



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20120954 T1

HR P20120954 T1

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

(51) MKP:

A61K 31/341 (2006.01)
A61K 31/351 (2006.01)
A61K 31/381 (2006.01)
A61K 31/382 (2006.01)
C07D 307/12 (2006.01)
C07D 309/06 (2006.01)
C07D 333/16 (2006.01)
C07D 335/02 (2006.01)
A61Q 19/02 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 31.12.2012.

(21) Broj predmeta: P20120954T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 21.11.2012.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2009066267
Datum podnošenja međunarodne prijave: 02.12.2009.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 09796990.1
Datum podnošenja europske prijave patenta: 02.12.2009.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2010063773
Datum međunarodne objave: 10.06.2010.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2373310 A1
Datum objave europske prijave patenta: 12.10.2011.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2373310 B1
Datum objave europskog patenta: 10.10.2012.

(31) Broj prve prijave: 0858206
202128 P

(32) Datum podnošenja prve prijave: 02.12.2008.
30.01.2009.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: FR
US

(73) Nositelj patenta: Galderma Research & Development, 2400 Route des Colles Les
Templiers, 06410 Biot, FR

(72) Izumitelji: Jean-Guy Boiteau, 136 B Chemin du Ribas, 06560 Valbonne, FR
Jean-Claude Pascal, 170, avenue de Gairaut, 06100 Nice, FR

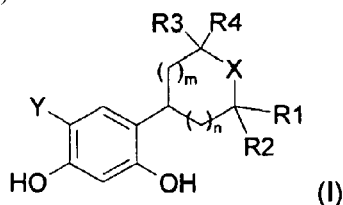
(74) Zastupnik: PRODUCTA d.o.o., 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma: **NOVI SPOJEVI 4-(HETEROCIKLOALKIL)BENZEN-1,3-DIOLA KAO INHIBITORI TIROZINAZE,
POSTUPAK ZA NJIHOVO DOBIVANJE I NJIHOVA UPORABA U HUMANOJ MEDICINI I
TAKOĐER U KOZMETICI**

HR P20120954 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Spojevi dolje navedene opće formule (I):



naznačeni time da:

R1, R2, R3 i R4, koji mogu biti isti ili različiti, predstavljaju:

- vodik,
- radikal C₁-C₄ alkila,
- hidroksimetil, hidroksietil,
- (C₁-C₄ alkoksi)karbonil,
- C₁-C₄ alkoksi,
- hidroksil,

ili

R1 i R2 su spojeni zajedno i sa atomom ugljika na koji su spojeni tvore ugljikov prsten koji sadrži 5 ili 6 ugljikovih atoma, te R3 i R4, koji mogu biti isti ili različiti, predstavljaju:

- vodik,
- radikal C₁-C₄ alkila,

ili

R1 i R4 su spojeni jedan sa drugim i tvore -(CH₂)₂- ili -(CH₂)₃- lanac i R2 i R3, koji mogu biti isti ili različiti, predstavljaju:

- vodik,
- radikal C₁-C₄ alkila,

X predstavlja atom kisika ili atom sumpora,

Y predstavlja vodik, atom klora ili atom fluora,

m može imati vrijednost 1 ili 2 i n može imati vrijednost 0 ili 1, i kada n = 0, tada m = 1 ili 2, i kada n = 1, tada m = 1,

i također soli spojeva opće formule (I), te izomerni oblici koji su cis i trans oblici u odnosu na supstituente na heterocikloalkilu u položaju 4 na benzen-1,3-diolu, te njihovi enantiomerni oblici.

2. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time** da je u obliku soli baze koja je odabrana od organskih baza i anorganskih baza.

3. Spoj prema zahtjevu 1 ili 2, **naznačen time** da je u obliku hidrata ili solvata.

4. Spoj prema jednom od zahtjeva 1 do 3, **naznačen time** da:

- R1 predstavlja vodik, radikal C₁-C₄ alkila ili radikal hidroksimetila,
- R2 predstavlja vodik,
- R3 predstavlja vodik,
- R4 predstavlja vodik,
- X predstavlja atom kisika,
- Y predstavlja vodik ili atom fluora,
- m = 1 i n = 1,

i također soli tih spojeva, te njihovi izomerni i enantiomerni oblici.

