



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20100032 T1

HR P20100032 T1

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

(51) MKP:

A61K 31/433 (2006.01)
C07D 285/08 (2006.01)
C07D 417/04 (2006.01)
A61P 25/28 (2006.01)
A61P 3/10 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 31.03.2010.

(21) Broj predmeta: P20100032T

(22) Datum podnošenja zahtjeva : 18.01.2010.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 05075779.8
Datum podnošenja europske prijave patenta: 04.04.2005.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 1586319 A1
Datum objave europske prijave patenta: 19.10.2005.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 1586319 B1
Datum objave europskog patenta: 21.10.2009.

(31) Broj prve prijave: 04075997

(32) Datum podnošenja prve prijave: 05.04.2004.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: EP

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelji:

Noscira, S.A., Avenida de la Industria, 52, 28760 Tres Cantos, ES
Gil Martinez, Avda. de la Industria 52, 28760 Tres Cantos - Madrid, ES
Isabel Dorronsoro Diaz, Avda. de la Industria 52, 28760 Tres Cantos - Madrid, ES
Mercedes Alonso Cascon, Avda. de la Industria 52, 28760 Tres Cantos - Madrid, ES
Gema Panizodel Pliego, Avda. de la Industria 52, 28760 Tres Cantos - Madrid, ES
Ana Fuertes Huerta, Avda. de la Industria 52, 28760 Tres Cantos - Madrid, ES
Maria José Perez Puerto, Avda. de la Industria 52, 28760 Tres Cantos - Madrid, ES
Miguel Medina Padilla, Avda. de la Industria 52, 28760 Tres Cantos - Madrid, ES

(74) Zastupnik:

Hraste & Partneri odvjetničko društvo, 10000 Zagreb, HR

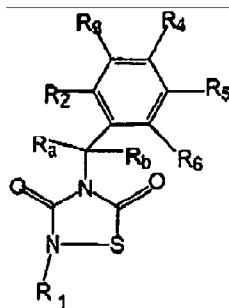
(54) Naziv izuma: TIADIAZOLIDINONI KAO INHIBITORI GSK-3

HR P20100032 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

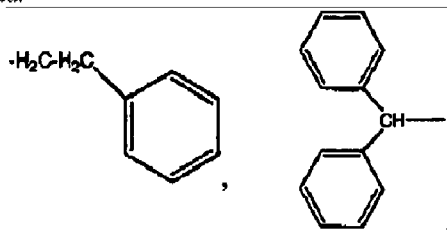
5

1. Spoj opće formule (I)

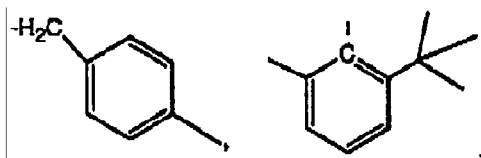
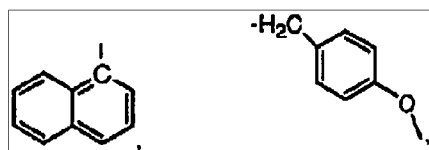


formula I

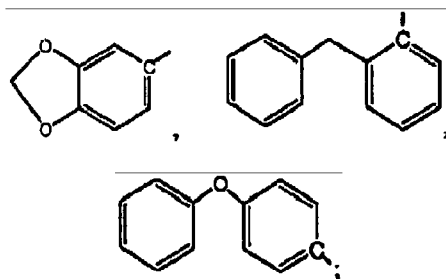
naznačen time što:

R₁ je skupina koju se bira između:

10



15



20 R_a, R_b, R₂, R₃, R₄, R₅ i R₆ se neovisno bira između vodika, supstituiranog ili nesupstituiranog alkila, supstituiranog ili nesupstituiranog cikloalkila, supstituiranog ili nesupstituiranog alkenila, supstituiranog ili nesupstituiranog arila, supstituiranog ili nesupstituiranog heterociklila, -COR₇, -C(O)OR₇, -C(O)NR₇R₈, -C=NR₇, -CN, -OR₇, -OC(O)R₇, -S(O)_t-R₇, -NR₇R₈, -NR₇C(O)R₈, -NO₂, -N=CR₇R₈ ili halogena,

