

(19)



REPUBLIKA SLOVENIJA
MINISTRSTVO ZA GOSPODARSKI RAZVOJ IN TEHNOLOGIJO
URAD RS ZA INTELEKTUALNO LASTNINO

(10) **SI/EP 2847204 T1**

(12)

PREVOD ZAHTEVKOV EVROPSKEGA PATENTA

(21) Številka predmeta: **201330962**

(51) Int. Cl. (2018.01)

(22) Datum prijave: **07.05.2013**

C07J 9/00 C07J 41/00
C07J 75/00 A61K 31/00
A61P 35/00

(46) Datum objave prevoda zahtevkov:
31.05.2018

(96) Evropska patentna prijava:
07.05.2013 EP 13729470.8

(30) Prednostna pravica:
10.05.2012 EP 12305518;
06.06.2012 US 201261656151 P

(87) Objava mednarodne patentne prijave:
WO 2013/168096, 14.11.2013

(86) Mednarodna patentna prijava:
07.05.2013 WO PCT/IB2013/053669

(97) Objava evropskega patenta:
EP 2847204 B1, 13.12.2017

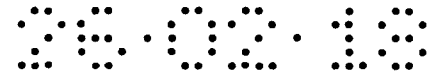
(72) Izumitelji: **CLARION Ludovic, F-34980 Saint Gely Du Fesc, FR;**
MERSEL Marcel, F-34080 Montpellier, FR;
PETITE Didier, F-34000 Montpellier, FR

(73) Imetnik: **Beta Innov,**
49 rue Rouelle, 75015 Paris, FR

(74) Zastopnik: **ZIVKO MIJATOVIC & PARTNERS, d.o.o., Ulica stare pravde 10, 1000 Ljubljana, SI**

(54) **STEROLNI DERIVATIVI IN NJIHOVA UPORABA ZA ZDRAVLJENJE BOLEZNI, KI VKLJUČUJEJO
PREOBLIKOVANJE ASTROCITNIH CELIC ALI ZA ZDRAVLJENJE MALIGNIH HEMOPATIJ**

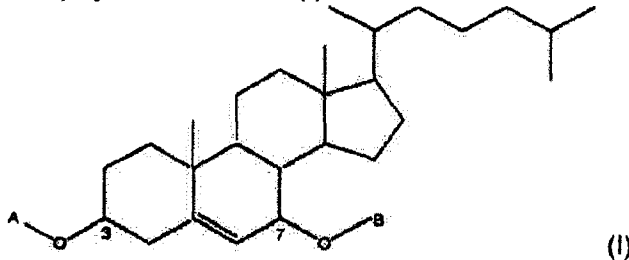
SI/EP 2847204 T1



**STEROLNI DERIVATIVI IN NJIHOVA UPORABA ZA ZDRAVLJENJE
BOLEZNI, KI VKLJUČUJEJO PREOBLIKOVANJE ASTROCITNIH CELIC ALI
ZA ZDRAVLJENJE MALIGNIH HEMOPATIJ**

Patentni zahtevki

1. Spojina s formulo (I) ki ima osnovno strukturo beta-hidroksiholesterola



za katero je značilno, da je izbrana izmed naslednjih spojin:

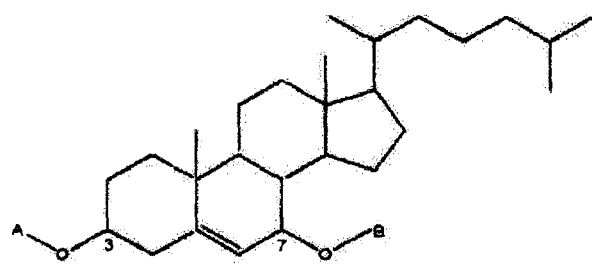
- 7-((*tert*-butoksikarbonil)oksi)-10,13-dimetil-17-(6-metilheptan-2-il)-2,3,4,7,8,9,10,11,12,13,14,15,16,17-tetradekahidro-1H-ciklopenta[a]fenantren-3-il 2-(2-(((benziloksi)karbonil)amino)-acetamido)propanoat (molekula 1.a);
- 7-acetoksi-10,13-dimetil-17-(6-metilheptan-2-il)-2,3,4,7,8,9,10,11,12,13,14,15,16,17-tetradekahidro-1H-ciklopenta[a]fenantren-3-il 2-(2-(((benziloksi)karbonil)amino)-acetamido)propanoat (molekula 1.b);
- 7-((*tert*-butoksikarbonil)oksi)-10,13-dimetil-17-(6-metilheptan-2-il)-2,3,4,7,8,9,10,11,12,13,14,15,16,17-tetradekahidro-1H-ciklopenta[a]fenantren-3-il 2,2-dimetil-1,3-dioksolan-4-karboksilat (molekula 2.a);
- 7-acetoksi-10,13-dimetil-17-(6-metilheptan-2-il)-2,3,4,7,8,9,10,11,12,13,14,15,16,17-tetradekahidro-1H-ciklopenta[a]fenantren-3-il 2,2-dimetil-1,3-dioksolan-4-karboksilat (molekula 2.b);

za uporabo pri zdravljenju malignih hemopatij.

