



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20200324 T1



HR P20200324 T1

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

(51) MKP:

A61K 31/353 (2006.01)
A61K 31/397 (2006.01)
A61K 31/415 (2006.01)
A61K 31/44 (2006.01)
A61K 31/454 (2006.01)
A61K 31/52 (2006.01)
A61P 25/28 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 12.06.2020.

(21) Broj predmeta: P20200324T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 26.02.2020.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2013055728
Datum podnošenja međunarodne prijave: 19.03.2013.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 13710850.2
Datum podnošenja europske prijave patenta: 19.03.2013.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2014146699
Datum međunarodne objave: 25.09.2014.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2976074 A1
Datum objave europske prijave patenta: 27.01.2016.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2976074 B1
Datum objave europskog patenta: 01.01.2020.

(73) Nositelj patenta:

**Universitat Pompeu-Fabra, Unitat d-Innovacio i Parcs de Recerca, Ed.
Mercè Rodoreda, Ramon Trias Fargas 25-27, 08005 Barcelona, ES**

(72) Izumitelji:

**Andrés Ozaita Mintegui, Laboratorio de Neurofarmacología, Universitat
Pompeu Fabra PRBB, C/ Dr Aiguader 88, 08003 Barcelona, ES
Arnau Busquets García, Laboratorio de Neurofarmacología, Universitat
Pompeu Fabra PRBB, C/ Dr Aiguader 88, 08003 Barcelona, ES
Rafael Maldonado López, Laboratorio de Neurofarmacología, Universitat
Pompeu Fabra PRBB, C/ Dr Aiguader 88, 08003 Barcelona, ES**

(74) Zastupnik:

Odvjetnica Željka Filipčić, 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma:

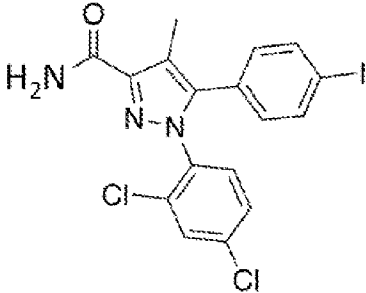
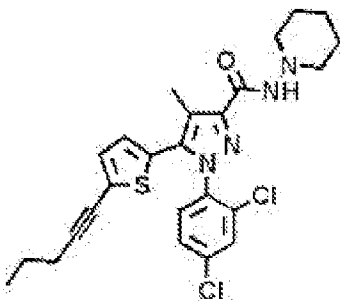
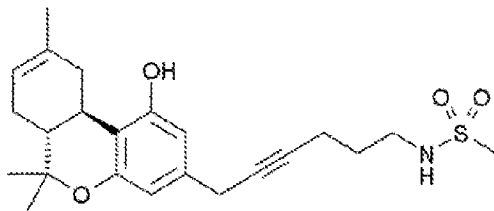
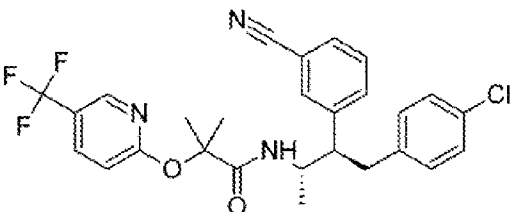
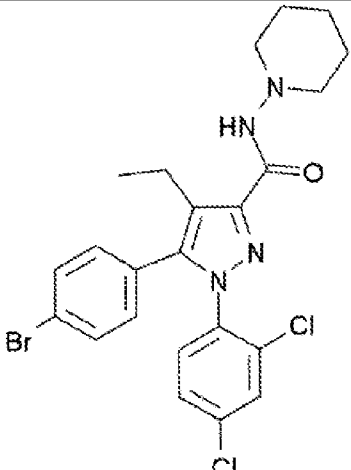
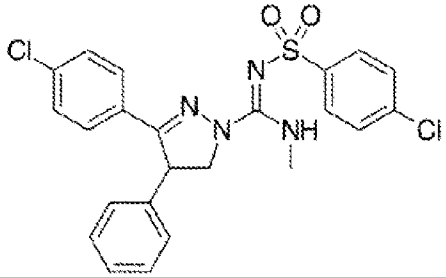
**ANTAGONISTI KANABINOIDNOG RECEPTORA CB1 ZA UPOTREBU U LIJEČENJU BOLESTI
POVEZANIH S NEURONALNIM DENDRITIČKIM ABNORMALNOSTIMA**

