



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20120763 T1

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

(51) MKP:

A61K 31/351 (2006.01)
A61P 3/00 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 31.10.2012.

(21) Broj predmeta:

P20120763T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 26.09.2012.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2008000029
Datum podnošenja međunarodne prijave: 04.01.2008.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 08700981.7
Datum podnošenja europske prijave patenta: 04.01.2008.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2008086949
Datum međunarodne objave: 24.07.2008.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2120923 A1
Datum objave europske prijave patenta: 25.11.2009.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2120923 B1
Datum objave europskog patenta: 18.07.2012.

(31) Broj prve prijave: 102007002260

(32) Datum podnošenja prve prijave:

16.01.2007.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: DE

(73) Nositelj patenta:

SANOFI, 54 rue La Boétie, 75008 Paris, FR
Harm Brummerhop, c/o Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, 65926
Frankfurt am Main, DE
Siegfried Stengelin, c/o Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, 65926
Frankfurt am Main, DE
Hubert Heuer, c/o Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, 65926 Frankfurt
am Main, DE
Susanne Kilp, Kirchstrasse 12, 55452 Hergenfeld, DE
Andreas Herling, c/o Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, 65926 Frankfurt
am Main, DE
Thomas Klabunde, c/o Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, 65926
Frankfurt am Main, DE
Dieter Kadereit, c/o Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, 65926 Frankfurt
am Main, DE
Matthias Urmann, c/o Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, 65926
Frankfurt am Main, DE

(74) Zastupnik:

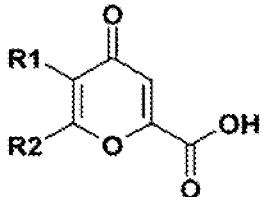
Hraste & Partneri odvjetničko društvo, 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma:

**UPOTREBA SUPSTITUIRANIH DERIVATA PIRANONSKE KISELINE U LIJEĆENJU
METABOLIČKOG SINDROMA**

PATENTNI ZAHTJEVI

- 5 1. Upotreba spoja formule I,



u kojоj

R1 je H, F, Cl, Br, I, OH, CF₃, NO₂, CN, OCF₃, NH₂, NH(C₁-C₆)-alkil, N((C₁-C₆)-alkil)₂, SF₅, SO₂-CH₃, COOH, COO-(C₁-C₆)-alkil, CONH₂, (C₁-C₂₀)-alkil, (C₃-C₂₀)-cikloalkil, (C₂-C₂₀)-alkenil, (C₂-C₂₀)-alkinil, aril, heterocikl, gdje u (C₁-C₂₀)-alkilnim i (C₂-C₂₀)-alkenilnim radikalima jedna ili više pojedinačnih skupina -CH₂- ili -CH- može biti zamijenjeno s -O-, te gdje alkilni, cikloalkilni, alkenilni, alkinilni, aril- i heterociklilni radikali mogu biti supstituirani s jednim ili više

F, Cl, Br, I, CF₃, NO₂, N₃, CN, =O, COOH, COO(C₁-C₆)-alkila, CONH₂, CONH(C₁-C₆)-alkila, CON[(C₁-C₆)-alkil]₂, cikloalkila, (C₁-C₁₀)-alkila, (C₂-C₆)-alkenila, (C₂-C₆)-alkinila, O-(C₁-C₆)-alkila, O-CO-(C₁-C₆)-alkila, O-CO-(C₁-C₆)-arila, O-CO-(C₁-C₆)-heterociklila;

