



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO



(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20161691 T1

HR P20161691 T1

(12) **PRIJEVOD PATENTNIH ZAHTJEVA
EUROPSKOG PATENTA**

(51) MKP:

C07D 209/52 (2006.01)

A61K 31/403 (2006.01)

A61P 25/00 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 24.02.2017.

(21) Broj predmeta: P20161691T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 12.12.2016.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2013064747
Datum podnošenja međunarodne prijave: 12.07.2013.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 13735315.7
Datum podnošenja europske prijave patenta: 12.07.2013.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2014012851
Datum međunarodne objave: 23.01.2014.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2875000 A1
Datum objave europske prijave patenta: 27.05.2015.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2875000 B1
Datum objave europskog patenta: 21.09.2016.

(31) Broj prve prijave: 12176662

(32) Datum podnošenja prve prijave: 17.07.2012.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: EP

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelji:

F. Hoffmann - La Roche AG, Grenzacherstrasse 124, 4070 Basel, CH
Georg Jaeschke, Lerchenstrasse 76, 4059 Basel, CH
Lothar Lindemann, Jungstrasse 44, 4056 Basel, CH
Heniz Stadler, Dornacherstrasse 154, 4053 Basel, CH
Eric Vieira, Lindenstrasse 9, 4402 Frenkendorf, CH
CPZ - CENTAR ZA PATENTE d.o.o., 10000 Zagreb, HR

(74) Zastupnik:

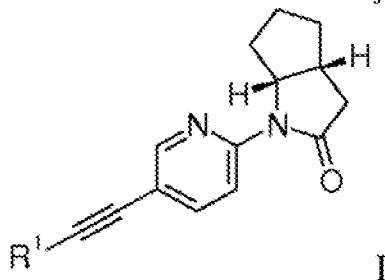
(54) Naziv izuma: **DERIVATI ARILETINILA**

HR P20161691 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

5

1. Spojevi, **naznačeni time, da** su u čistom enantiomernom obliku i imaju sljedeću formulu I:



u kojoj

R¹ je fenil koji je prema potrebi supstituiran s 1-2 atoma halogena odabrana od fluora ili klora; ili farmaceutski prihvatljiva kiselinska adicijska sol.

10

2. Spojevi formule I prema zahtjevu 1, **naznačeni time, da** R¹ je fenil koji je prema potrebi supstituiran s 1-2 atoma fluora, ili farmaceutski prihvatljiva kiselinska adicijska sol.

3. Spojevi formule I prema bilo kojem od zahtjeva 1 ili 2, **naznačeni time, da** su spojevi sljedeći:

15

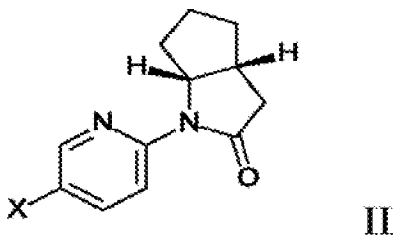
(3aR,6aR)-1-(5-(feniletinil)piridin-2-il)heksahidrociiklopenta[b]pirol-2(1H)-on,
 (3aR,6aR)-1-(5-((3-fluorofenil)etinil)piridin-2-il)heksahidrociiklopenta[b]pirol-2(1H)-on,
 (3aR,6aR)-1-(5-((4-fluorofenil)etinil)piridin-2-il)heksahidrociiklopenta[b]pirol-2(1H)-on, ili
 (3aR,6aR)-1-(5-((2,5-difluorofenil)etinil)piridin-2-il)heksahidrociiklopenta[b]pirol-2(1H)-on.

4. Postupak proizvodnje spoja formule I koji je opisan u zahtjevu 1,

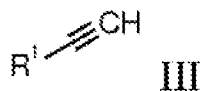
20

naznačen time, da obuhvaća sljedeće varijante:

a) reakcija spoja sljedeće formule II:

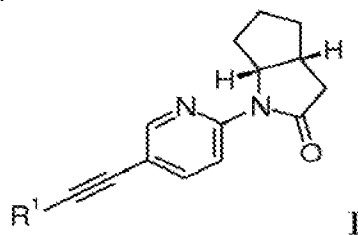


u kojoj X je atom halogena odabran od broma ili joda, s prikladnim arilacetenom sljedeće formule III:



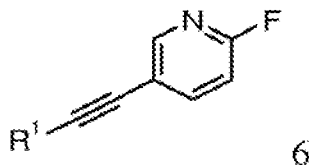
25

u svrhu tvorbe spoja sljedeće formule I:



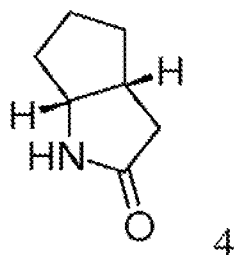
pri čemu su supstituenti opisani u zahtjevu 1, ili prema želji, dobiveni spojevi se pretvaraju u farmaceutski prihvatljive kiselinske adicijske soli, ili

b) reakcija spoja sljedeće formule:

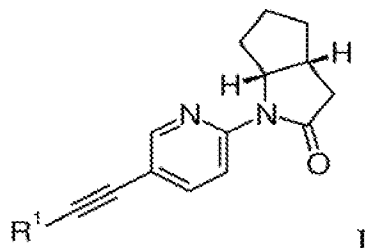


30

sa spojem sljedeće formule:



u spoj sljedeće formule:



gdje su supstituenti opisani u zahtjevu 1, ili prema želji, dobiveni spojevi se pretvaraju u farmaceutski prihvatljive kiselinske adicijske soli.

5

5. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 3, **naznačen time, da** se upotrebljava kao lijek.
6. Farmaceutski sastav, **naznačen time, da** obuhvaća najmanje jedan od spojeva prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 3, kao i njegovu farmaceutski prihvatljivu sol.
7. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 3, u čistom enantiomernom obliku kao i njegova farmaceutski prihvatljiva sol, **naznačen/a time, da** se upotrebljava kao lijek.
8. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 3, **naznačen time, da** se upotrebljava u liječenju ili prevenciji shizofrenije, kognitivnih bolesti, sindroma fragilnog X ili autizma.

10