



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20090606 T1

HR P20090606 T1

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

(51) MKP:

C07D 223/00 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 31.01.2010.

(21) Broj predmeta: P20090606T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 11.11.2009.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2004019460
Datum podnošenja međunarodne prijave: 16.06.2004.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 04809449.4
Datum podnošenja europske prijave patenta: 16.06.2004.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2005037795
Datum međunarodne objave: 28.04.2005.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 1633719 A2
Datum objave europske prijave patenta: 15.03.2006.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 1633719 B1
Datum objave europskog patenta: 07.10.2009.

(31) Broj prve prijave: 479378 P

(32) Datum podnošenja prve prijave: 17.06.2003.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelji:

(74) Zastupnik:

Janssen Pharmaceutica N.V., Turnhoutseweg 30, 2340 Beerse, BE
Mona Patel, 201 Tomahawk Court, Belle Mead, 08502 NJ, US
Philip J. Rybczynski, 29 Tuscarora Trail, Branchburg, 08876 NJ, US
Min Amy Xiang, 29 Forest Avenue, Bridgewater, 08807 NJ, US
CPZ - CENTAR ZA PATENTE d.d., 10000 Zagreb, HR

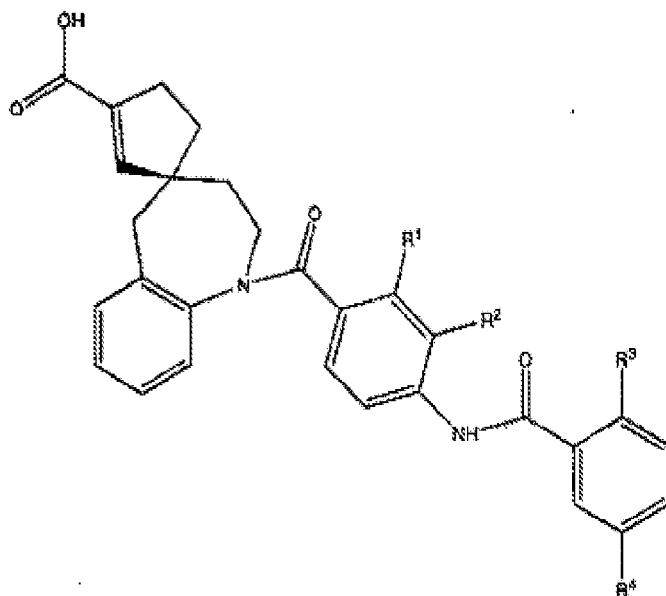
(54) Naziv izuma:

SUPSTITUIRANI SPIROBENZAZEPINI

HR P20090606 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Spoj Formule I:



I

naznačen time, da je

jedan od R^1 i R^2 je H i drugi je H, NR^5R^6 , C_{1-6} alkoksi, hidroksi, ili halo; gdje je svaki od R^5 i R^6 neovisno H ili C_{1-3} alkil;

R^3 je klor;

R^4 je klor, fluor, metoksi ili metil;

ili farmaceutski prihvatljiv C_{1-6} ester, C_{1-6} amid, ili di (C_{1-6} alkil)amid ili njegova sol.

2. Spoj iz zahtjeva 1, **naznačen time**, da je R^2 amino.

3. Spoj iz zahtjeva 1, **naznačen time**, da je R^2 C_{1-4} alkoksi.

4. Spoj iz zahtjeva 1, **naznačen time**, da je R^2 metoksi, etoksi, propoksi, izopropoksi, butoksi, izobutoksi, ili t-butoksi.

5. Spoj iz zahtjeva 4, **naznačen time**, da je R^2 metoksi ili etoksi.

6. Spoj iz zahtjeva 1, **naznačen time**, da je R^4 fluor, klor, ili metil.

7. Spoj zahtjeva 1, **naznačen time**, da je R^4 fluor ili klor.

8. Spoj zahtjeva 1, **naznačen time**, da je R^4 fluor.

9. Spoj zahtjeva 6, **naznačen time**, da je R^2 metoksi, etoksi ili izopropoksi.

10. Spoj zahtjeva 6, **naznačen time**, da je R^1 metoksi ili etoksi.

11. Spoj zahtjeva 7, **naznačen time**, da je R^2 metoksi ili etoksi.

12. Spoj zahtjeva 1, **naznačen time**, da je izabran od:

(R)-4-(2-Klor-5-fluorobenzil-3-metoksi-4-aminobenzil)-4-aza-3'-(karboksi)-[6,4]-spiro-[5,6]-benzoundec-2'-en

(R)-4-(2-Klor-5-fluorobenzil-3-etoksi-4-aminobenzil)-4-aza-3'-(karboksi)-[6,4]-spiro-[5,6]-benzoundec-2'-en