PO₃H₂, P(O)(Oalkil)₂, (C₁-C₆)-alkilen-P(O)(Oalkil)₂, O-P(O)(OH)₂, O-P(O)(Oalkil)₂, SO₃H, SO₂-NH₂, SO₂NH(C₁-C₆)-alkil, SO₂N[(C₁-C₆)-alkil]₂, S-(C₁-C₆)-alkil, S-(CH₂)_n-aril, S-(CH₂)_n-heterociklil, SO-(C₁-C₆)-alkil, SO-(CH₂)_n-aril, SO-(CH₂)_n-heterociklil, SO₂-(C₁-C₆)-alkil, SO₂-(CH₂)_n-aril, SO₂-(CH₂)_n-heterociklil, SO₂-NH(CH₂)_n-aril, SO₂-NH(CH₂)_n-heterociklil, SO₂-N((C₁-C₆)-alkil)(CH₂)_n-aril, SO₂-N((C₁-C₆)-alkil)(CH₂)_n-heterociklil, SO₂-N((CH₂)_n-aril)₂, SO₂-N((CH₂)_n-heterociklil)₂, gdje n = 0-6, a arilni radikal ili heterociklički radikal mogu biti supstituirani s do dva F, Cl, Br, OH, CF₃, SF₅, NO₂, CN, OCF₃, O-(C₁-C₆)-alkila, (C₁-C₆)-alkila, NH₂; C(NH)(NH₂), NH₂, NH-(C₁-C₆)-alkil, N((C₁-C₆)-alkil)₂, NH(C₁-C₇)-acil, NH-CO-(C₁-C₆)-alkil, NH-COO-(C₁-C₆)-alkil, NH-CO-aril, NH-CO-heterociklil, NH-COO-aril, NH-COO-heterociklil, NH-CO-NH-(C₁-C₆)-alkil, NH-CO-NH-aril, NH-CO-NH-heterociklil, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-(C₁-C₆)-alkil, N[(C₁-C₆)-alkil]-COO-(C₁-C₆)-alkil, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-aril, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-heterociklil, N[(C₁-C₆)-alkil]-COO-aril, N[(C₁-C₆)-alkil]-COO-heterociklil, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-NH-(C₁-C₆)-alkil, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-NH-aril, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-NH-heterociklil, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-N((C₁-C₆)-alkil)₂, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-N((C₁-C₆)-alkil)-aril, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-N((C₁-C₆)-alkil)-heterociklil, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-N(aril)₂, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-N(heterociklil)₂, N(aril)-CO-(C₁-C₆)-alkil, N(heterociklil)-CO-(C₁-C₆)-alkil, N(aril)-COO-(C₁-C₆)-alkil, N(heterociklil)-COO-(C₁-C₆)-alkil, N(aril)-CO-aril, N(heterociklil)-CO-aril, N(aril)-COO-aril, N(heterociklil)-COO-aril, N(aril)-CO-NH-(C₁-C₆)-alkil, N(heterociklil)-CO-NH-(C₁-C₆)-alkil, N(aril)-CO-NH-aril, N(heterociklil)-CO-NH-aril, N(aril)-CO-N((C₁-C₆)-alkil)₂, N(heterociklil)-CO-N((C₁-C₆)-alkil)₂, N(aril)-CO-N((C₁-C₆)-alkil)-aril, N(heterociklil)-CO-N((C₁-C₆)-alkil)-aril, N(aril)-CO-N(aril)₂, N(heterociklil)-CON(aril)₂, aril, O-(CH₂)_n-aril, O-(CH₂)_n-heterociklil, gdje n = 0-6, te gdje arilni ili heterociklilni radikal mogu biti supstituirani s jednim do tri F, Cl, Br, I, OH, CF₃, NO₂, CN, OCF₃, O-(C₁-C₆)-alkila, (C₁-C₆)-alkila, NH₂, NH(C₁-C₆)-alkila, N((C₁-C₆)-alkil)₂, SF₅, SO₂-CH₃, COOH, COO-(C₁-C₆)-alkila, CONH₂;

40 R2 je H, F, Cl, Br, I, OH, CF₃, NO₂, CN, OCF₃, NH₂, NH(C₁-C₆)-alkil, N((C₁-C₆)-alkil)₂, SF₅, SO₂-CH₃, COOH, COO-(C₁-C₆)-alkil, CONH₂, (C₁-C₂₀)-alkil, (C₃-C₂₀)-cikloalkil, (C₂-C₂₀)-alkenil, (C₂-C₂₀)-alkinil, aril, heterocikl, gdje u (C₁-C₂₀)-alkilnim i (C₂-C₂₀)-alkenilnim radikalima jedna ili više pojedinačnih skupina -CH₂- ili -CH- može biti zamijenjeno s -O-, te gdje alkilni, cikloalkilni, alkenilni, alkinilni, arilni i heterociklički radikali mogu biti supstituirani s jednim ili više

