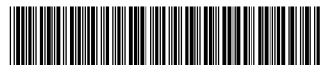




(19) REPUBLIKA HRVATSKA  
DRŽAVNI ZAVOD ZA  
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO



(10) Identifikator  
dokumenta:

**HR P20120006 T1**

HR P20120006 T1

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

(51) MKP:

**C07D 207/16** (2006.01)  
**C07D 405/12** (2006.01)  
**A61K 31/40** (2006.01)  
**A61K 31/4025** (2006.01)  
**A61P 3/10** (2006.01)  
**A61P 43/00** (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 31.01.2012.

(21) Broj predmeta: P20120006T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 03.01.2012.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/JP2005001377  
Datum podnošenja međunarodne prijave: 01.02.2005.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 05704327.5  
Datum podnošenja europske prijave patenta: 01.02.2005.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2005075421  
Datum međunarodne objave: 18.08.2005.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 1712547 A1  
Datum objave europske prijave patenta: 18.10.2006.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 1712547 B1  
Datum objave europskog patenta: 14.12.2011.

(31) Broj prve prijave: 2004029856

(32) Datum podnošenja prve prijave: 05.02.2004.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: JP

(73) Nositelj patenta:

**Kyorin Pharmaceutical Co., Ltd., 5, Kandasurugadai 2-chome, Chiyoda-ku, 101-8311 Tokyo, JP**

(72) Izumitelji:

**Yasumichi Fukuda, 33-2, Utsukushigaoka 3-chome, Oyama-shi, 3290207 Tochigi, JP**  
**Yoshikazu Asahina, 5905-301, Tomonuma, Nogi-machi, Shimotsuga-gun, 3290101 Tochigi, JP**  
**Kohei Ohata, 20-13, Utsukushigaoka 2-chome Oyama-shi, 3290207 Tochigi, JP**  
**Kazuya Yokota, 6095-216, Tomonuma, Nogi-machi, Shimotsuga-gun, 3290101 Tochigi, JP**  
**Koji Murakami, 9-7, Utsukushigaoka 3-chome, Oyama-shi, 3290207 Tochigi, JP**  
**Toshiyuki Matsui, 2-201, Shinishige 3502 Jousou-shi, 300-2706 Ibaraki, JP**

(74) Zastupnik:

**Hraste & Partneri odvjetničko društvo, 10000 Zagreb, HR**

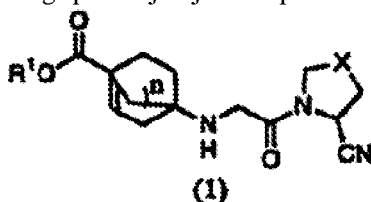
(54) Naziv izuma:

**DERIVAT BICIKLOESTERA**

HR P20120006 T1

## PATENTNI ZAHTJEVI

- 5 1. Derivat bicikloestera, **naznačen time** što ga prikazuje sljedeća opća formula (1):



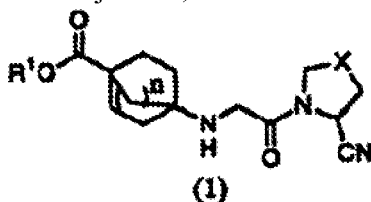
- 10 u kojoj R1 je supstituirana ili nesupstituirana C1 do C6 alkilna skupina, supstituirana ili nesupstituirana C3 do C6 cikloalkilna skupina, tetrahidropiranična skupina, supstituirana ili nesupstituirana arilmetilna skupina, supstituirana ili nesupstituirana ariletalna skupina, supstituirana ili nesupstituirana aromatska ugljikovodična skupina, supstituirani ili nesupstituirani aromatski heterociklički prsten ili supstituirani ili nesupstituirani alifatski heterociklički prsten;

X je CH<sub>2</sub>, CHF, CF<sub>2</sub>, CHOH, S, ili O; i

- 15 n je 1, 2 ili 3,

ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

2. Derivat bicikloestera u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što ga prikazuje sljedeća opća formula (1):



- 20 u kojoj R1 je supstituirana ili nesupstituirana C1 do C6 alkilna skupina, supstituirana ili nesupstituirana arilmetilna skupina, ili supstituirana ili nesupstituirana ariletalna skupina;