2. Spojina za uporabo v skladu s patentnim zahtevkom 1, pri čemer so maligne hematopatije mieloidnega tipa.

3. Spojina za uporabo v skladu s patentnim zahtevkom 1, pri čemer so maligne hemopatije limfomi.

4. Spojina s formulo (I), ki ima osnovno strukturo beta-hidroksiholesterola



za katero je značilno, da je izbrana izmed naslednjih spojin:

- 7-((*tert*-butoksikarbonil)oksi)-10,13-dimetil-17-(6-metilheptan-2-il)-2,3,4,7,8,9,10,11,12,13,14,15,16,17-tetradekahidro-1H-ciklopenta[a]fenantren-3-il 2-(2-(((benziloksi)karbonil)amino)-acetamido)propanoat (molekula 1.a);

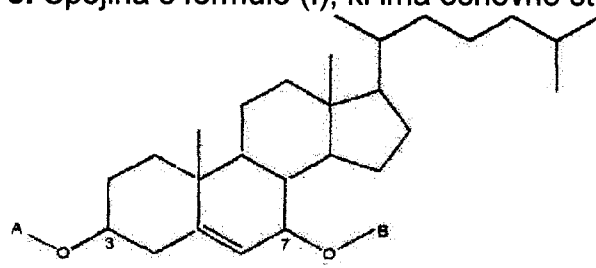
- 7-acetoksi-10,13-dimetil-17-(6-metilheptan-2-il)-2,3,4,7,8,9,10,11,12,13,14,15,16,17-tetradekahidro-1H-ciklopenta[a]fenantren-3-il 2-(2-(((benziloksi)karbonil)amino)-acetamido)propanoat (molekula 1.b);

- 7-((*tert*-butoksikarbonil)oksi)-10,13-dimetil-17-(6-metilheptan-2-il)-2,3,4,7,8,9,10,11,12,13,14,15,16,17-tetradekahidro-1H-ciklopenta[a]fenantren-3-il 2,2-dimetil-1,3-dioksolan-4-karboksilat (molekula 2.a);

- 7-acetoksi-10,13-dimetil-17-(6-metilheptan-2-il)-2,3,4,7,8,9,10,11,12,13,14,15,16,17-tetradekahidro-1H-ciklopenta[a]fenantren-3-il 2,2-dimetil-1,3-dioksolan-4-karboksilat (molekula 2.b);

za uporabo pri zdravljenju nevroblastomov.

5. Spojina s formulo (I), ki ima osnovno strukturo beta-hidroksiholesterola



za katero je značilno, da je izbrana izmed naslednjih spojin:

- 7-((*tert*-butoksikarbonil)oksi)-10,13-dimetil-17-(6-metilheptan-2-il)-2,3,4,7,8,9,10,11,12,13,14,15,16,17-tetradekahidro-1H-ciklopenta[a]fenantren-3-il 2-(2-(((benziloksi)karbonil)amino)-acetamido)propanoat (molekula 1.a);

- 7-acetoksi-10,13-dimetil-17-(6-metilheptan-2-il)-2,3,4,7,8,9,10,11,12,13,14,15,16,17-tetradekahidro-1H-ciklopenta[a]fenantren-3-il 2-(2-(((benziloksi)karbonil)amino)-acetamido)propanoat (molekula 1.b);

- 7-((*tert*-butoksikarbonil)oksi)-10,13-dimetil-17-(6-metilheptan-2-il)-2,3,4,7,8,9,10,11,12,13,14,15,16,17-tetradekahidro-1H-



ciklopenta[a]fenantren-3-il 2,2-dimetil-1,3-dioksolan-4-karboksilat
(molekula 2.a);
7-acetoksi-10,13-dimetil-17-(6-metilheptan-2-il)-
2,3,4,7,8,9,10,11,12,13,14,15,16,17-tetradekahidro-1 H-ciklopenta[a]-
fenantren-3-il 2,2-dimetil-1,3-dioksolan-4-karboksilat (molekula 2.b);

za uporabo pri zdravljenju melanomov.

6. Spojina za uporabo v skladu s katerim koli patentnim zahtevkom od 1 do 5, ki je v obliki farmacevtske sestave, ki vsebuje vsaj eno spojino, kot je definirana v zahtevkih 1, 4 in 5, in farmacevtsko sprejemljivi prenašalec.
7. Spojina za uporabo v skladu s katerim koli patentnim zahtevkom od 1 do 5, ki je v obliki farmacevtske sestave, ki vsebuje liposom in zajema vsaj eno spojino, kot je definirana v zahtevkih 1, 4 in 5, samo ali v kombinaciji z drugo aktivno sestavino.
8. Spojina za uporabo v skladu s katerim koli patentnim zahtevkom od 1 do 5, ki je v obliki farmacevtske sestave, ki vsebuje alkoholno raztopino in zajema vsaj eno spojino, kot je definirana v zahtevkih 1, 4 in 5, samo ali v kombinaciji z drugo aktivno sestavino.
9. Spojina za uporabo v skladu s katerim koli od patentnih zahtevkov od 1 do 5, ki je v obliki farmacevtske sestave, ki je primerna za dovajanje po oralni poti.
10. Spojina za uporabo v skladu s katerim koli od patentnih zahtevkov od 1 do 5, ki je v obliki farmacevtske sestave za dovajanje po oralni poti, izbrane med tabletami, kapsulami, praški, granulami, raztopinami, emulzijami, peroralnimi suspenzijami, kapljicami, sirupi, kompleksi spojin, kot so definirani v zahtevkih 1, 4 in 5, z bilarnimi solmi in kombinacijami spojin s formulo (I) s fosfolipidi, v liposomski ali ne-liposomski obliki.
11. Spojina za uporabo v skladu s katerim koli od patentnih zahtevkov od 1 do 5, ki je v obliki farmacevtske sestave, v kateri se navedena spojina, kot je definirana v zahtevkih 1, 4 in 5, uporablja kot edina aktivna sestavina ali v kombinaciji s protirakavim sredstvom.