45 F, Cl, Br, I, CF₃, NO₂, N₃, CN, =O, COOH, COO(C₁-C₆)-alkila, CONH₂, CONH(C₁-C₆)-alkila, CON[(C₁-C₆)-alkil]₂, cikloalkila, (C₁-C₁₀)-alkila, (C₂-C₆)-alkenila, (C₂-C₆)-alkinila, O-(C₁-C₆)-alkila, O-CO-(C₁-C₆)-alkila, O-CO-(C₁-C₆)-arila, O-CO-(C₁-C₆)-heterociklila;

50 PO₃H₂, P(O)(Oalkil)₂, (C₁-C₆)-alkilen-P(O)(Oalkil)₂, O-P(O)(OH)₂, O-P(O)(Oalkil)₂, SO₃H, SO₂-NH₂, SO₂NH(C₁-C₆)-alkil, SO₂N[(C₁-C₆)-alkil]₂, S-(C₁-C₆)-alkil, S-(CH₂)_n-aril, S-(CH₂)_n-heterociklil, SO-(C₁-C₆)-alkil, SO-(CH₂)_n-aril, SO-(CH₂)_n-heterociklil, SO₂-(C₁-C₆)-alkil, SO₂-(CH₂)_n-aril, SO₂-(CH₂)_n-heterociklil, SO₂-NH(CH₂)_n-aril, SO₂-NH(CH₂)_n-heterociklil, SO₂-N((C₁-C₆)-alkil)(CH₂)_n-aril, SO₂-N((C₁-C₆)-alkil)(CH₂)_n-heterociklil, SO₂-N((CH₂)_n-aril)₂, SO₂-N((CH₂)_n-heterociklil)₂, gdje n = 0-6, a arilni radikal ili heterociklički radikal mogu biti supstituirani s do dva F, Cl, Br, OH, CF₃, SF₅, NO₂, CN, OCF₃, O-(C₁-C₆)-alkila, (C₁-C₆)-alkila, NH₂; C(NH)(NH₂), NH₂, NH-(C₁-C₆)-alkil, N((C₁-C₆)-alkil)₂, NH(C₁-C₇)-acil, NH-CO-(C₁-C₆)-alkil, NH-COO-(C₁-C₆)-alkil, NH-CO-aril, NH-CO-NH-

heterociklil, NH-COO-aryl, NH-COO-heterociklil, NH-CO-NH-(C₁-C₆)-alkil, NH-CO-NH-aryl, NH-CO-NH-heterociklil, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-(C₁-C₆)-alkil, N[(C₁-C₆)-alkil]-COO-(C₁-C₆)-alkil, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-aril, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-heterociklil, N[(C₁-C₆)-alkil]-COO-aryl, N[(C₁-C₆)-alkil]-COO-heterociklil, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-NH-(C₁-C₆)-alkil, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-NH-aryl, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-NH-heterociklil, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-N((C₁-C₆)-alkil)₂, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-N((C₁-C₆)-alkil)-aryl, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-N((C₁-C₆)-alkil)-heterociklil, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-N(aril)₂, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-N(heterociklil)₂, N(aril)-CO-(C₁-C₆)-alkil, N(heterociklil)-CO-(C₁-C₆)-alkil, N(aril)-COO-(C₁-C₆)-alkil, N(heterociklil)-COO-(C₁-C₆)-alkil, N(aril)-CO-aryl, N(heterociklil)-CO-aryl, N(aril)-CO-NH-(C₁-C₆)-alkil, N(heterociklil)-CO-NH-(C₁-C₆)-alkil, N(aril)-CO-NH-aryl, N(heterociklil)-CO-NH-aryl, N(aril)-CO-N((C₁-C₆)-alkil)₂, N(heterociklil)-CO-N((C₁-C₆)-alkil)-aryl, N(aril)-CO-N(aril)₂, N(heterociklil)-CON(aril)₂, aril, O-(CH₂)_n-aryl, O-(CH₂)_n-heterociklil, gdje n = 0-6, te gdje arilni ili heterociklilni radikal mogu biti supstituirani s jednim do tri F, Cl, Br, I, OH, CF₃, NO₂, CN, OCF₃, O-(C₁-C₆)-alkila, (C₁-C₆)-alkila, NH₂, NH(C₁-C₆)-alkila, N((C₁-C₆)-alkil)₂, SF₅, SO₂-CH₃, COOH, COO-(C₁-C₆)-alkila, CONH₂;