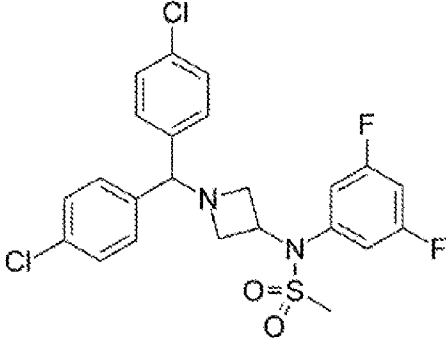
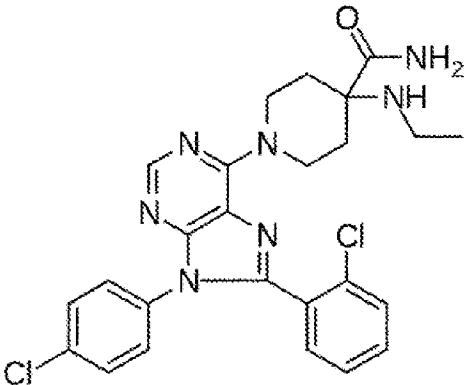
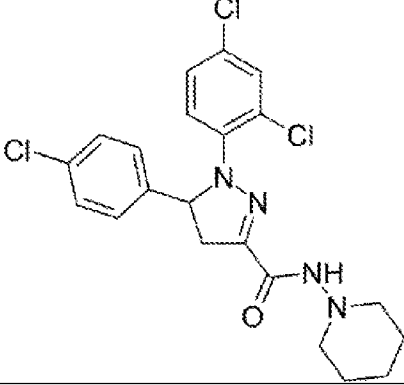
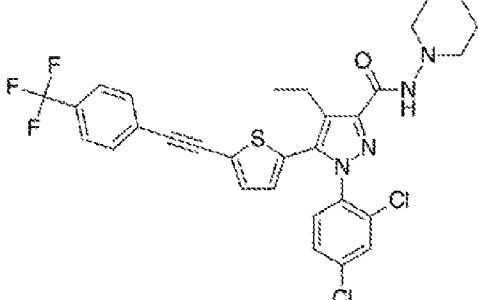
HR P20200324 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Antagonist kanabinoidnog receptora CB1 odabran od neutralnog antagonista ili inverznog agonista kanabinoidnog receptora CB1, za upotrebu u sprječavanju ili liječenju bolesti povezane s neuronalnim dendritičkim abnormalnostima, pri čemu rečene dendritičke abnormalnosti nisu uzrokovane vanjskim stimulusom, već potječu od poremećenog sazrijevanja neuronalne dendritičke plastičnosti.
2. Antagonist kanabinoidnog receptora CB1 za upotrebu prema patentnom zahtjevu 1, pri čemu je rečeni antagonist odabran iz skupine koju čine spojevi iz Tablice 1:

Ime	Formula
SR141716A (Rimonabant) 5-(4-klorfenil)-1-(2,4-diklorfenil)-4-metil- <i>N</i> -(piperidin-1-il)-1 <i>H</i> -pirazol-3-karboksamid	
AM4113	
AM251 1-(2,4-diklorfenil)-5-(4-jodfenil)-4-metil- <i>N</i> -(1-piperidil)pirazol-3-karboksamid	
VCHSR1 5-(4-klorfenil)-3-[(<i>E</i>)-2-cikloheksiletenil]-1-(2,4-diklorfenil)-4-metil-1 <i>H</i> -pirazol	

AM6527	
BPR0432	
O-2050 (6aR,10aR)-3-(1-metansulfonilamino-4-heksin-6-il)-6a,7,10,10a-tetrahidro-6,6,9-trimetil-6H-dibenzo[b,d]piran	
MK0364 (Taranabant) <i>N</i> -[(2 <i>S</i> ,3 <i>S</i>)-4-(4-klorfenil)-3-(3-cijanofenil)-2-butanil]-2-metil-2-{[5-(trifluormetil)-2-piridinil]oksi}propanamid	
SR147778 (Surinabant) 5-(4-bromfenil)-1-(2,4-diklorfenil)-4-etil- <i>N</i> -(1-piperidinil)-1 <i>H</i> -pirazol-3-karboksamid	
SLV319 ili BMS.646,256 (Ibipinabant) 4 <i>S</i> -(-)-3-(4-klorfenil)- <i>N</i> -metil- <i>N'</i> -[(4-klorfenil)sulfonil]-4-fenil-4,5-dihidro-1 <i>H</i> -pirazol-1-karboksamidin	

AVE1625 (Drinabant) (±)-<i>N</i>-{ 1-[<i>bis</i>(4-klorfenil)metil]-3-azetidilil } -<i>N</i>-(3,5-difluorofenil)metansulfonamid	
CP-945,598 (Otenabant) 1-[8-(2-klorfenil)-9-(4-klorfenil)-9<i>H</i>-purin-6-il]-4-(etilamino)piperidine-4-karboksamid	
E-6776 (Rosonabant) (±)-5-(4-klorfenil)-1-(2,4-diklorfenil)-<i>N</i>-(1-piperidinil)-4,5-dihidro-1<i>H</i>-pirazol-3-karboksamid	
TM38837 1-(2,4-diklorfenil)-4-etil-5-(5-(2-(4-(trifluorometil)fenil)etil)tiofen-2-il)-<i>N</i>-(piperidin-1-il)-1<i>H</i>-pirazol-3-karboksamid	

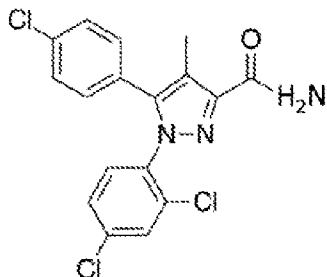
ili njihove farmaceutske prihvatljive soli.