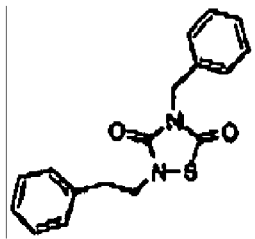
25 gdje R_a i R_b zajedno mogu tvoriti skupinu =O, te gdje bilo koji par R_a R₂, R₂ R₃, R₃ R₄, R₄ R₅, R₅ R₆, R₆ R_b ili R₇ R₈ zajedno mogu tvoriti ciklički supstuent;

t je 0, 1, 2 ili 3,

svakog od R_7 i R_8 se neovisno bira između vodika, supstituiranog ili nesupstituiranog alkila, supstituiranog ili nesupstituiranog cikloalkila, supstituiranog ili nesupstituiranog alkenila, supstituiranog ili nesupstituiranog arila, supstituiranog ili nesupstituiranog heterociklila, supstituiranog ili nesupstituiranog alkoksi, supstituiranog ili nesupstituiranog ariloksi ili halogena;

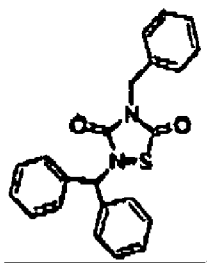
ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol ili solvat.

2. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom I, **naznačen time** što i R_a i R_b su H.
3. Spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1-2, **naznačen time** što R_2 , R_3 , R_4 , R_5 i R_6 se neovisno bira između vodika, supstituiranog ili nesupstituiranog alkila, $-\text{COR}_7$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}_7$, $-\text{OR}_7$, $-\text{NR}_7\text{R}_8$ ili halogena, gdje R_7 i R_8 su definirani kao u patentnom zahtjevu 1.
4. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 3, **naznačen time** što R_2 , R_3 , R_4 , R_5 i R_6 su H.
5. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što ima formulu:



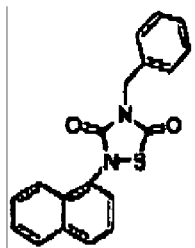
ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol ili solvat.

6. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što ima formulu:



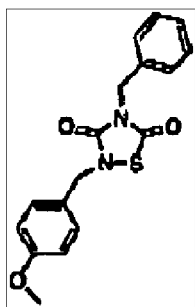
ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol ili solvat.

7. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što ima formulu:



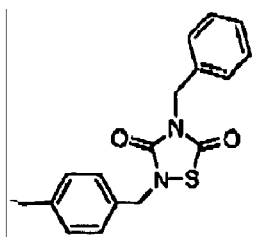
ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol ili solvat.

8. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što ima formulu:



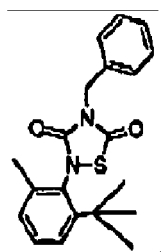
ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol ili solvat.

9. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što ima formulu:



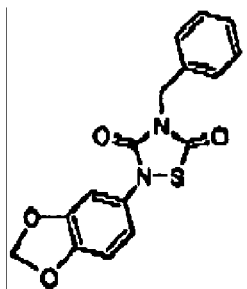
- 5 ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol ili solvat.

10. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što ima formulu:



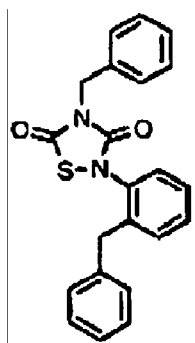
- 10 ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol ili solvat.

11. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što ima formulu:



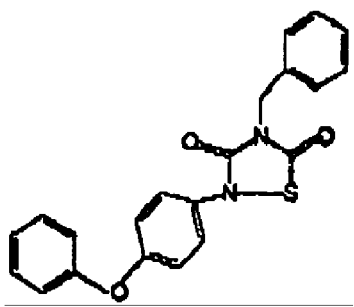
- 15 ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol ili solvat.

12. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što ima formulu:



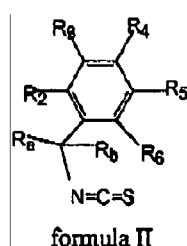
- ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol ili solvat.

13. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što ima formulu:



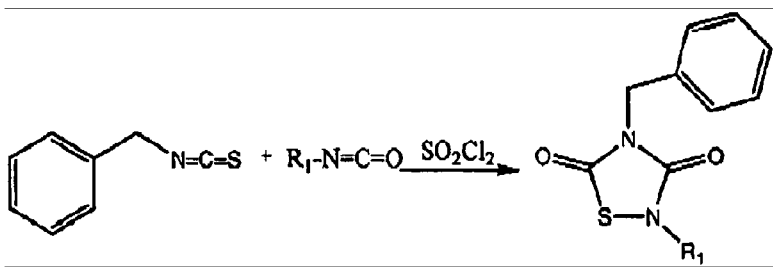
ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol ili solvat.

14. Postupak dobivanja spoja formule (I), ili njegove soli ili solvata, u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1-13, **naznačen time** što se sastoji u reakciji benzilom supstituiranog izotiocijanata formule



sa spojem formule $R_1-N=C=O$, gdje R_a , R_b , i R_1-R_6 su definirani kao u patentnom zahtjevu 1.

15. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 14, **naznačen time** što se sastoji u reakciji:



gdje R_1 je definiran kao u patentnom zahtjevu 1.

16. Farmaceutski pripravak, **naznačen time** što sadrži spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1-13, ili njegovu farmaceutski prihvatljivu sol ili solvat, i farmaceutski prihvatljivu podlogu, adjuvans ili vehikulum.

17. Farmaceutski pripravak u skladu s patentnim zahtjevom 16, **naznačen time** što je namijenjen oralnoj primjeni.

18. Upotreba spoja u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1-13, **naznačena time** što je navedeni spoj namijenjen proizvodnji medikamenta.

19. Upotreba u skladu s patentnim zahtjevom 18, **naznačena time** što medikament je namijenjen liječenju of a bolesti ili stanja kod kojeg posreduje GSK-3.

20. Upotreba u skladu s patentnim zahtjevom 19, **naznačena time** što bolest ili stanje je dijabetes, stanja povezana s dijabetesom, kronična neurodegenerativna stanja, uključujući demencije, poput Alzheimerove bolesti, Parkinsonove bolesti, progresivne supranuklearne paralize, subakutnog sklerozirajućeg panencefalitičnog parkinsonizma, postencefalitičnog parkinsonizma, boksakog encefalitisa, guamskog parkinsonizam-demencija kompleksa, Pickove bolesti, kortikobazalne degeneracije, frontotemporalne demencije, Huntingtonove bolesti, demencije povezane s AIDS-om, amiotrofične lateralne skleroze, multiple skleroze; neurotraumatske bolesti, poput akutnog inzulta, epilepsije; poremećaji raspoloženja, poput depresije, shizofrenije i bipolarnih poremećaja; poticanje funkcionalnog oporavka nakon inzulta, cerebralno krvarenje, primjerice zbog solitarne cerebralne amiloidne angiopatije, gubitak kose, pretilost, aterosklerotična kardiovaskularna bolest, hipertenzija, sindrom policističnih jajnika, sindrom X, ishemija, ozljeda mozga, traumatska ozljeda mozga, rak, leukopenija, Downov sindrom, bolest Lewyjevih tjelešaca, upala, kronične upalne bolesti, rak i hiperproliferativne bolesti, poput hiperplazija, te imunodeficijencija.

21. Upotreba u skladu s patentnim zahtjevom 20, **naznačena time** što bolest je Alzheimerova bolest.

22. Upotreba u skladu s patentnim zahtjevom 20, **naznačena time** što bolest je dijabetes tip II.

23. Upotreba u skladu s patentnim zahtjevom 20, **naznačena time** što bolest je depresija.

24. Upotreba u skladu s patentnim zahtjevom 20, **naznačena time** što bolest je ozljeda mozga.

25. Upotreba u skladu s patentnim zahtjevom 20, **naznačena time** što bolest je progresivna supranuklearna paraliza.

26. Upotreba spojeva formule (I) u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1-13, **naznačena time** što ih se upotrebljava kao reagentse za biološka ispitivanja, po mogućnosti kao reagensa za inhibiranje GSK-3.