ili R1 i R2 zajedno tvore 3- do 8-eročlani arilni, cikloalkilni ili heterociklilni prsten, gdje arilni, cikloalkilni ili heterociklilni prsten mogu biti supstituirani s F, Cl, Br, I, OH, CF₃, NO₂, CN, OCF₃, O-(C₁-C₆)-alkilom, (C₁-C₆)-alkilom, NH₂, NH(C₁-C₆)-alkilom, N((C₁-C₆)-alkil)₂, SF₅, SO₂-CH₃, COOH, COO-(C₁-C₆)-alkilom, CONH₂, te gdje arilni, cikloalkilni ili heterociklilni prsten mogu biti kondenzirani s dodatnim arilnim, cikloalkilnim ili heterociklilnim prstenom;

i njegovih fiziološki prihvatljivih soli, **naznačena time** što je navedeni spoj namijenjen proizvodnji medikamenta za liječenje metaboličkog sindroma.

2. Upotreba spoja formule I u skladu s patentnim zahtjevom 1, u kojoj

R1 je H, OH, COOH, (C₁-C₈)-alkil, (C₂-C₈)-alkenil, aril, gdje u (C₁-C₈)-alkilnim i (C₂-C₈)-alkenilnim radikalima jedna ili više pojedinačnih skupina -CH₂- ili -CH- može biti zamijenjeno s -O-, te gdje alkilni, alkenilni i arilni radikali mogu biti supstituirani s jednim ili više

F, Cl, Br, I, CF₃, NO₂, N₃, CN, =O, COOH, COO(C₁-C₆)-alkila, CONH₂, CONH(C₁-C₆)-alkila, CON[(C₁-C₆)-alkil]₂, cikloalkila, (C₁-C₁₀)-alkila, (C₂-C₆)-alkenila, (C₂-C₆)-alkinila, O-(C₁-C₆)-alkila, O-CO-(C₁-C₆)-alkila, O-CO-(C₁-C₆)-arila, O-CO-(C₁-C₆)-heterociklila;

PO₃H₂, P(O)(Oalkil)₂, (C₁-C₆)-alkilen-P(O)(Oalkil)₂, O-P(O)(OH)₂, O-P(O)(Oalkil)₂, SO₃H, SO₂-NH₂, SO₂NH(C₁-C₆)-alkil, SO₂N[(C₁-C₆)-alkil]₂, S-(C₁-C₆)-alkil, S-(CH₂)_n-aryl, S-(CH₂)_n-heterociklil, SO-(C₁-C₆)-alkil, SO-(CH₂)_n-aryl, SO-(CH₂)_n-heterociklil, SO₂-(C₁-C₆)-alkil, SO₂-(CH₂)_n-aryl, SO₂-(CH₂)_n-heterociklil, SO₂-NH(CH₂)_n-aryl, SO₂-NH(CH₂)_n-heterociklil, SO₂-N((C₁-C₆)-alkil)(CH₂)_n-aryl, SO₂-N((C₁-C₆)-alkil)(CH₂)_n-heterociklil, SO₂-N((CH₂)_n-aryl)₂, SO₂-N((CH₂)_n-heterociklil)₂, gdje n = 0-6, a arilni radikal ili heterociklički radikal mogu biti supstituirani s do dva F, Cl, Br, OH, CF₃, NO₂, CN, OCF₃, O-(C₁-C₆)-alkila, (C₁-C₆)-alkila, NH₂;