5. Spoj prema jednom od zahtjeva 1 do 4, **naznačen time** da je odabran iz skupine koja sadrži:

- 1: 4-(tetrahidropiran-4-il)benzen-1,3-diol
- 2: 4-(tetrahidrotiopiran-4-il)benzen-1,3-diol
- 3: 4-(cis-2,6-dimetiltetrahidropiran-4-il)benzen-1,3-diol
- 4: trans-4-(2-metiltetrahidropiran-4-il)benzen-1,3-diol
- 5: cis-4-(2-metiltetrahidropiran-4-il)benzen-1,3-diol
- 6: trans-4-(2-etiltetrahidropiran-4-il)benzen-1,3-diol
- 7: cis-4-(2-etiltetrahidropiran-4-il)benzen-1,3-diol
- 8: trans-4-(2-hidroksimetiltetrahidropiran-4-il)-benzen-1,3-diol
- 9: 4-(2,2,6,6-tetrametiltetrahidropiran-4-il)benzen-1,3-diol
- 10: 4-(tetrahidrofuran-3-il)benzen-1,3-diol
- 11: 4-(tetrahidrotiofen-3-il)benzen-1,3-diol
- 12: 4-(6-oksaspiro[4.5]dek-9-il)benzen-1,3-diol
- 13: 4-kloro-6-(tetrahidropiran-4-il)benzen-1,3-diol

- 14: 4-fluoro-6-(tetrahidropiran-4-il)benzen-1,3-diol
 15: 4-(2,2-dietiltetrahidropiran-4-il)benzen-1,3-diol
 16: 4-(tetrahidropiran-3-il)benzen-1,3-diol
 17: trans-4-(5-hidroksimetiltetrahidrofuran-3-il)-benzen-1,3-diol
 18: cis-4-(5-hidroksimetiltetrahidrofuran-3-il)benzen-1,3-diol
 19: trans-4-fluoro-6-(5-hidroksimetiltetrahidrofuran-3-il)benzen-1,3-diol
 20: cis-4-fluoro-6-(5-hidroksimetiltetrahidrofuran-3-il)benzen-1,3-diol
 21: trans-4-fluoro-6-(2-hidroksimetiltetrahidropiran-4-il)benzen-1,3-diol
 22: cis-4-fluoro-6-(2-hidroksimetiltetrahidropiran-4-il)benzen-1,3-diol
 23: cis-4-(8-oksabicyklo[3.2.1]okt-3-il)benzen-1,3-diol
 24: trans-4-(8-oksabicyklo[3.2.1]okt-3-il)benzen-1,3-diol
 25: 4-fluoro-6-(tetrahidrotiopiran-4-il)benzen-1,3-diol

6. Uporaba barem jednog spoja prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 5 **naznačena time** da je za dobivanje lijeka za inhibiciju aktivnosti tirozinaze.
7. Uporaba prema zahtjevu 6, **naznačena time** da je za liječenje i/ili sprečavanje pigmentacijskih poremećaja.
8. Uporaba prema zahtjevu 7, **naznačena time** da su pigmentacijski poremećaji odabrani od melasma, kloasma, lentigines, staračkog lentiga, nepravilnih hiperpigmentacija povezanih sa fotostarenjem, pjegavost, post-upalne hiperpigmentacije zbog abrazije, opekotine, ožiljka, dermatoze, kontaktne alergije; madeža, genetskih hiperpigmentacija, hiperpigmentacija metaboličkog porijekla ili porijekla povezanog za lijekovima, melanoma ili bilo kojih drugih hiperpigmentacijskih lezija.
9. Kozmetička uporaba pripravka koji sadrži barem jedan spoj prema jednom od zahtjeva 1 do 5, **naznačena time** da je za zaštitu protiv štetnih utjecaja sunca, za sprečavanje i/ili suzbijanje fotoinduciranog ili kronološkog starenja kože i naboranosti kože, te za higijenu tijela ili kose.