



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20150518 T1

HR P20150518 T1

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

(51) MKP:

C07D 235/18 (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01)
A61K 31/4184 (2006.01)
A61P 31/04 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 17.07.2015.

(21) Broj predmeta: P20150518T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 14.05.2015.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/GB2009002792
Datum podnošenja međunarodne prijave: 01.12.2009.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 09795514.0
Datum podnošenja europske prijave patenta: 01.12.2009.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2010063996
Datum međunarodne objave: 10.06.2010.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2373631 A2
Datum objave europske prijave patenta: 12.10.2011.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2373631 B1
Datum objave europskog patenta: 25.02.2015.

(31) Broj prve prijave: 0821913

(32) Datum podnošenja prve prijave: 02.12.2008.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: GB

(73) Nositelj patenta:

Summit Therapeutics plc, 85B Park Drive, Milton Park, Abingdon, OX14 4RY Oxfordshire, GB

(72) Izumitelj:

Francis Xavier Wilson, Summit Corporation PLC, 91 Milton Park, Abingdon, OX14 4RY Oxfordshire, GB

Peter David Johnson, Summit Corporation PLC, 91 Milton Park, Abingdon, OX14 4RY Oxfordshire, GB

Richard Vickers, Summit Corporation PLC, 91 Milton Park, Abingdon, OX14 4RY Oxfordshire, GB

Richard Storer, Summit Corporation PLC, 91 Milton Park, Abingdon, OX14 4RY Oxfordshire, GB

Graham Michael Wynne, Summit Corporation PLC, 91 Milton Park, Abingdon, OX14 4RY Oxfordshire, GB

Alan Geoffrey Roach, Summit Corporation PLC, 91 Milton Park, Abingdon, OX14 4RY Oxfordshire, GB

Olivier De Moor, Summit Corporation PLC, 91 Milton Park, Abingdon, OX14 4RY Oxfordshire, GB

Colin Richard Dorgan, Summit Corporation PLC, 91 Milton Park, Abingdon, OX14 4RY Oxfordshire, GB

Paul James Davis, Summit Corporation PLC, 91 Milton Park, Abingdon, OX14 4RY Oxfordshire, GB

(74) Zastupnik:

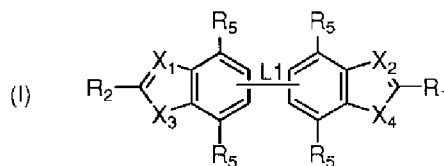
PRODUCTA d.o.o., 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma: **ANTIBAKTERIJSKI SPOJEVI**

HR P20150518 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Spoj s formulom (I):



pri čemu:

L1 je izravna veza;

R¹ i R² su svaki neovisno odabrani od H i proizvoljno supstituiranog C₁₋₆ alkila, arila, heteroarila, karbociklila i heterociklila, proizvoljna supstitucija je s jednim ili više supstituenata odabranih od halo, CN, NO₂, R⁶, OR⁶, N(R⁶)₂, COR⁶, CO₂R⁶, SO₂R⁶, NR⁷COR⁶, NR⁷CO₂R⁶, NR⁷SO₂R⁶, NR⁷CONR⁶R⁷, CONR⁶R⁷ i SO₂NR⁶R⁷, uz uvjet da barem jedan od R¹ i R² je ciklički;

svaki R⁵ je neovisno odabran od H, halo, C₁₋₆ alkil, OR⁷, N(R⁷)₂, CN i NO₂;

X¹ i X² su svaki neovisno odabrani od N i CR³;

X³ je odabran od NR⁴, O i S;

X⁴ je NH; i

R³ je odabran od H, halo i C₁₋₆ alkil; R⁴ je odabran od H i C₁₋₆ alkila; R⁶ je odabran od H, C₁₋₆ alkila, C₂₋₆ alkenila, C₂₋₆ alkinila, C₄₋₇ karbociklila, C₄₋₇ heterociklila i 5- ili 6- članog arila ili heteroarila, od kojih svaki može biti po izboru supstituiran s jednim ili više halo atoma; i R⁷ je odabran od vodika i C₁₋₄ alkila, od kojih svaki je po izboru supstituiran s jednim ili više halo atoma;

ili njegov farmaceutski prihvatljiv N-oksidi, sol, hidrat ili solvat naznačen time da je za uporabu u postupku liječenja: infekcije s *Clostridium difficile* ili bolesti povezane s *Clostridium difficile* (CDAD) koja je odabrana od: (a) kolitisa; (b) pseudomembranskog kolitisa; te (c) proljeva uzrokovanog s *Clostridium difficile*.

2. Spoj za uporabu prema zahtjevu 1 **naznačen time** da X¹ i/ili X² je N.

3. Spoj za uporabu prema zahtjevu 1 ili zahtjevu 2 **naznačen time** da X³ je NR⁴.

4. Spoj za uporabu prema bilo kojem od prethodnih zahtjeva **naznačen time** da R¹ i R² su: (a) svaki neovisno odabrani od H i arila; (b) svaki neovisno odabran od H i arila proizvoljno supstituiranog s OR⁶ i N(R⁶)₂; (c) svaki ciklički; (d) isti; (e) različiti; ili (f) heterociklil ili heteroaril.