C(NH)(NH₂), NH₂, NH-(C₁-C₆)-alkil, N((C₁-C₆)-alkil)₂, NH(C₁-C₇)-acil, NH-CO-(C₁-C₆)-alkil, NH-COO-(C₁-C₆)-alkil, NH-CO-aryl, NH-CO-heterociklil, NH-COO-aryl, NH-COO-heterociklil, NH-CO-NH-(C₁-C₆)-alkil, NH-CO-NH-aryl, NH-CO-NH-heterociklil, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-(C₁-C₆)-alkil, N[(C₁-C₆)-alkil]-COO-(C₁-C₆)-alkil, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-aryl, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-heterociklil, N[(C₁-C₆)-alkil]-COO-aryl, N[(C₁-C₆)-alkil]-COO-heterociklil, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-NH-(C₁-C₆)-alkil, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-NH-aryl, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-NH-heterociklil, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-N((C₁-C₆)-alkil)₂, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-N((C₁-C₆)-alkil)-aryl, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-N((C₁-C₆)-alkil)-heterociklil, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-N(aril)₂, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-N(heterociklil)₂, N(aril)-CO-(C₁-C₆)-alkil, N(heterociklil)-CO-(C₁-C₆)-alkil, N(aril)-COO-(C₁-C₆)-alkil, N(heterociklil)-COO-(C₁-C₆)-alkil, N(aril)-CO-aryl, N(heterociklil)-CO-aryl, N(aril)-COO-aryl, N(heterociklil)-COO-aryl, N(aril)-CO-NH-(C₁-C₆)-alkil, N(heterociklil)-CO-NH-(C₁-C₆)-alkil, N(aril)-CO-NH-aryl, N(heterociklil)-CO-NH-aryl, N(aril)-CO-NH(aril), N(heterociklil)-CO-N(aril)₂, N(heterociklil)-CON(aril)₂, aril, O-(CH₂)_n-aryl, O-(CH₂)_n-heterociklil, gdje n = 0-6, te gdje arilni ili heterociklilni radikal mogu biti supstituirani s jednim do tri F, Cl, Br, I, OH, CF₃, NO₂, CN, OCF₃, O-(C₁-C₆)-alkila, (C₁-C₆)-alkila, NH₂, NH(C₁-C₆)-alkila, N((C₁-C₆)-alkil)₂, SF₅, SO₂-CH₃, COOH, COO-(C₁-C₆)-alkila, CONH₂;

R2 je H, OH, COOH, (C₁-C₈)-alkil, (C₂-C₈)-alkenil, gdje u (C₁-C₈)-alkilnim i (C₂-C₈)-alkenilnim radikalima jedna ili više pojedinačnih skupina -CH₂- ili -CH- može biti zamijenjeno s -O-, te gdje alkil, cikloalkilni i alkenilni radikali mogu biti supstituirani s jednim ili više

F, Cl, Br, I, CF₃, NO₂, N₃, CN, =O, COOH, COO(C₁-C₆)-alkila, CONH₂, CONH(C₁-C₆)-alkila, CON[(C₁-C₆)-alkil]₂, cikloalkila, (C₁-C₁₀)-alkila, (C₂-C₆)-alkenila, (C₂-C₆)-alkinila, O-(C₁-C₆)-alkila, O-CO-(C₁-C₆)-alkila, O-CO-(C₁-C₆)-arila, O-CO-(C₁-C₆)-heterociklila;

