

РОССИЙСКАЯ ФЕДЕРАЦИЯ



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(19)

**RU**

(11)

**2 609 512**

<sup>(13)</sup> **C2**

(51) МПК

*A61K 31/22* (2006.01)

*A61K 31/122* (2006.01)

*A61K 31/047* (2006.01)

*A61K 31/232* (2006.01)

*A61K 45/06* (2006.01)

*A61P 31/18* (2006.01)

*C08G 8/30* (2006.01)

**(12) ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ**

(21)(22) Заявка: 2014139825, 01.03.2013

(24) Дата начала отсчета срока действия патента:  
01.03.2013

Дата регистрации:  
02.02.2017

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
02.03.2012 BR BR 10 2012 004739 0;  
23.03.2012 BR BR 10 2012 006549 5

(43) Дата публикации заявки: 20.04.2016 Бюл. № 11

(45) Опубликовано: 02.02.2017 Бюл. № 4

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
национальной фазе: 02.10.2014

(86) Заявка РСТ:  
BR 2013/000063 (01.03.2013)

(87) Публикация заявки РСТ:  
WO 2013/126980 (06.09.2013)

Адрес для переписки:  
129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, строение 3,  
ООО "Юридическая фирма Городисский и  
Партнеры"

(72) Автор(ы):

**ПЯНОВСКИЙ Луис Франсиску (BR),  
ТАНУРИ Амилкар (BR)**

(73) Патентообладатель(и):

**АМАЗОНИЯ ФИТОМЕДИКАМЕНТОС  
ЛТДА. (BR)**

(56) Список документов, цитированных в отчете  
о поиске: WO 2011/086423 A1, 21.07.2011. RU  
2013133865 A, опубл. 27.01.2015, дата  
приоритета 22.12.2010. WO 2006/116897 A1,  
09.11.2006. JP H07165600 A, 27.06.1995. US  
2010204318 A1, 12.08.2010. WO 2011/086424  
A1, 21.07.2011.

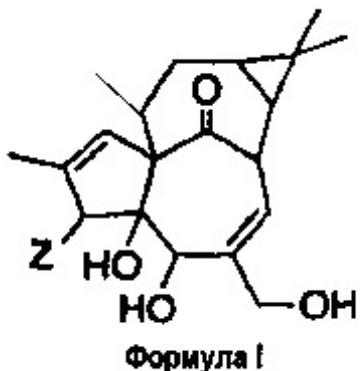
R U 2 6 0 9 5 1 2 C 2

**(54) ПРОИЗВОДНЫЕ ИНГЕНОЛА ДЛЯ РЕАКТИВАЦИИ ЛАТЕНТНОГО ВИРУСА ВИЧ**

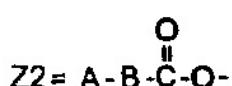
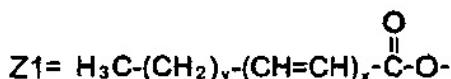
(57) Формула изобретения

1. Применение одного или более производных ингенола формулы I

R U 2 6 0 9 5 1 2 C 2



в получении продукта для реактивации латентного вируса ВИЧ в вирусных резервуарах организма человека, где Z представляет собой Z1 или Z2



так, что когда Z=Z1

х и у представляют собой целые числа, х варьирует от 2 до 10 и у варьирует от 2 до 7; и когда Z=Z2,

А представляет собой фенил,  $\text{CH}_3-$  или  $\text{CH}_2=\text{CH}-$

и В представляет собой  $-\text{CH}=\text{CH}-$ ,  $[-\text{CH}_2]_q$  или  $[-\text{CH}_2]_w$ ,

где q представляет собой целое число в диапазоне от 1 до 10

и w представляет собой целое число в диапазоне от 1 до 10, при условии, что:

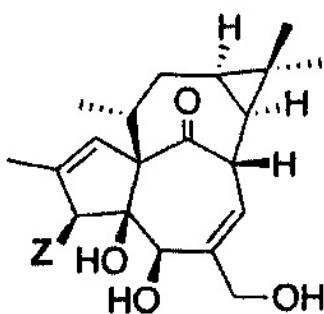
если А представляет собой фенил, В представляет собой  $-\text{CH}=\text{CH}-$ ;

если А представляет собой  $\text{CH}_3-$ , В представляет собой  $[-\text{CH}_2]_q$ ;

если А представляет собой  $\text{CH}_2=\text{CH}-$ , В представляет собой  $[-\text{CH}_2]_w$ ,

и при условии, что производное ингенола формулы I не включает 3-(2,4,6-додекатриеноил)-ингенол или 3-(2,4,6,8-тетрадекатетраноил)-ингенол.