(R)-4-(2-Klor-5-fluorobenzil-3-izopropoksi-4-aminobenzil)-4-aza-3'-(karboksi)-[6,4]-spiro-[5,6]-benzoundec-2'-en

(R)-4-(2-Klor-5-fluorobenzil-3-hidroksi-4-aminobenzil)-4-aza-3'-(karboksi)-[6,4]-spiro-[5,6]-benzoundec-2'-en

(R)-4-(2-Klor-5-fluorobenzil-4-aminobenzil)-4-aza-3'-(karboksi)-[6,4]-spiro-[5,6]-benzoundec-2'-en

(R)-4-(2-Klor-5-fluorobenzil-3-amino-4-aminobenzil)-4-aza-3'-(karboksi)-[6,4]-spiro-[5,6]-benzoundec-2'-en

(R)-4-(2-Klor-5-fluorobenzil-3-klor-4-aminobenzil)-4-aza-3'-(karboksi)-[6,4]-spiro-[5,6]-benzoundec-2'-en

(R)-4-(2-Klor-5-fluorobenzil-2-klor-4-aminobenzil)-4-aza-3'-(karboksi)-[6,4]-spiro-[5,6]-benzoundec-2'-en

(R)-4-(2-Klor-5-fluorobenzil-2-amino-4-aminobenzil)-4-aza-3'-(karboksi)-[6,4]-spiro-[5,6]-benzoundec-2'-en

(R)-4-(2-Klor-5-fluorobenzil-2-hidroksi-4-aminobenzil)-4-aza-3'-(karboksi)-[6,4]-spiro-[5,6]-benzoundec-2'-en

(R)-4-(2-Klor-5-fluorobenzil-2-metoksi-4-aminobenzil)-4-aza-3'-(karboksi)-[6,4]-spiro-[5,6]-benzoundec-2'-en

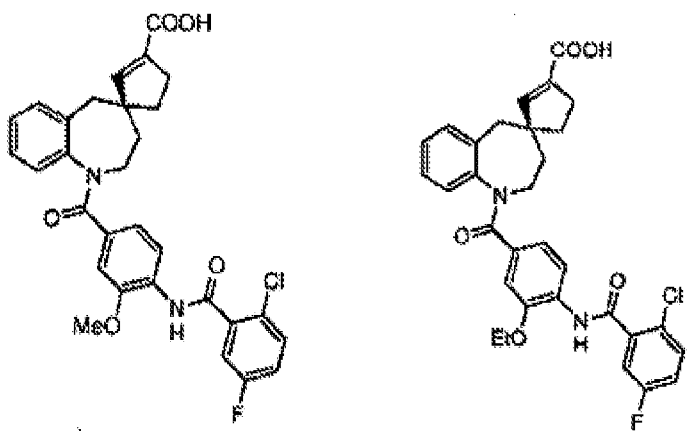
(R)-4-(2-Klor-5-metilbenzil-3-metoksi-4-aminobenzil)-4-aza-3'-(karboksi)-[6,4]-spiro-[5,6]-benzoundec-2'-en

(R)-4-(2-Klor-5-metilbenzil-3-hidroksi-4-aminobenzil)-4-aza-3'-(karboksi)-[6,4]-spiro-[5,6]-benzoundec-2'-en

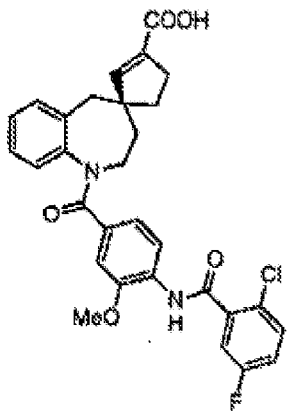
(R)-4-(2-Klor-5-metilbenzil-4-aminobenzil)-4-aza-3'-(karboksi)-[6,4]-spiro-[5,6]-benzoundec-2'-en