PO₃H₂, P(O)(Oalkil)₂, (C₁-C₆)-alkilen-P(O)(Oalkil)₂, O-P(O)(OH)₂, O-P(O)(Oalkil)₂, SO₃H, SO₂-NH₂, SO₂NH(C₁-C₆)-alkil, SO₂N[(C₁-C₆)-alkil]₂, S-(C₁-C₆)-alkil, S-(CH₂)_n-aril, S-(CH₂)_n-heterociklil, SO-(C₁-C₆)-alkil, SO-(CH₂)_n-aril, SO-(CH₂)_n-heterociklil, SO₂-(C₁-C₆)-alkil, SO₂-(CH₂)_n-aril, SO₂-(CH₂)_n-heterociklil, SO₂-NH(CH₂)_n-aril, SO₂-NH(CH₂)_n-heterociklil, SO₂-N((C₁-C₆)-alkil)(CH₂)_n-aril, SO₂-N((C₁-C₆)-alkil)(CH₂)_n-heterociklil, SO₂-N((CH₂)_n-aril)₂, SO₂-N((CH₂)_n-heterociklil)₂, gdje n = 0-6, a arilni radikal ili heterociklički radikal mogu biti supstituirani s do dva F, Cl, Br, OH, CF₃, NO₂, CN, OCF₃, O-(C₁-C₆)-alkila, (C₁-C₆)-alkila, NH₂; C(NH)(NH₂), NH₂, NH-(C₁-C₆)-alkil, N((C₁-C₆)-alkil)₂, NH(C₁-C₇)-acil, NH-CO-(C₁-C₆)-alkil, NH-COO-(C₁-C₆)-alkil, NH-CO-aril, NH-CO-heterociklil, NH-COO-aril, NH-COO-heterociklil, NH-CO-NH-(C₁-C₆)-alkil, NH-CO-NH-aril, NH-CO-NH-heterociklil, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-(C₁-C₆)-alkil, N[(C₁-C₆)-alkil]-COO-(C₁-C₆)-alkil, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-aril, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-heterociklil, N[(C₁-C₆)-alkil]-COO-aril, N[(C₁-C₆)-alkil]-COO-heterociklil, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-NH-(C₁-C₆)-alkil, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-NH-aril, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-NH-heterociklil, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-N((C₁-C₆)-alkil)₂, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-N((C₁-C₆)-alkil)-aril, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-N((C₁-C₆)-alkil)-heterociklil, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-N(aril)₂, N[(C₁-C₆)-alkil]-CO-N(heterociklil)₂, N(aril)-CO-(C₁-C₆)-alkil, N(heterociklil)-CO-(C₁-C₆)-alkil, N(aril)-COO-(C₁-C₆)-alkil, N(heterociklil)-COO-(C₁-C₆)-alkil, N(aril)-CO-aril, N(heterociklil)-CO-aril, N(aril)-CO-NH-(C₁-C₆)-alkil, N(heterociklil)-CO-NH-(C₁-C₆)-alkil, N(aril)-CO-NH-aril, N(heterociklil)-CO-NH-aril, N(aril)-CO-N((C₁-C₆)-alkil)₂, N(heterociklil)-CO-N((C₁-C₆)-alkil)₂, N(aril)-CO-N[(C₁-C₆)-alkil]-aril, N(heterociklil)-CO-N[(C₁-C₆)-alkil]-aril, N(aril)-CO-N(aril)₂, N(heterociklil)-CON(aril)₂, aril, O-(CH₂)_n-aril, O-(CH₂)_n-heterociklil, gdje n = 0-6, gdje arilni ili heterociklinski radikal mogu biti supstituirani s jednim do tri F, Cl, Br, I, OH, CF₃, NO₂, CN, OCF₃, O-(C₁-C₆)-alkila, (C₁-C₆)-alkila, NH₂, NH(C₁-C₆)-alkila, N((C₁-C₆)-alkil)₂, SF₅, SO₂-CH₃, COOH, COO-(C₁-C₆)-alkila, CONH₂;

ili R1 i R2 zajedno tvore 3- do 8-eročlani arilni, cikloalkilni ili heterociklinski prsten, gdje arilni, cikloalkilni ili heterociklinski prsten mogu biti supstituirani s F, Cl, Br, I, OH, CF₃, NO₂, CN, OCF₃, O-(C₁-C₆)-alkilom, (C₁-C₆)-alkilom, NH₂, NH(C₁-C₆)-alkilom, N((C₁-C₆)-alkil)₂, SF₅, SO₂-CH₃, COOH, COO-(C₁-C₆)-alkilom, CONH₂;

i njegovih fiziološki prihvatljivih soli, **naznačena time** što je navedeni spoj namijenjen proizvodnji medikamenta za liječenje metaboličkog sindroma.

