



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20241527 T1

HR P20241527 T1

(12) PRIJEVOD PATENTNIH ZAHTEJEVA EUROPSKOG PATENTA

(51) MKP:

C07D 207/16 (2006.01)
A61P 25/00 (2006.01)
A61P 25/18 (2006.01)
A61P 25/24 (2006.01)
A61P 25/28 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 03.01.2025.

(21) Broj predmeta: P20241527T

(22) Datum podnošenja: 06.07.2021.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2021068577
Datum podnošenja međunarodne prijave: 06.07.2021.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 21739678.7
Datum podnošenja europske prijave patenta: 06.07.2021.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2022008477
Datum međunarodne objave: 13.01.2022.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 4178945 A1
Datum objave europske prijave patenta: 17.05.2023.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 4178945 B1
Datum objave europskog patenta: 28.08.2024.

(31) Broj prve prijave: 20382606

(32) Datum podnošenja prve prijave: 07.07.2020.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: EP

(73) Nositelj patenta:

Accure Therapeutics, S.L., Baldiri Reixac, 4-8, Torres I, 5a Planta, 08028 Barcelona, ES

(72) Izumitelji:

Teresa Tarragó Clua, 08028 Barcelona, ES
Roger Prades Cosano, 08028 Barcelona, ES

(74) Zastupnik:

Hraste & Partneri odvjetničko društvo d.o.o., 10000 Zagreb, HR

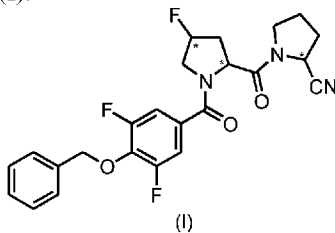
(54) Naziv izuma:

1-[1-(4-BENZILOKSI-3,5-DIFLUORBENZOIL)-4-FLUORPIROLIDIN-2-KARBONIL]PIROLIDIN-2-KARBONITRIL

HR P20241527 T1

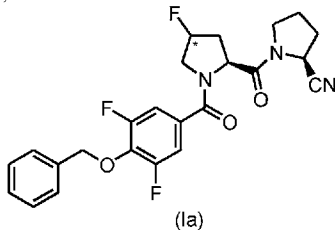
PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Spoj, **naznačen time** što ima formulu (I):



5 (gdje zvjezdice označuju kiralne centre), njegovi stereoizomeri i njegove soli.

2. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što ima formulu (Ia):



njegovi stereoizomeri i njegove soli.

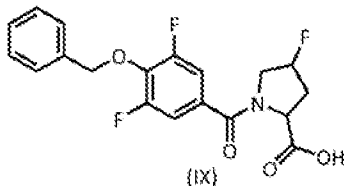
3. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što se navedeni spoj bira između:

- (S)-1-((2S,4R)-1-(4-(benziloksi)-3,5-difluorbenzoyl)-4-fluoropirolidin-2-karbonil)pirolidin-2-karbonitrila
- (R)-1-((2S,4R)-1-(4-(benziloksi)-3,5-difluorbenzoyl)-4-fluoropirolidin-2-karbonil)pirolidin-2-karbonitrila
- (S)-1-((2R,4R)-1-(4-(benziloksi)-3,5-difluorbenzoyl)-4-fluoropirolidin-2-karbonil)pirolidin-2-karbonitrila
- (R)-1-((2R,4R)-1-(4-(benziloksi)-3,5-difluorbenzoyl)-4-fluoropirolidin-2-karbonil)pirolidin-2-karbonitrila
- (S)-1-((2S,4S)-1-(4-(benziloksi)-3,5-difluorbenzoyl)-4-fluoropirolidin-2-karbonil)pirolidin-2-karbonitrila
- (R)-1-((2S,4S)-1-(4-(benziloksi)-3,5-difluorbenzoyl)-4-fluoropirolidin-2-karbonil)pirolidin-2-karbonitrila
- (S)-1-((2R,4S)-1-(4-(benziloksi)-3,5-difluorbenzoyl)-4-fluoropirolidin-2-karbonil)pirolidin-2-karbonitrila
- (R)-1-((2R,4S)-1-(4-(benziloksi)-3,5-difluorbenzoyl)-4-fluoropirolidin-2-karbonil)pirolidin-2-karbonitrila,

