



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(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:
01.03.2013Дата 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):

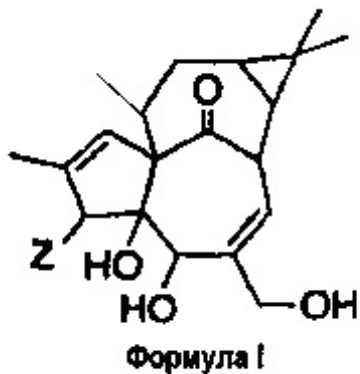
ПЯНОВСКИЙ Луис Франсиску (BR),
ТАНУРИ Амилкар (BR)

(73) Патентообладатель(и):

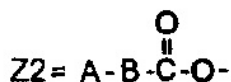
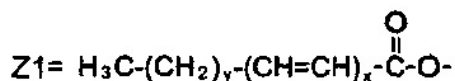
АМАЗОНИЯ ФИТОМЕДИКАМЕНТОС
ЛТДА. (BR)(56) Список документов, цитированных в отчете
о поиске: WO 2011/086423 A1, 21.07.2011. RU
2013133865 A, опубл. 27.01.2015, дата
приоритета 22.12.2010. WO 2006/116897 A1,
09.11.2006. JP H07165600 A, 27.06.1995. US
2010204318 A1, 12.08.2010. WO 2011/086424
A1, 21.07.2011.(54) **ПРОИЗВОДНЫЕ ИНГЕНОЛА ДЛЯ РЕАКТИВАЦИИ ЛАТЕНТНОГО ВИРУСА ВИЧ**

(57) Формула изобретения

1. Применение одного или более производных ингенола формулы I



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



так, что когда $Z=Z1$

x и y представляют собой целые числа, x варьирует от 2 до 10 и y варьирует от 2 до 7; и когда $Z=Z2$,

A представляет собой фенил, CH_3- или $CH_2=CH-$

и B представляет собой $-CH=CH-$, $[-CH_2-]_q$ или $[-CH_2-]_w$,

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:

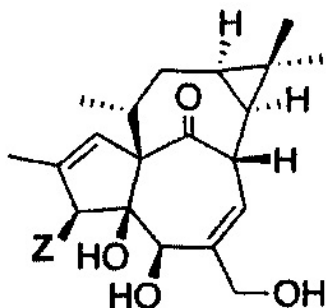
если A представляет собой фенил, B представляет собой $-CH=CH-$;

если A представляет собой CH_3- , B представляет собой $[-CH_2-]_q$;

если A представляет собой $CH_2=CH-$, B представляет собой $[-CH_2-]_w$,

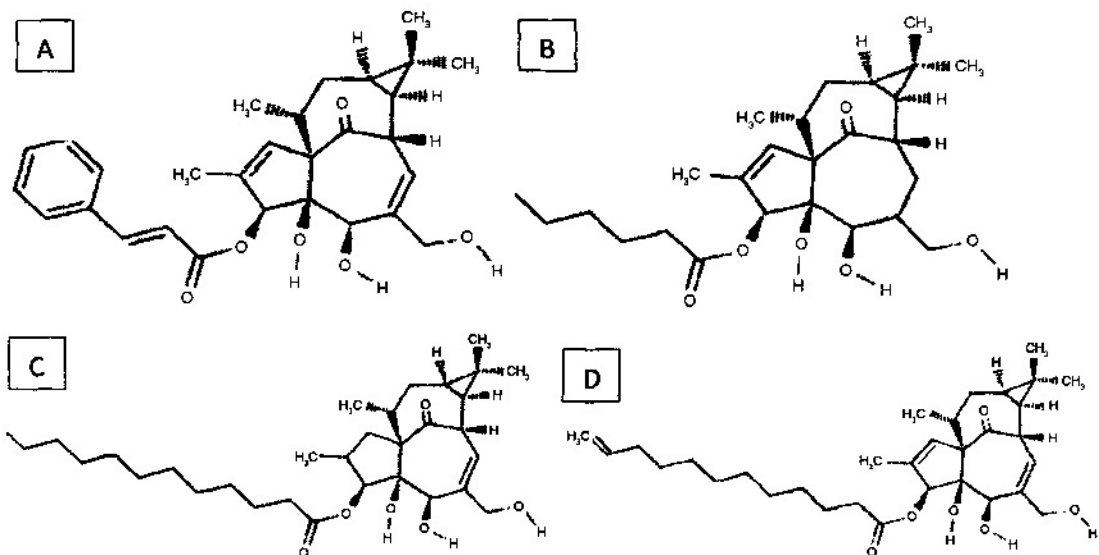
и при условии, что производное ингенола формулы I не включает 3-(2,4,6-додекатриеноил)-ингенол или 3-(2,4,6,8-тетрадекатетраноил)-ингенол.

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 $Z=Z1$, x варьирует от 3 до 5 и y варьирует от 3 до 4.

4. Применение по п. 1, отличающееся тем, что когда $Z=Z2$, указанные производные представляют собой одно или более из A, B, C и D:



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, антагонистов корцепторов, 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. Адьювант 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.