3. Upotreba spoja formule I u skladu s patentnim zahtjevom 1, u kojoj

R1 je H, OH, COOH, (C₁-C₈)-alkil, (C₂-C₈)-alkenil, aril, gdje u (C₁-C₈)-alkilnim i (C₂-C₈)-alkenilnim radikalima jedna ili više pojedinačnih skupina -CH₂- ili -CH- može biti zamijenjeno s -O-, te gdje alkilni, alkenilni i arilni radikali mogu biti supstituirani s jednim ili više

=O, arila, gdje arilni radikal može biti supstituiran s jednim do tri F, Cl, Br, I, OH, CF₃, NO₂, CN, OCF₃, O-(C₁-C₆)-alkila, (C₁-C₆)-alkila, NH₂, NH(C₁-C₆)-alkila, N((C₁-C₆)-alkil)₂, SF₅, SO₂-CH₃, COOH, COO-(C₁-C₆)-alkila, CONH₂;

R2 je H, (C₁-C₈)-alkil, (C₂-C₈)-alkenil;

i njegovih fiziološki prihvatljivih soli, **naznačena time** što je navedeni spoj namijenjen proizvodnji medikamenta za liječenje metaboličkog sindroma.

4. Upotreba spoja formule I u skladu s patentnim zahtjevom 1, u kojoj

R1 je H, OH, (C₁-C₈)-alkil, (C₂-C₄)-alkenil, gdje u (C₁-C₈)-alkilnim i (C₂-C₄)-alkenilnim radikalima jedna ili više pojedinačnih skupina -CH₂- ili -CH- može biti zamijenjeno s -O-, te gdje alkilni i alkenilni radikali mogu biti supstituirani s jednim ili više

=O, arila, gdje arilni radikal može biti supstituiran s jednim do tri F, Cl, Br, I, OH, CF₃, NO₂, CN, OCF₃, O-(C₁-C₆)-alkila, (C₁-C₆)-alkila, NH₂, NH(C₁-C₆)-alkila, N((C₁-C₆)-alkil)₂, SF₅, SO₂-CH₃, COOH, COO-(C₁-C₆)-alkila, CONH₂;

R2 je H, (C₁-C₈)-alkil, (C₂-C₄)-alkenil;

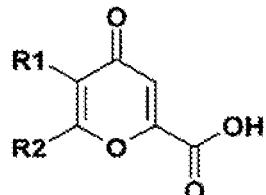
i njegovih fiziološki prihvatljivih soli, **naznačena time** što je navedeni spoj namijenjen proizvodnji medikamenta za liječenje metaboličkog sindroma.

5. Upotreba spoja formule I u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 4 i njegovih fiziološki prihvatljivih soli, **naznačena time** što je navedeni spoj namijenjen proizvodnji medikamenta za smanjivanje razine lipida u plazmi.

6. Upotreba spoja formule I u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 4 i njegovih fiziološki prihvatljivih soli, **naznačena time** što je navedeni spoj namijenjen proizvodnji medikamenta za smanjivanje razine slobodnih masnih kiselina (FFA) u plazmi.

7. Upotreba spoja formule I u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 4 i njegovih fiziološki prihvatljivih soli, **naznačena time** što je navedeni spoj namijenjen proizvodnji medikamenta za smanjivanje razine glicerola u plazmi.

