



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20131131 T1

HR P20131131 T1

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

(51) MKP:

C07D 491/048 (2006.01)

A61K 31/496 (2006.01)

A61P 19/00 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 17.01.2014.

(21) Broj predmeta: P20131131T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 26.11.2013.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2009062406
Datum podnošenja međunarodne prijave: 24.09.2009.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 09783391.7
Datum podnošenja europske prijave patenta: 24.09.2009.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2010034788
Datum međunarodne objave: 01.04.2010.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2331548 A1
Datum objave europske prijave patenta: 15.06.2011.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2331548 B1
Datum objave europskog patenta: 04.09.2013.

(31) Broj prve prijave: 0817424

(32) Datum podnošenja prve prijave: 24.09.2008.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: GB

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelji:

Medivir AB, P.O. Box 1086, 141 22 Huddinge, SE
Lourdes Salvadore Odén, Medivir AB PO Box 1086, 141 22 Huddinge, SE
Magnus Nilsson, Medivir AB, PO Box 1086, 141 22 Huddinge, SE
Pia Kahnberg, Medivir AB, PO Box 1086, 141 22 Huddinge, SE
Bertil Samuelsson, Medivir AB, PO Box 1086, 141 22 Huddinge, SE
Urszula Grabowska, Medivir UK Ltd, Chesterford Research Park, Little
Chesterford, CB10 1XL Essex, GB
ZMP IP d.o.o., 10000 Zagreb, HR

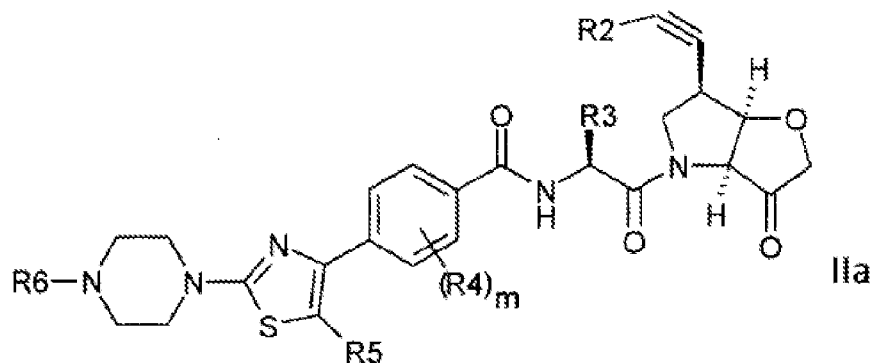
(74) Zastupnik:

(54) Naziv izuma: **INHIBITORI PROTEAZE**

HR P20131131 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Spoj formule IIa:



gdje

R² je H ili ciklopropil;

R³ je granat C₂-C₆alkil ili C₃-C₆cikloalkil, od koji je svaki izborno supstituiran sa jednim ili dva fluoro ili sa trifluorometilom;

R⁴ je metil ili fluoro; m je 0, 1 ili 2;

R⁵ je H, metil ili fluoro;

R⁶ je C₁-C₆alkil;

ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, N-oksidi ili hidrati.

2. Spoj prema patentnom zahtjevu 1, **naznačen time** što, R² je H, na taj način definirajući acetilen.

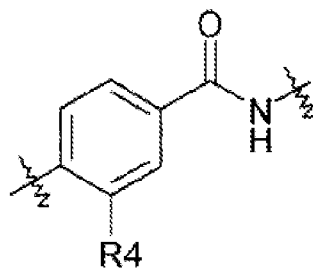
3. Spoj prema patentnom zahtjevu 1, **naznačen time** što, R² je ciklopropil.

4. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 3, **naznačen time** što, R³ je bočni lanac leucina.

5. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 4, **naznačen time** što, m predstavlja 0 i R⁵ predstavlja F.