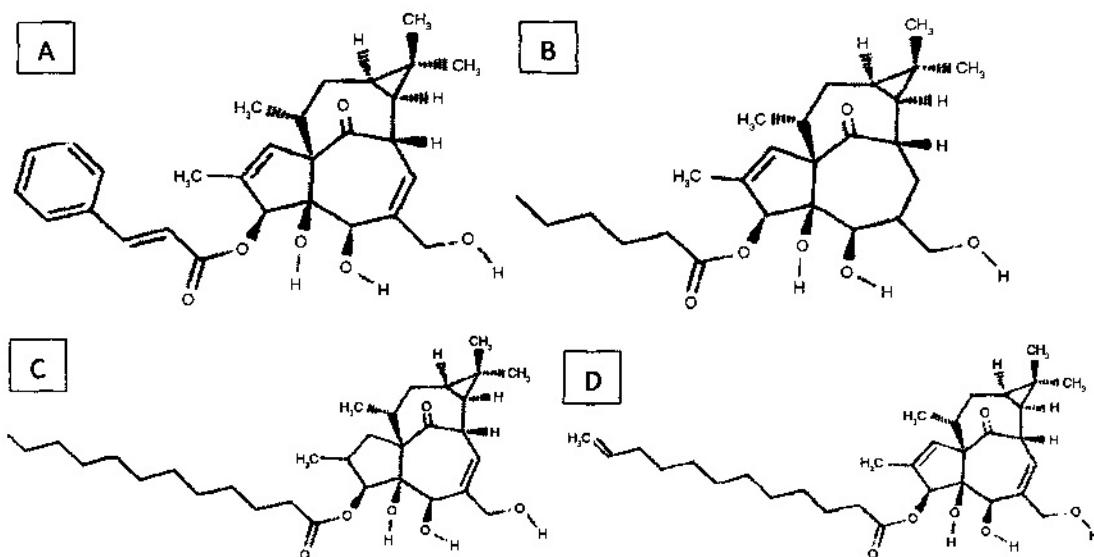
2. Применение по п. 1, отличающееся тем, что указанные одно или более производных ингенола формулы I имеют структуру



3. Применение по п. 1, отличающееся тем, что когда Z=Z1, х варьирует от 3 до 5 и у варьирует от 3 до 4.

4. Применение по п. 1, отличающееся тем, что когда Z=Z2, указанные производные представляют собой одно или более из А, В, С и D:

R  
U  
2  
6  
0  
9  
5  
1  
2  
  
C  
2  
2  
6  
0  
9  
5  
1  
2  
  
R  
U



5. Фармацевтическая комбинация для лечения ВИЧ-инфекции, отличающаяся тем, что она включает одно или более производных ингенола формулы I, определенных в п. 1, и по меньшей мере одно антиретровирусное средство, активное в отношении активно реплицирующихся вирусов, за исключением ланоста-8,24-диен-3-ола.

6. Фармацевтическая комбинация по п. 5, отличающаяся тем, что указанное активное антиретровирусное средство, активное в отношении активно реплицирующихся вирусов, выбирают из нуклеозидных или ненуклеозидных ингибиторов обратной транскриптазы, ингибиторов протеазы, antagonистов корецепторов, ингибиторов ретровирусной интегразы, ингибиторов вирусной адсорбции, специфических ингибиторов вирусной транскрипции, ингибиторов циклинзависимой киназы, а также их сочетаний.

7. Фармацевтическая комбинация по п. 5, отличающаяся тем, что указанное одно или более производных ингенола формулы I и указанное одно или более антиретровирусных средств содержатся в одной и той же лекарственной форме.

8. Фармацевтическая композиция для лечения ВИЧ-инфекции, отличающаяся тем, что она содержит комбинацию по п. 5 и один или более фармацевтически приемлемых эксципиентов.

9. Фармацевтическая композиция для реактивации латентных вирусов ВИЧ в вирусных резервуарах в организме человека, отличающаяся тем, что она содержит одно или более производных ингенола формулы I, определенных в п. 1.

10. Адъювант для лечения инфекции, вызываемой вирусом ВИЧ, отличающийся тем, что он содержит одно или более производных ингенола формулы I, определенных в п. 1, и фармацевтически приемлемые эксципиенты.

11. Способ реактивации латентного вируса ВИЧ в вирусных резервуарах в организме человека, отличающийся тем, что он включает введение пациенту одного или более производных ингенола формулы I по п. 1.