8. Upotreba spoja formule I u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 4 i njegovih fiziološki prihvatljivih soli, **naznačena time** što je navedeni spoj namijenjen proizvodnji medikamenta za smanjivanje razine triglicerida u plazmi.
9. Upotreba spoja formule I u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 4 i njegovih fiziološki prihvatljivih soli, **naznačena time** što je navedeni spoj namijenjen proizvodnji medikamenta za profilaksu dijabetesa tip 2.
- 5 10. Upotreba spoja formule I u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 4 i njegovih fiziološki prihvatljivih soli, **naznačena time** što je navedeni spoj namijenjen proizvodnji medikamenta za liječenje dijabetične dislipidemije.
11. Upotreba spoja formule I u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 4 i njegovih fiziološki prihvatljivih soli, **naznačena time** što je navedeni spoj namijenjen proizvodnji medikamenta za liječenje of obesity.
- 10 12. Upotreba spoja formule I u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1-4, u kojoj su R1 i R2 vodici, **naznačena time** što je navedeni spoj u obliku medikamenta.
13. Spoj formule I



I

naznačen time štoR1 je (C_1-C_8)-alkil ili (C_2-C_4)-alkenil, gdje alkilni i alkenilni radikali mogu biti supstituirani s jednim ili više F;

R2 je H;

i njegove fiziološki prihvatljive soli.

- 20 14. Spoj formule I u skladu s patentnim zahtjevom 13, **naznačen time** što
R1 je (C_2-C_8)-alkil, gdje alkilni radikal može biti supstituiran s jednim ili više F;

R2 je H;

i njegove fiziološki prihvatljive soli.

- 25 15. Upotreba spoja formule I u skladu s patentnim zahtjevom 1, u kojoj
R1 je H, OH, COOH, (C_1-C_8)-alkil, (C_2-C_8)-alkenil, aril, gdje u (C_1-C_8)-alkilnim i (C_2-C_8)-alkenilnim radikalima jedna ili više pojedinačnih skupina $-CH_2-$ ili $-CH-$ može biti zamijenjeno s $-O-$, te gdje alkilni, alkenilni i arilni radikali mogu biti supstituirani s jednim ili više

- 30 F, $=O$, arila, gdje arilni radikal može biti supstituiran s jednim do tri F, Cl, Br, I, OH, CF_3 , NO_2 , CN, OCF_3 , O-(C_1-C_6)-alkila, (C_1-C_6)-alkila, NH_2 , $NH(C_1-C_6)$ -alkila, $N((C_1-C_6)$ -alkil) $_2$, SF_5 , SO_2-CH_3 , COOH, COO-(C_1-C_6)-alkila, $CONH_2$;

- 35 R2 je H, (C_1-C_8)-alkil, (C_2-C_8)-alkenil;

i njegovih fiziološki prihvatljivih soli, **naznačena time** što je navedeni spoj namijenjen proizvodnji medikamenta za liječenje metaboličkog sindroma.

- 40 16. Upotreba spoja formule I u skladu s patentnim zahtjevom 1, u kojoj
R1 je H, OH, (C_1-C_8)-alkil, (C_2-C_4)-alkenil, gdje u (C_1-C_8)-alkilnim i (C_2-C_4)-alkenilnim radikalima jedna ili više pojedinačnih skupina $-CH_2-$ ili $-CH-$ može biti zamijenjeno s $-O-$, te gdje alkilni i alkenilni radikali mogu biti supstituirani s jednim ili više

- 45 F, $=O$, arila, gdje arilni radikal može biti supstituiran s jednim do tri F, Cl, Br, I, OH, CF_3 , NO_2 , CN, OCF_3 , O-(C_1-C_6)-alkila, (C_1-C_6)-alkila, NH_2 , $NH(C_1-C_6)$ -alkila, $N((C_1-C_6)$ -alkil) $_2$, SF_5 , SO_2-CH_3 , COOH, COO-(C_1-C_6)-alkila, $CONH_2$;

- R2 je H, (C_1-C_8)-alkil, (C_2-C_4)-alkenil;

- 50 i njegovih fiziološki prihvatljivih soli, **naznačena time** što je navedeni spoj namijenjen proizvodnji medikamenta za liječenje metaboličkog sindroma.