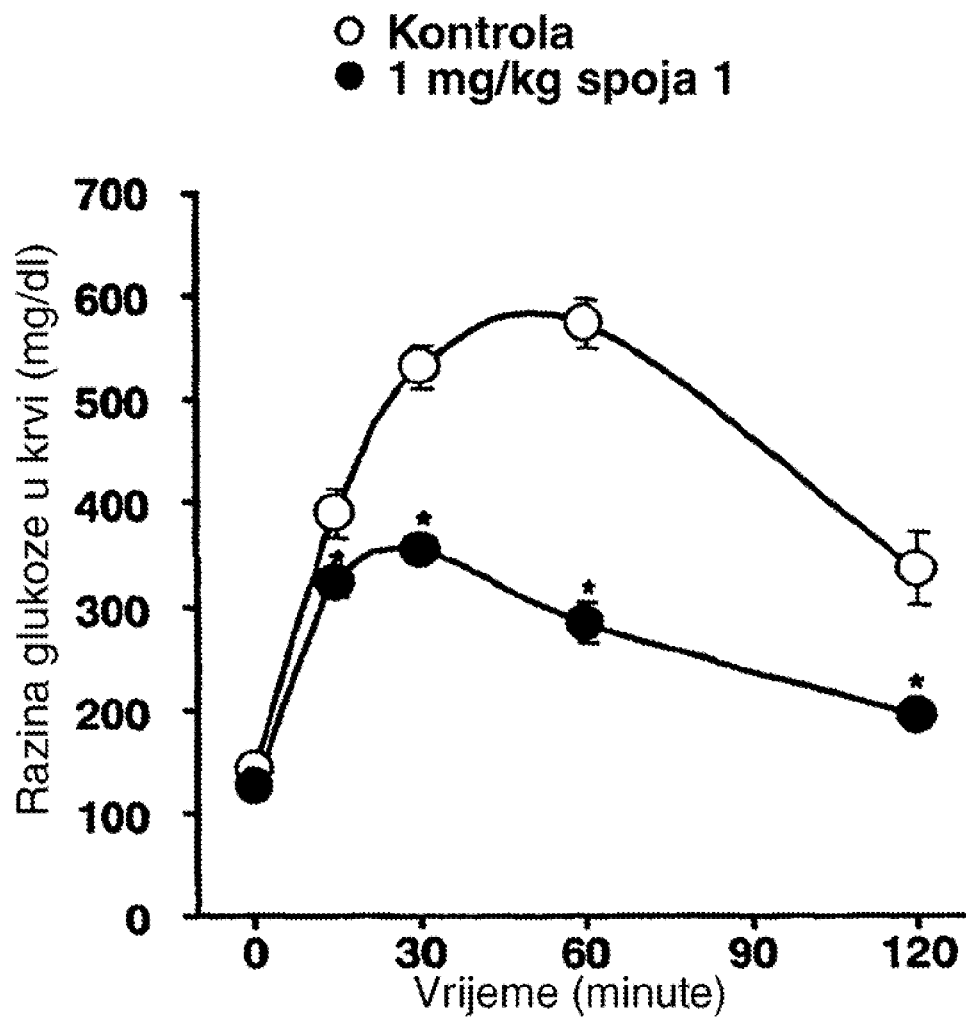
X je CH<sub>2</sub>, CHF ili CF<sub>2</sub>; i

- 25 n je 1 ili 2

ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

3. Derivat bicikloestera u skladu s patentnim zahtjevom 1, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, **naznačen time** što X je CH<sub>2</sub>.
- 30 4. Derivat bicikloestera u skladu s patentnim zahtjevom 1, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, **naznačen time** što X je CHF.
5. Derivat bicikloestera u skladu s patentnim zahtjevom 1, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, **naznačen time** što n je 1.
- 35 6. Derivat bicikloestera u skladu s patentnim zahtjevom 1, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, **naznačen time** što n je 2.
7. Derivat bicikloestera u skladu s patentnim zahtjevom 1, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, **naznačen time** što R1 je C1 do C6 alkilna skupina, koja može imati 1 do 5 supstituenti, koje se bira iz skupine koju čine atom halogena, hidroksi skupina, cijano skupina, C1 do C6 alkoksi skupina, supstituirana ili nesupstituirana ariloksi skupina, C1 do C6 alkilkarbonilna skupina, C1 do C6 alkoksikarbonilna skupina, C1 do C6 alkiltio skupina, amino skupina, mono- ili disupstituirana C1 do C6 alkilamino skupina, 4- do 9-eročlana prstenasta amino skupina, koja može sadržavati 1 do 3 heteroatoma, formilamino skupina, C1 do C6 alkilkarbonilamino skupina, C1 do C6 alkoksikarbonilamino skupina, C1 do C6 alkilsulfonilamino skupina, te supstituirana ili nesupstituirana arilsulfonilamino skupina.
- 40 8. Derivat bicikloestera u skladu s patentnim zahtjevom 1, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, **naznačen time** što R1 je C1 do C6 alkilna skupina, koju se bira iz skupine koju čine metilna skupina, ciklopropilmetilna skupina, etilna skupina, propilna skupina, 1-metiletilna skupina, 1-metilpropilna skupina, 2-metilpropilna skupina, 1-etilpropilna skupina, 2-etilpropilna skupina, butilna skupina, t-butilna skupina, te heksilna skupina.
- 45 9. Derivat bicikloestera u skladu s patentnim zahtjevom 1, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, **naznačen time** što derivat bicikloestera se bira iz skupine koju čine
- 50 (2S,4S)-1-[[N-(4-etoksikarbonilbiciklo[2.2.2]okt-1-il)amino]acetil]-4-fluorpirolidin-2-karbonitril,

