



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20140965 T1

HR P20140965 T1

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

(51) MKP:

C07C 211/31 (2006.01)
C07C 251/34 (2006.01)
C07C 251/54 (2006.01)
A61K 31/15 (2006.01)
C07D 211/46 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 21.11.2014.

(21) Broj predmeta: P20140965T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 07.10.2014.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2011068702
Datum podnošenja međunarodne prijave: 26.10.2011.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 11776414.2
Datum podnošenja europske prijave patenta: 26.10.2011.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2012055894
Datum međunarodne objave: 03.05.2012.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2632892 A1
Datum objave europske prijave patenta: 04.09.2013.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2632892 B1
Datum objave europskog patenta: 30.07.2014.

(31) Broj prve prijave: 10189058

(32) Datum podnošenja prve prijave: 27.10.2010.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: EP

(73) Nositelj patenta:

**SIGMA-TAU Industrie Farmaceutiche Riunite S.p.A., Viale Shakespeare
47, 00144 Rome, IT**

(72) Izumitelji:

Alberto Cerri, Via Barnaba Oriani 55, 20156 Milan, IT
Mauro Gobbini, Via Clerici 165/12, 21020 Mercurio (VA), IT
Marco Torri, Via Monte Grappa 20, 2017 Rho (MI), IT
Patrizia Ferrari, Via Gasparotto 57/A, 21100 Varese, IT
Mara Ferrandi, Via Cenisio 34, 20154 Milano, IT
Giuseppe Bianchi, Piazza Adigrat 4, 20133 Milan, IT
Hraste & Partneri odvjetničko društvo, 10000 Zagreb, HR

(74) Zastupnik:

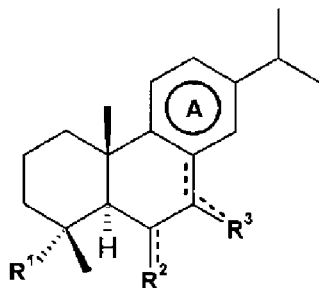
(54) Naziv izuma:

DITERPENOIDNI DERIVATI KOJI POSJEDUJU BIOLOŠKA SVOJSTVA

HR P20140965 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

1. Spoj s općom formulom I



I

naznačen time što:

R^1 je $-\text{CH}=\text{NOR}^4$, sa značenjem iminoksi, $-\text{CH}_2\text{NHOR}^4$, $-\text{CH}_2\text{XR}^5$, $-\text{CH}=\text{CHR}^6$, $-\text{CH}=\text{NR}^7$, amino- (C_3-C_6) alkil ili heterocikloalkil-alkil, gdje se heterocikloalkilni ostatak bira iz skupine koju čine piperidinil, pirolidinil i tetrahidrofuranil;

R^7 je gvanidino;

R^6 je amino- (C_1-C_6) alkil ili heterocikloalkil-alkil, gdje se heterocikloalkilni ostatak bira iz skupine koju čine piperidinil, pirolidinil i tetrahidrofuranil;

R^5 je amino- (C_1-C_6) alkil ili heterocikloalkil-alkil, gdje se heterocikloalkilni ostatak bira iz skupine koju čine piperidinil, pirolidinil i tetrahidrofuranil;

R^4 je H, amino- (C_1-C_6) alkil, heterocikloalkil, hidroksialkil, hidroksialkiloksialkil ili karboksialkil;

X je O ili S;

endociklički simbol $---$ predstavlja jednostruku ili dvostruku vezu, gdje kada predstavlja dvostruku vezu, simbol $---$ koji povezuje R^3 s karbociklom predstavlja jednostruku vezu, a karbociklički prsten A je djelomično nezasićen;

simbol $---$ koji povezuje R^2 s karbociklom predstavlja jednostruku ili dvostruku vezu;

R^2 je H ili hidroksil kada simbol $---$ koji povezuje R^2 s karbociklom predstavlja jednostruku vezu; ili

R^2 je O ili $\text{N}-\text{OR}^8$ kada simbol $---$ koji povezuje R^2 s karbociklom predstavlja dvostruku vezu, sa značenjem karbonila odnosno oksima;

R^8 je H ili (C_1-C_6) alkil;

simbol $---$ koji povezuje R^3 s karbociklom predstavlja jednostruku ili dvostruku vezu;

R^3 je H kada simbol $---$ koji povezuje R^3 s karbociklom predstavlja jednostruku vezu; ili

R^3 je O ili $\text{N}-\text{OR}^8$ kada simbol $---$ koji povezuje R^3 s karbociklom predstavlja dvostruku vezu, sa značenjem karbonila odnosno oksima;

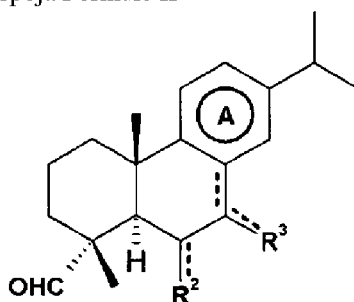
karbociklički prsten A je aromatski ili djelomično nezasićen;

uz uvjet da kada je R^4 H, R^2 nije H;

njihovi optički aktivni oblici, poput enantiomera, diastereomera, njihovih racemičnih oblika, te njihove farmaceutski prihvatljive soli.

2. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što R^1 predstavlja $-\text{CH}=\text{NOR}^4$.

3. Spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1-2, **naznačen time** što je R^4 amino-(C_1 - C_6)alkil ili heterocikloalkil.
4. Upotreba spojeva u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1-3, **naznačena time** što se spojeve upotrebljava kao medikamente.
5. Upotreba u skladu s patentnim zahtjevom 4, **naznačena time** što je namijenjena sprječavanju i/ili liječenju hipertenzije, srčane insuficijencije, hipertrofije srca, bubrežne insuficijencije, glomeruloskleroze, proteinurije i stenoze krvnih žila nakon kirurškog zahvata na krvnim žilama.
6. Upotreba u skladu s patentnim zahtjevom 5, **naznačen time** što je kardiovaskularni poremećaj hipertenzija.
7. Upotreba u skladu s patentnim zahtjevom 6, **naznačen time** što hipertenzija je posljedica djelovanja endogenog ouabaina.
8. Farmaceutski pripravak, **naznačen time** što sadrži spoj u skladu s patentnim zahtjevima 1-3, uz farmaceutski prihvatljivu pomoćnu tvar.
9. Postupak sinteze spojevi u skladu s patentnim zahtjevom 1, gdje je simbol R^1 -CH=NOR⁴, sa značenjem iminoksi; karbociklički prsten A je aromatski ili djelomično nezasićen, a R^2 i R^3 su definirani kao u patentnom zahtjevu 1, **naznačen time** što se sastoji u reakciji spoja Formule II



Formula (II)

gdje je karbociklički prsten A aromatski ili djelomično nezasićen, a R^2 i R^3 su definirani kao gore, sa spojem formule (III)



gdje je R^4 definiran kao gore, a x je cijeli broj između 0 i 3;

u piridinu, na sobnoj temperaturi.