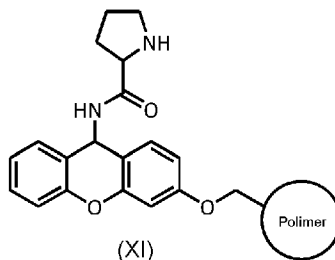
i njihovih soli.

4. Postupak pripreve spoja formule (I) u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 3, **naznačen time** što se sastoji u:

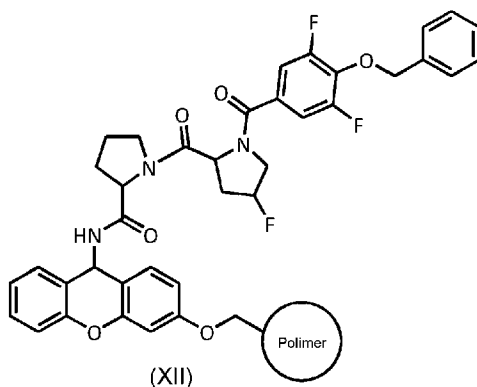
- a) reakciji spoja formule (IX):



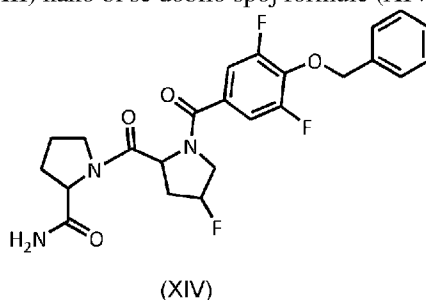
sa spojem formule (XI):



kako bi se dobilo spoj formule (XII):



b) hidrolizi spoja formule (XII) kako bi se dobilo spoj formule (XIV):

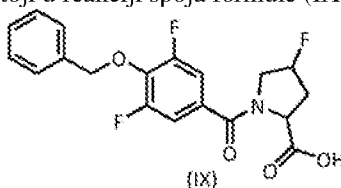


i

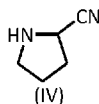
c) podvrgavanju spoja formule (XIV) uvjetima koji omogućuju pretvorbu karboksamidne skupine u nitrilnu skupinu kako bi se dobilo spoj formule (I):

gdje se korake b) i c) može provoditi odvojeno ili reakcijom u jednoj posudi.

5. Postupak pripreme spoja formule (I) u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 3, njegovi stereoizomeri i njegove soli, **naznačen time** što se sastoji u reakciji spoja formule (IX):



sa spojem formule (IV):



6. Farmaceutski pripravak, **naznačen time** što sadrži najmanje jedan spoj formule (I) u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 3, njegove stereoizomere i njegove farmaceutski prihvatljive soli, kao i farmaceutski prihvatljivi nosač, adjuvans ili vehikulum.
7. Spoj formule (I) u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 3, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi kao medikament.
8. Spoj formule (I) u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 3, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi u liječenju i/ili profilaksi kognitivnog poremećaja.
9. Spoj namijenjen upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 8, **naznačen time** što je kognitivni poremećaj kognitivni poremećaj povezan s bolešću koju se bira iz skupine koju čine shizofrenija, veliki depresivni poremećaj, bipolarni afektivni poremećaj, poremećaj ponašanja u REM snu, Alzheimerova bolest, frontotemporalna demencija, Parkinsonova bolest, bolest Lewyjevih tjelešaca, atrofija višestrukih sustava, progresivna supranuklearna klijenut, kortikobazalna degeneracija ili amiotrofna lateralna skleroza.