- (2S)-1-[[N-(4-etoksikarbonilbiciklo[2.2.2]okt-1-il)amino]acetil]pirolidin-2-karbonitril,  
 (2S)-1-[[N-(4-t-butoksikarbonilbiciklo[2.2.2]okt-1-il)amino]acetil]pirolidin-2-karbonitril,  
 (2S,4S)-1-[[N-[4-(2-tetrahidropirani)oksikarbonilbiciklo[2.2.2]okt-1-il]amino]acetil]-4-fluorpirolidin-2-karbonitril,  
 (2S)-1-[[N-[4-(2-tetrahidropirani)oksikarbonilbiciklo[2.2.2]okt-1-il]amino]acetil]pirolidin-2-karbonitril,  
 5 (2S,4S)-1-[[N-(4-etoksikarbonilbiciklo[2.2.1]hept-1-il)amino]acetil]-4-fluorpirolidin-2-karbonitril,  
 (2S)-1-[[N-(4-etoksikarbonilbiciklo[2.2.1]hept-1-il)amino]acetil]pirolidin-2-karbonitril,  
 (2S,4S)-1-[[N-(4-benziloksikarbonilbiciklo[2.2.2]okt-1-il)amino]acetil]-4-fluorpirolidin-2-karbonitril,  
 (2S,4S)-1-[[N-(4-ciklopropilmetiloksikarbonilbiciklo[2.2.2]okt-1-il)amino]acetil]-4-fluorpirolidin-2-karbonitril,  
 (2S,4S)-4-fluor-1-[[N-(4-(4-trifluormetil)benziloksikarbonilbiciklo[2.2.2]okt-1-il)amino]acetil]pirolidin-2-  
 10 karbonitril,  
 (2S,4S)-4-fluor-1-[[N-(4-izobutiloksikarbonilbiciklo[2.2.2]okt-1-il)amino]acetil]pirolidin-2-karbonitril, te  
 (2S,4S)-4-fluor-1-[[N-(4-izopropiloksikarbonilbiciklo[2.2.2]okt-1-il)amino]acetil]pirolidin-2-karbonitril.
10. Farmaceutski proizvod, **naznačen time** što kao aktivni sastojak sadrži derivat bicikloestera u skladu s patentnim zahtjevom 1 do 9, ili njegovu farmaceutski prihvatljivu sol.
- 15 11. Inhibitor DPP-IV, **naznačen time** što kao aktivni sastojak sadrži derivat bicikloestera u skladu s patentnim zahtjevom 1 do 9, ili njegovu farmaceutski prihvatljivu sol.
12. Spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 9, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi in the liječenje i/ili sprječavanje medicinskog stanja, koje se bira iz skupine koju čine dijabetes, dijabetične komplikacije, hiperinzulinemija, hiperglikemija, abnormalni metabolizam lipida, pretilost,  
 20 AIDS kao posljedica infekcije virusom HIV-1, odbacivanje presađenog organa ili tkiva, multipla skleroza, reumatoidni artritis, upala, alergije, osteoporozna, psorijaza i lišaj, dobroćudna hipertrofija prostate, metastaze raka dojke i prostate u plućima, hipertenzija i zarazne bolesti.
13. Spoj namijenjen upotrebi u liječenju i/ili sprječavanju medicinskog stanja u skladu s patentnim zahtjevom 12, **naznačen time** što medicinsko stanje je dijabetes ili dijabetične komplikacije.



SL. 1