {[(2S)-2-(3-benzil-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il)heksanoil]amino}-3-(3',4'-dimetoksi-1,1'-bifenil-4-il)propanojska kislina,
- (3S)-3-({(2S)-2-[3-(2-klorobenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]heksanoil} amino)-3-(3',4'-dimetoksi-1,1'-bifenil-4-il)propanojska kislina,
- (3S)-3-(1,1'-bifenil-4-il)-3-({(2S)-2-[3-(2-kloro-6-metilbenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]heksanoil} amino)propanojska kislina,
- (3S)-3- {[(2S)-2-(3-benzil-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il)heksanoil]amino}-3-(1,1'-bifenil-4-il)propanojska kislina,
- (3S)-3-(1,1'-bifenil-4-il)-3-({(2S)-2-[3-(2-klorobenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]heksanoil} amino)propanojska kislina,
- (3S)-3- {[(2S)-2-(3-benzil-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il)heksanoil]amino}-3-(4'-metil-1,1'-bifenil-4-il)propanojska kislina,
- (3S)-3-({(2S)-2-[3-(2-klorobenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]heksanoil} amino)-3-(4'-metil-1,1'-bifenil-4-il)propanojska kislina,
- (3S)-3-({(2S)-2-[3-(2-kloro-6-metilbenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]heksanoil} amino)-3-(4'-metil-1,1'-bifenil-4-il)propanojska kislina,
- (3S)-3- {[(2S)-2-(3-benzil-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il)heksanoil]amino}-3-(2',6'-dimetoksi-1,1'-bifenil-4-il)propanojska kislina,
- (3S)-3-({(2S)-2-[3-(2-klorobenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]heksanoil} amino)-3-(2',6'-dimetoksi-1,1'-bifenil-4-il)propanojska kislina,
- (3S)-3-({(2S)-2-[3-(2-kloro-6-metilbenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]heksanoil} amino)-3-(2',6'-dimetoksi-1,1'-bifenil-4-il)propanojska kislina,
- (3S)-3- {[(2S)-2-(3-benzil-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il)heksanoil]amino}-3-(1,1'-bifenil-3-il)propanojska kislina,
- (3S)-3-(1,1'-bifenil-3-il)-3-({(2S)-2-[3-(2-klorobenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]heksanoil} amino)propanojska kislina,

(3S)-3-(1,1'-bifenil-3-il)-3-((2S)-2-[3-(2-kloro-6-metilbenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]heksanoil} amino)propanojska kislina,
 (3S)-3-([(2S)-2-(3-benzil-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il)heksanoil] amino)-3-(2'-metoksi-1,1'-bifenil-3-il)propanojska kislina,
 (3S)-3-((2S)-2-[3-(2-klorobenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]heksanoil} amino)-3-(2'-metoksi-1,1'-bifenil-3-il)propanojska kislina,
 (3S)-3-((2S)-2-[3-(2-kloro-6-metilbenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]heksanoil} amino)-3-(2'-metoksi-1,1'-bifenil-3-il)propanojska kislina,
 (3S)-3-((2S)-2-[3-(2-fluoro-6-metoksibenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]heksanoil} amino)-3-(4-metilfenil)propanojska kislina,
 (3S)-3-((2S)-2-[3-(2,6-dimetilbenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]heksanoil} amino)-3-(4-metilfenil)propanojska kislina,
 (3S)-3-((2S)-2-[3-(3,5-dimetilbenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]heksanoil} amino)-3-(4-metilfenil)propanojska kislina,
 (3S)-3-((2S)-2-[3-(2,6-diklorobenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]heksanoil} amino)-3-(4-metilfenil)propanojska kislina,
 (3S)-3-((2S)-2-[3-(2-kloro-6-fluorobenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]heksanoil} amino)-3-(4-metilfenil)propanojska kislina,
 (3S)-3-((2S)-2-[3-(2,6-difluorobenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]heksanoil} amino)-3-(4-metilfenil)propanojska kislina,
 (3S)-3-(1,3-benzodioksol-5-il)-3-((2S)-2-[3-(2,6-difluorobenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]heksanoil} amino)propanojska kislina,
 (3S)-3-(1,3-benzodioksol-5-il)-3-((2S)-2-[3-(2-kloro-6-fluorobenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]heksanoil} amino)propanojska kislina,
 (3S)-3-(1,3-benzodioksol-5-il)-3-((2S)-2-[3-(2,6-diklorobenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]heksanoil} amino)propanojska kislina,
 (3S)-3-(1,3-benzodioksol-5-il)-3-((2S)-2-[3-(2,6-dimetilbenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]heksanoil} amino)propanojska kislina,
 (3S)-3-(1,3-benzodioksol-5-il)-3-((2S)-2-[3-(3,5-dimetilbenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]heksanoil} amino)propanojska kislina,

(3S)-3-(1,3-benzodioxol-5-il)-3-((2S)-2-[3-(2-fluoro-6-metoksibenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]heksanoil} amino)propanojska kislina,
 (3S)-3-((2S)-2-[3-(2-klorobenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]heksanoil} amino)-3-(3,4-dietoksifenil)propanojska kislina,
 (3S)-3-(3,4-dietoksifenil)-3-((2S)-2-[3-(2,6-difluorobenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]heksanoil} amino)propanojska kislina,
 (3S)-3-((2S)-2-[3-(2,6-difluorobenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]heksanoil} amino)-3-(3-etoksifenil)propanojska kislina,
 (3S)-3-((2S)-2-[3-(2-kloro-6-fluorobenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]heksanoil} amino)-3-(3-etoksifenil)propanojska kislina,
 (3S)-3-((2S)-2-[3-(2-klorobenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]-3-metilbutanoil} amino)-3-(4-metilfenil)propanojska kislina,
 (3S)-3-((2S)-2-[3-(2-klorobenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]-4-metilpentanoil} amino)-3-(4-metilfenil)propanojska kislina,
 (3S)-3-(1,3-benzodioxol-5-il)-3-((2S)-2-[3-(2-klorobenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]-4-metilpentanoil} amino)propanojska kislina,
 (3S)-3-(1,3-benzodioxol-5-il)-3-((2S)-2-[3-(2-klorobenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]-3-metilbutanoil} amino)propanojska kislina,
 (3S)-3-(1,3-benzodioxol-5-il)-3-((2S)-2-[3-(2-klorobenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]-3-fenilpropanoil} amino)propanojska kislina,
 (3S)-3-((2S)-2-[3-(2-klorobenzil)-5-metil-2-oksopiridin-1(2H)-il]-3-fenilpropanoil} amino)-3-(4-metilfenil)propanojska kislina,
 (3S)-3-(1,3-benzodioxol-5-il)-3-(((2R)-2-(1-benzil-5-metil-2-okso-1,2-dihidropiridin-3-il)-heksanoil) amino)propanojska kislina,
 (3S)-3-(1,3-benzodioxol-5-il)-3-(((2S)-2-(3-benzil-5-metil-2-okso-1(2H)-piridinil)heksanoil) amino)propanojska kislina
 ali njihova farmacevtsko sprejemljiva sol.

2. Farmacevtski sestavek, ki obsega:

spojino po zahtevku 1 v farmacevtsko sprejemljivem nosilcu.

3. Uporaba spojine po zahtevku 1 za pripravo zdravila za zdravljenje bolezni, izbrane iz skupine, ki jo sestavljajo astma, ateroskleroza, revmatoidni artritis, alergija, multipla skleroza, lupus, vnetna bolezen črevesja, zavrnitev presadka, kontaktna hipersenzitivnost, diabetes tipa I, levkemija in možganski rak.