

(19)



REPUBLIKA SLOVENIJA
MINISTRSTVO ZA GOSPODARSKI RAZVOJ IN TEHNOLOGIJO
URAD RS ZA INTELEKTUALNO LASTNINO

(10)

SI/EP 3045206 T1

(12)

PREVOD ZAHTEVKOV EVROPSKEGA PATENTA

(21) Številka predmeta: **200632268**

(51) Int. Cl. (2018.01)

(22) Datum prijave: **28.04.2006**

A61P 31/00

A61K 31/00

C07D 498/00

(46) Datum objave prevoda zahtevkov:

31.07.2018

(96) Evropska patentna prijava:

28.04.2006 EP 16154531.4

(30) Prednostna pravica:

28.04.2005 JP 2005131161;

27.10.2005 JP 2005312076

(97) Objava evropske patentne prijave:

EP 3045206 A1, 20.07.2016

(97) Objava evropskega patenta:

EP 3045206 B1, 28.03.2018

(72) Izumitelji: **JOHNS Brian Alvin, Research Triangle Park, NC 27709, US;**

KAWASUJI Takashi, Toyonaka-shi, Osaka 561-0825, JP;

TAISHI Teruhiko, Toyonaka-shi, Osaka 561-0825, JP;

TAODA Yoshiyuki, Toyonaka-shi, Osaka 561-0825, JP

(73) Imetnika: **VIIV HealthCare Company,**

251 Little Falls Drive, Wilmington, DE 19808, US;

Shionogi & Co., Ltd,

1-8, Doshomachi 3-chome, Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka 541-0045, JP

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

(54) **POLICIKLIČNI KARBAMOILPIRIDONSKI DERIVAT Z INHIBITORNO AKTIVNOSTJO ZA HIV INTEGRAZO**

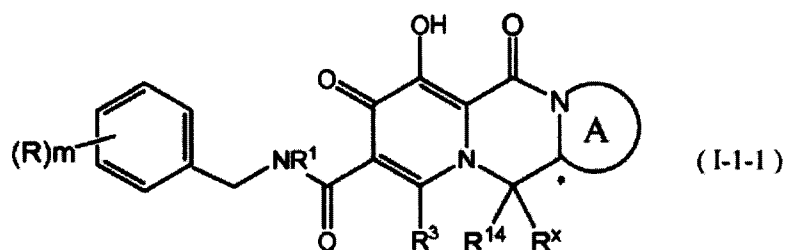
SI/EP 3045206 T1

EP 3045206 B1

Policiklični karbamoilpiridonski derivat z inhibitorno aktivnostjo za HIV integrazo

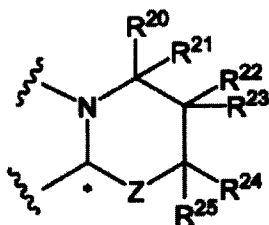
Patentni zahtevki

1. Spojina s formulo:



kjer:

obroč A je:



$$Z = O \text{ ali } NR^{26} \quad (A-1);$$
 $R^{20}-R^{26}$ so vsak neodvisno H ali C_1-C_3 -alkil;

stereokemija asimetričnega ogljika, prikazana z *, izkazuje R- ali S-konfiguracijo ali zmes le-teh;

 R^{14} in R^x sta vodik;

 R^3 je vodik;

 R^1 je vodik;

R je halogen in

m je celo število 0–3;

ali njena farmacevtsko sprejemljiva sol ali solvat.

2. Spojina po zahtevku 1, kjer eden od R^{20} do R^{25} pomeni C_1 - C_3 -alkil in drugi pomenijo vodik.

3. Spojina po zahtevku 1 ali 2, izbrana izmed:

(4*R*,12*aR*)-*N*-[(4-fluorofenil)metil]-7-hidroksi-4-metil-1-(1-metiletil)-6,8-diokso-1,2,3,4,6,8,12,12*a*-oktahidropirido[1',2':4,5]pirazino[1,2-*a*]pirimidin-9-karboksamida;

(4*S*,12*aS*)-*N*-[(2,4-difluorofenil)metil]-7-hidroksi-4-metil-1-(1-metiletil)-6,8-diokso-1,2,3,4,6,8,12,12*a*-oktahidropirido[1',2':4,5]pirazino[1,2-*a*]pirimidin-9-karboksamida;

(4*S*,12*aS*)-*N*-[(4-fluorofenil)metil]-7-hidroksi-1,4-dimetil-6,8-diokso-1,2,3,4,6,8,12,12*a*-oktahidropirido[1',2':4,5]pirazino[1,2-*a*]pirimidin-9-karboksamida;

(4*S*,12*aS*)-*N*-[(2,4-difluorofenil)metil]-7-hidroksi-1,4-dimetil-6,8-diokso-1,2,3,4,6,8,12,12*a*-oktahidropirido[1',2':4,5]pirazino[1,2-*a*]pirimidin-9-karboksamida;

(4*S*,12*aS*)-*N*-[(4-fluorofenil)metil]-7-hidroksi-4-metil-1-(1-metiletil)-6,8-diokso-1,2,3,4,6,8,12,12*a*-oktahidropirido[1',2':4,5]pirazino[1,2-*a*]pirimidin-9-karboksamida;

4-fluoro-benzilamida (2*R*,9*aS*)-5-hidroksi-2-metil-6,10-diokso-3,4,6,9,9*a*,10-heksahidro-2*H*-1-oksa-4*a*,8*a*-diaz-a-antracen-7-karboksilne kisline;

njihovih enantiomerov; njihovih diastereomerov; zmesi njihovih enantiomerov; zmesi njihovih diastereomerov; zmesi njihovih enantiomerov in diastereomerov; in njihovih farmacevtsko sprejemljivih soli.

4. Spojina po zahtevku 1 ali 2, ki je 2,4-difluoro-benzilamid (4S,9aR)-5-hidroksi-4-metil-6,10-dioksa-3,4,6,9,9a,10-heksahidro-2H-1-oksa-4a,8a-diaza-antracen-7-karboksilne kisline ali njegova farmacevtsko sprejemljiva sol.
5. Spojina po zahtevku 3 ali 4, kjer je farmacevtsko sprejemljiva sol natrijeva sol.
6. Farmacevtski sestavek, ki obsega spojino po katerem koli od zahtevkov 1–5 ali njeno farmacevtsko sprejemljivo sol ali solvat.
7. Spojina, sol ali solvat, kot so definirani v katerem koli od zahtevkov 1–5, za uporabo pri postopku zdravljenja človeškega ali živalskega telesa s terapijo.
8. Spojina, sol ali solvat, kot so definirani v katerem koli od zahtevkov 1–5, za uporabo kot antivirusno sredstvo.
9. Spojina, sol ali solvat, kot so definirani v katerem koli od zahtevkov 1–5, za uporabo kot sredstvo proti HIV.
10. Spojina, sol ali solvat, kot so definirani v katerem koli od zahtevkov 1–5, za uporabo v terapiji proti HIV v kombinaciji z dodatnim terapevtskim sredstvom, izbranim izmed inhibitorjev reverzne transkriptaze in inhibitorjev proteaze.