5. Spoj za uporabu prema bilo kojem zahtjevu od 1 do 4 **naznačen time** da R¹ i/ili R² je (su): (a) heterociklil supstituiran s jednim ili više supstituenata odabranih od halo, CN, NO₂, R⁶, OR⁶, N(R⁶)₂, COR⁶, CO₂R⁶, SO₂R⁶, NR⁷COR⁶, NR⁷CO₂R⁶, NR⁷SO₂R⁶, NR⁷CONR⁶R⁷, CONR⁶R⁷ i SO₂NR⁶R⁷; ili (b) heteroaril supstituiran s jednim ili više supstituenata odabranih od halo, CN, NO₂, R⁶, OR⁶, N(R⁶)₂, COR⁶, CO₂R⁶, SO₂R⁶, NR⁷COR⁶, NR⁷CO₂R⁶, NR⁷SO₂R⁶, NR⁷CONR⁶R⁷, CONR⁶R⁷ i SO₂NR⁶R⁷.

6. Spoj za uporabu prema zahtjevu 5 **naznačen time** da R¹ i/ili R² je (su) piridil.

7. Spoj za uporabu prema zahtjevu 6 **naznačen time** da piridil je supstituiran s jednim ili više supstituenata odabranih od halo, CN, NO₂, R⁶, OR⁶, N(R⁶)₂, COR⁶, CO₂R⁶, SO₂R⁶, NR⁷COR⁶, NR⁷CO₂R⁶, NR⁷SO₂R⁶, NR⁷CONR⁶R⁷, CONR⁶R⁷ i SO₂NR⁶R⁷.

8. Spoj za uporabu prema bilo kojem od prethodnih zahtjeva **naznačen time** da R⁶ je odabran od H i C₁₋₆ alkila i/ili svaki R⁵ je H.

9. Spoj za uporabu prema bilo kojem od prethodnih zahtjeva **naznačen time** da L1 je izravna veza između 5 i/ili 6 položaja na svakom ciklu.

10. Spoj za uporabu prema zahtjevu 1 **naznačen time** da je 2,2'-di(piridin-4-il)-1H,1'H-5,5'-bibenzo[d]imidazol, ili njegov farmaceutski prihvatljiv N-oksidi, sol, hidrat ili solvat.

11. Spoj za uporabu prema zahtjevu 1 **naznačen time** da je odabran od:

4,4'-(1H,3'H-5,5'-bibenzo[d]imidazol-2,2'-diil)dianilina;

3,3'-(1H,1'H-5,5'-bibenzo[d]imidazol-2,2'-diil)dianilina;

4,4'-(1H,1'H-5,5'-bibenzo[d]imidazol-2,2'-diil)difenola;

4,4'-(3'-metil-1H,3'H-5,5'-bibenzo[d]imidazol-2,2'-diil)dianilina;

4,4'-(1-metil-1H,1'H-5,5'-bibenzo[d]imidazol-2,2'-diil)dianilina;

4,4'-(1H,1'H-5,5'-bibenzo[d]imidazol-2,2'-diil)bis(N-metilnilin);

2,2'-bis(4-metoksifenil)-1H,1'H-5,5'-bibenzo[d]imidazola;

4-((1H,1'H-5,5'-bibenzo[d]imidazol-2-il)anilina;

4-((2'-fenil-1 H,1'H-5,5'-bibenzo[d]imidazol-2-il)anilina;

2'-(4-metoksifenil)-2-fenil-1H,3'H-5,5'-bibenzo[d]imidazola;

5,5'-(1H,1'H-5,5'-bibenzo[d]imidazol-2,2'-diil)dipiridin-2-amina;

2,2'-di(piridin-4-il)-1H,1'H-5,5'-bibenzo[d]imidazola; te

farmaceutski prihvatljivi N-oksidi, soli, hidrati ili solvati bilo kojeg od gore navedenih spojeva.

12. Spoj za uporabu prema zahtjevu 1 **naznačen time** da:

R^1 i R^2 su svaki neovisno odabrani od H i proizvoljno supstituiranog arila, heteroarila, a proizvoljna supstitucija je s jednim ili više supstituenata odabranih od OR^6 , $N(R^6)_2$, uz uvjet da najmanje jedan od R^1 i R^2 je ciklički;

R^5 je H;

X^1 i X^2 su N;

X^3 je NR^4 , pri čemu R^4 je H ili metil; i

X^4 je NH.

13. Spoj za uporabu prema bilo kojem od prethodnih zahtjeva **naznačen time** da navedeni postupak liječenja CDAD pošteđuje normalnu crijevnu floru.

14. Spoj za uporabu prema bilo kojem od prethodnih zahtjeva **naznačen time** da navedeni postupak liječenja CDAD je za podskupinu pacijenata odabranu od: (a) subjekata koji su podvrgavani, ili se podvrgavaju tretmanu s inhibitorima protonske pumpe; (b) subjekata koji su podvrgavani, ili se podvrgavaju tretmanu s antagonistima H_2 receptora; (c) subjekata koji su podvrgavani, ili se podvrgavaju tretmanu s diureticima; (d) hospitaliziranih subjekata; (e) subjekata s unutarnjim cjevčicama za hranjenje; (f) subjekata koja se podvrgavaju mehaničkoj ventilaciji; (g) subjekata koji su podvrgavani, ili se podvrgavaju tretmanu s probioticima; te (g) subjekata koji su podvrgavani, ili se podvrgavaju tretmanu, s vankomicinom i/ili metronidazolom.