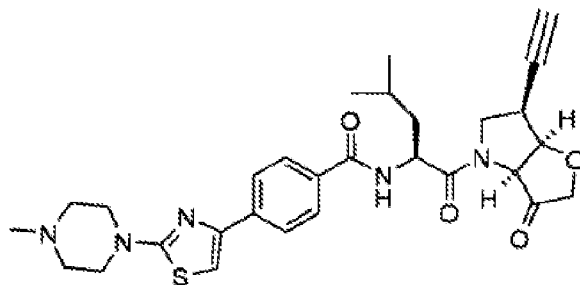
6. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 4, **naznačen time** što, m predstavlja 1, R⁴ je F i R⁵ je H.

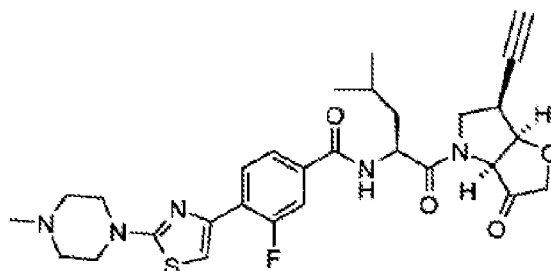
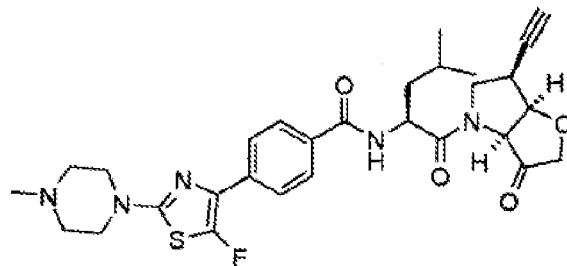
7. Spoj prema patentnom zahtjevu 6, **naznačen time** što, R⁴ je pozicioniran kao što je prikazano pomoću djelomične strukture:



8. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1-7, **naznačen time** što, R⁶ je CH₃.

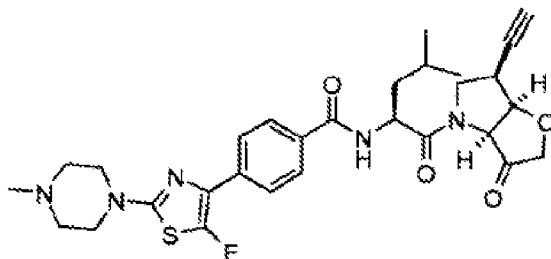
9. Spoj prema patentnom zahtjevu 1, **naznačen time** što je izabran od:





ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, hidrat ili N-oksidi.

10. Spoj prema patentnom zahtjevu 9 sa formulom



ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, hidrat ili N-oksidi.

11. Farmaceutska kompozicija koja sadrži spoj kao što je definirano u bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 10 i farmaceutski prihvatljiv nosač ili razblaživač za njega.

12. Upotreba spoja prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 10 u proizvodnji lijeka za liječenje ili prevenciju poremećaja koji je izabran od:

osteoporoze,
bolesti desni (kao što je gingivitis i periodontitis),

Paget-ove bolesti,
hiperkalcemije kod maligniteta,
metaboličke bolesti kostiju,

bolesti **naznačenih** prekomjernom razgradnjom hrskavice ili matriksa (kao što je osteoartritis i reumatoidni artritis),

kancera kostiju uključujući neoplaziju,
bolova (posebnokroničnih bolova).

13. Uporaba spoja prema patentnom zahtjevu 12 u proizvodnji lijeka za liječenje ili prevenciju osteoporoze.

14. Uporaba spoja prema patentnom zahtjevu 12 u proizvodnji lijeka za liječenje ili prevenciju osteoartritisa.

15. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 10 za uporabu u liječenju ili prevenciji poremećaja koji je izabran od:

osteoporoze,
bolesti desni (kao što je gingivitis i periodontitis),

Paget-ove bolesti,
hiperkalcemije kod maligniteta,
metaboličke bolesti kostiju,

bolesti **naznačenih** prekomjernom razgradnjom hrskavice ili matriksa (kao što je osteoartritis i reumatoidni artritis),

kancera kostiju uključujući neoplaziju,
bolova (posebnokroničnih bolova).

16. Spoj prema patentnom zahtjevu 15 za uporabu u liječenju ili prevenciji osteoporoze.
17. Spoj prema patentnom zahtjevu 15 za uporabu u liječenju ili prevenciji osteoartritisa.