3. Antagonist kanabinoidnog receptora CB1 za upotrebu prema patentnom zahtjevu 2, pri čemu je rečeni antagonist spoj 5-(4-klorfenil)-1-(2,4-diklorfenil)-4-metil-*N*-(piperidin-1-il)-1*H*-pirazol-3-karboksamid ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol.
4. Antagonist kanabinoidnog receptora CB1 za upotrebu prema patentnom zahtjevu 2, pri čemu je rečeni antagonist odabran od:
 - 1-(2,4-diklorfenil)-5-(4-jodfenil)-4-metil-*N*-(1-piperidinil)pirazol-3-karboksamid,
 - (6a*R*,10a*R*)-3-(1-metansulfonilamino-4-heksin-6-il)-6a,7,10,10a-tetrahidro-6,6,9-trimetil-6*H*-dibenzo[*b,d*]piran,
 - *N*-[(2*S*,3*S*)-4-(4-klorfenil)-3-(3-cijanofenil)-2-butanil]-2-metil-2-{[5-(trifluorometil)-2-piridinil]oksi}propanamid,
 - 5-(4-bromfenil)-1-(2,4-diklorfenil)-4-etil-*N*-(1-piperidinil)-1*H*-pirazol-3-karboksamid,
 - 4*S*-(*-*)-3-(4-klorfenil)-*N*-metil-*N'*-(4-klorfenil)-sulfonil-4-fenil-4,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-karboksamidin,

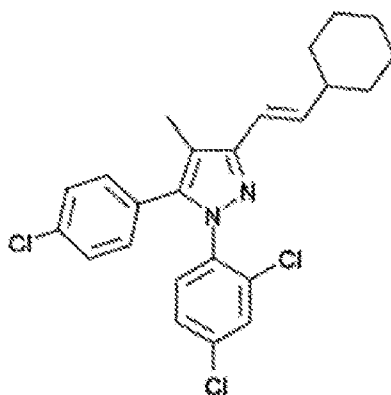
- ($\pm$)-*N*-{1-[*bis*(4-klorfenil)metil]-3-azetidini]-*N*-(3,5-difluorofenil)-metansulfonamid,
- 1-[8-(2-klorfenil)-9-(4-klorfenil)-9H-purin-6-il]-4-(etilamino)piperidin-4-karboksamid, te
- ($\pm$)-5-(4-klorfenil)-1-(2,4-diklorfenil)-*N*-(1-piperidinil)-4,5-dihidro-1*H*-pirazol-3-karboksamid ili njihova farmaceutske prihvatljiva sol.

5. Antagonist kanabinoidnog receptora CB1 za upotrebu prema patentnom zahtjevu 2, pri čemu je rečeni antagonist odabran od:

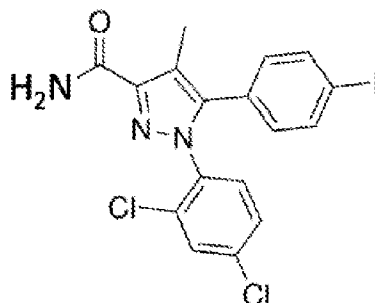
- Spoj AM4113 formule



- Spoj VCHSR1 formule:

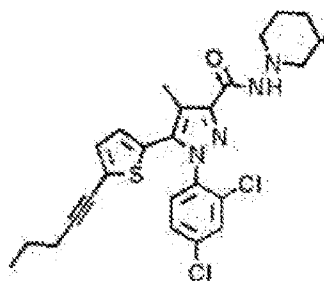


- Spoj AM6527 formule:



te

- Spoj BPR0432 formule:



ili njihova farmaceutske prihvatljiva sol.

- Antagonist kanabinoidnog receptora CB1 za upotrebu prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1-5, pri čemu je bolest povezana s piramidalnim neuronalnim dendritičkim abnormalnostima.
- Antagonist kanabinoidnog receptora CB1 za upotrebu prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1-6, pri čemu neuronalne dendritičke abnormalnosti jesu nenormalna morfologija i/ili broj dendritičkih trnova.
- Antagonist kanabinoidnog receptora CB1 za upotrebu prema patentnom zahtjevu 7, pri čemu je broj dendritičkih trnova povećan.

9. Antagonist kanabinoidnog receptora CB1 za upotrebu prema patentnom zahtjevu 8, pri čemu je broj nezrelih trnova (tanki i zadebljani trnovi) povećan.
10. Antagonist kanabinoidnog receptora CB1 za upotrebu prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 9, pri čemu se rečeni antagonist daje oralno.
- 5 11. Antagonist kanabinoidnog receptora CB1 za upotrebu prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 10, pri čemu se rečeni antagonist daje intraperitonealno.
12. Antagonist kanabinoidnog receptora CB1 za upotrebu prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 11, pri čemu je rečena bolest odabrana iz skupine koju čine Downov sindrom, Angelmanov sindrom, Rettov sindrom i tuberozna skleroza.
- 10 13. Antagonist kanabinoidnog receptora CB1 za upotrebu prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 11, pri čemu je rečena bolest uzrokovana mutacijom koja onemogućuje gen FMR1.