- (R)-4-(2-Klor-5-metilbenzoil-3-amino-4-aminobenzoil)-4-aza-3'-(karboksi)-[6,4]-spiro-[5,6]-benzoundec-2'-en
 (R)-4-(2-Klor-5-metilbenzoil-3-klor-4-aminobenzoil)-4-aza-3'-(karboksi)-[6,4]-spiro-[5,6]-benzoundec-2'-en
 (R)-4-(2-Klor-5-metoksibenzoil-3-metoksi-4-aminobenzoil)-4-aza-3'-(karboksi)-[6,4]-spiro-[5,6]-benzoundec-2'-en
 (R)-4-(2-Klor-5-metoksibenzoil-3-hidroksi-4-aminobenzoil)-4-aza-3'-(karboksi)-[6,4]-spiro-[5,6]-benzoundec-2'-en
 (R)-4-(2-Klor-5-metoksibenzoil-4-aminobenzoil)-4-aza-3'-(karboksi)-[6,4]-spiro-[5,6]-benzoundec-2'-en
 (R)-4-(2-Klor-5-metoksibenzoil-3-amino-4-aminobenzoil)-4-aza-3'-(karboksi)-[6,4]-spiro-[5,6]-benzoundec-2'-en
 (R)-4-(2-Klor-5-metoksibenzoil-3-klor-4-aminobenzoil)-4-aza-3'-(karboksi)-[6,4]-spiro-[5,6]-benzoundec-2'-en
 (R)-4-(2,5-Diklorobenzoil-3-metoksi-4-aminobenzoil)-4-aza-3'-(karboksi)-[6,4]-spiro-[5,6]-benzoundec-2'-en
 (R)-4-(2,5-Diklorobenzoil-3-hidroksi-4-aminobenzoil)-4-aza-3'-(karboksi)-[6,4]-spiro-[5,6]-benzoundec-2'-en
 (R)-4-(2,5-Diklorobenzoil-4-aminobenzoil)-4-aza-3'-(karboksi)-[6,4]-spiro-[5,6]-benzoundec-2'-en
 (R)-4-(2,5-Diklorobenzoil-3-amino-4-aminobenzoil)-4-aza-3'-(karboksi)-[6,4]-spiro-[5,6]-benzoundec-2'-en; i
 (R)-4-(2,5-Diklorobenzoil-3-klor-4-aminobenzoil)-4-aza-3'-(karboksi)-[6,4]-spiro-[5,6]-benzoundec-2'-en.

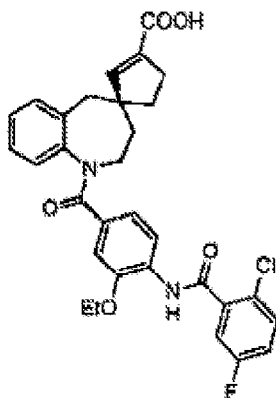
13. Spoj zahtjeva 1, **naznačen time**, da je izabran od



14. Spoj zahtjeva 1, **naznačen time**, da je



15. Spoj zahtjeva 1, **naznačen time**, da je



16. Farmaceutski sastav, **naznačen time**, da sadrži spoj prema Zahtjevu 1 i farmaceutski prihvatljivi nosač.
17. Farmaceutski sastav zahtjeva 16, **naznačen time**, da je spomenuti spoj onaj iz zahtjeva 5, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, ili 15.
- 5 18. Spoj Formule I, kao što je definirano u Zahtjevu 1, za upotrebu u liječenju osobe koja boluje od stanja povezanog s aktivnošću receptora za vazopresin, **naznačen time**, da je spomenuto stanje izabrano od poremećaja unutarnjeg uha, hipertenzije, kongestivnog zatajenja srca, srčane insuficijencije, koronarnog vazospazma, srčane ishemije, jetrene ciroze, bubrežnog vazospazma, zatajenja bubrega, dijabetesne nefropatije, hiponatrijemije, cerebralnog edema, cerebralne ishemije, kapi, tromboze, zadržavanja vode, agresije, opsesivno-kompulsivnih poremećaja, dismenoreje, nefrotičkog sindroma, anksioznosti i ozljeda središnjeg živčanog sustava.
- 10 19. Spoj Formule I, kao što je definirano u Zahtjevu 1, za upotrebu kod osobe kao inhibitora kod napadaja ili progresije kod stanja povezanog s aktivnošću receptora za vazopresin, **naznačen time**, da je spomenuto stanje izabrano od poremećaja unutarnjeg uha, hipertenzije, kongestivnog zatajenja srca, srčane insuficijencije, koronarnog vazospazma, srčane ishemije, ciroze jetre, bubrežnog vazospazma, zatajenja bubrega, dijabetesne nefropatije, hiponatrijemije, cerebralnog edema, cerebralne ishemije, kapi, tromboze, zadržavanja vode, agresije, opsesivnog-kompulsivnih poremećaja, dismenoreje, nefrotičkog sindroma, anksioznosti i ozljeda središnjeg živčanog sustava.
- 15 20. Spoj iz Zahtjeva 18 ili 19, **naznačen time**, da je spomenuto stanje kongestivno zatajenje srca ili srčana insuficijencija.
21. Spoj iz Zahtjeva 18 ili 19, **naznačen time**, da je spomenuto stanje hiponatrijemija.
22. Spoj iz Zahtjeva 18 ili 19, **naznačen time**, da je spomenuto stanje hipertenzija.
- 20 23. Spoj iz Zahtjeva 18 ili 19, **naznačen time**, da je spomenuti spoj onaj iz zahtjeva 5, 8, 9, 10, 13, 14 ili 15.
24. Proces za pripremu farmaceutskog sastava, **naznačen time**, da obuhvaća miješanje bilo kojih od spojeva prema Zahtjevu 1 i farmaceutski prihvatljivog nosača.