



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO



(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20120829 T1

HR P20120829 T1

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

(51) MKP: **C07D 263/58** (2006.01) **A61K 31/423** (2006.01)
C07D 413/12 (2006.01) **A61P 3/10** (2006.01)
A61P 3/06 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 30.11.2012.

(21) Broj predmeta: P20120829T (22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 15.10.2012.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2007003806
Datum podnošenja međunarodne prijave: 30.04.2007.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 07724733.6
Datum podnošenja europske prijave patenta: 30.04.2007.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2007131622
Datum međunarodne objave: 22.11.2007.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2024347 A1
Datum objave europske prijave patenta: 18.02.2009.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2024347 B1
Datum objave europskog patenta: 01.08.2012.

(31) Broj prve prijave: 102006021878 (32) Datum podnošenja prve prijave: 11.05.2006.
(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: DE

(73) Nositelj patenta: **SANOFI, 54 rue La Boétie, 75008 Paris, FR**
(72) Izumitelji: **Elisabeth Defossa, Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, 65926 Frankfurt am Main, DE**
Markus Follmann, Ringstr. 61, 42489 Wülfrath, DE
Thomas Klabunde, Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, 65926 Frankfurt am Main, DE
Victoria Drosou, Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, 65926 Frankfurt am Main, DE
Gerhard Hessler, Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, 65926 Frankfurt am Main, DE
Siegfried Stengelin, Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, 65926 Frankfurt am Main, DE
Guido Haschke, Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, 65926 Frankfurt am Main, DE
Andreas Herling, Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, 65926 Frankfurt am Main, DE
Stefan Bartoschek, Sanofi-Aventis Deutschland GmbH, 65926 Frankfurt am Main, DE

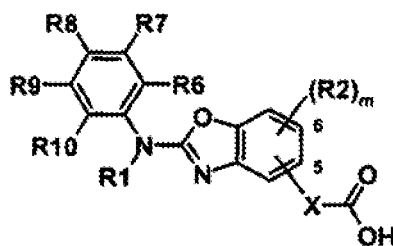
(74) Zastupnik: Hraste & Partneri odvjetničko društvo, 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma: **KARBOKSILNE KISELINE SUPSTITUIRANE FENILAMINOBENZOKSAZOLOM, POSTUPAK
NJIHOVOG DOBIVANJA I NJIHOVA UPOTREBA KAO MEDIKAMENATA**

HR P20120829 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

- 5 1. Spoj formule I,



I

naznačen time što

R1 je H;

- 10 R6, R7, R8, R9 i R10 su međusobno neovisno H, F, Cl, Br, CF₃, OCH₃, OCF₃, OCHF₂, SCH₃, SCF₃, fenil, (C₁-C₆)-alkil, O-(C₁-C₆)-alkil ili NR₃R₄, gdje alkil i fenil mogu biti supstituirani s jednim ili više R2, te gdje u svakom slučaju dva od radikala R6, R7, R8, R9, R10 na susjednim položajima u fenilnom prstenu zajedno mogu tvoriti radikal -CH=CH-CH=CH-;

- 15 m je 0, 1, 2 ili 3;

X je -(CH₂)₂-;

- 20 R2 je F, Cl, Br, CN, OCH₃, OCF₃, CH₃, CF₃, (C₁-C₆)-alkil ili O-(C₁-C₆)-alkil, gdje alkil može biti supstituiran s jednim ili više OH, F, Cl, Br ili CN;

R3, R4 su međusobno neovisno H ili (C₁-C₆)-alkil;

izuzevši 3-(2-*o*-tolilaminobenzoksazol-6-il)propansku kiselinu;

25

i njihove fiziološki prihvatljive soli.

2. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi u obliku medikamenta.
 3. Medikament, **naznačen time** što sadrži jedan ili više spojeva u skladu s patentnim zahtjevom 1.
 4. Medikament, **naznačen time** što sadrži jedan ili više spojeva u skladu s patentnim zahtjevom 1 i najmanje jedan
 30 dodatni aktivni sastojak.
 5. Medikament u skladu s patentnim zahtjevom 4, **naznačen time** što kao dodatnu aktivnu tvar sadrži jedan ili više anti-dijabetika, hipoglikemijskih sastojaka, inhibitora HMGCoA-reduktaze, inhibitora apsorpcije kolesterola, agonista PPAR- γ , agonista PPAR- α , agonista PPAR- α/γ , agonista PPAR- δ , fibrata, inhibitora MTP, inhibitora apsorpcije žučnih kiselina, inhibitora CETP, polimernih adsorbensa žučnih kiselina, induktora receptora za LDL, inhibitora ACAT, antioksidansa, inhibitora lipoprotein-lipaze, inhibitora ATP-citrat-lijaze, inhibitora skvalen-sintetaze, antagonista lipoproteina(a), agonista receptora HM74A, inhibitora lipaze, inzulina, sulfonilurea, bigvanida, meglitinida, tiazolidindiona, inhibitora α -glukozidaze, aktivnih tvari koje djeluju na kalijski kanal ovisan o ATP-u u beta-stanicama, inhibitora glikogen-fosforilaze, antagonisti glukagonskog receptora, aktivatora glukokinaze, inhibitora glukoneogeneze, inhibitora fruktoza-1,6-bisfosfataze, modulatora glukoznog transportera 4 (GLUT4), inhibitora glutamin-fruktoza-6-fosfat-amidotransferaze, inhibitora dipeptidilpeptidaze IV (DPP-IV),
 35 inhibitora 11 β -hidroksisteroid-dehidrogenaze 1, inhibitora protein-tirozin-fosfataze 1B, modulatora glukoznog transportera 1 ili 2 ovisnog o natriju, inhibitora lipaze osjetljive na hormone, inhibitora acetyl-CoA-karboksilaze, inhibitora fosfoenolpiruvat-karboksikinaze, inhibitora glikogen-sintaza-kinaze-3 β , inhibitora protein-kinaze C β , antagonista receptora za endotelin-A, inhibitora I κ B-kinaze, modulatora glukokortikoidnog receptora, agonista CART, agonista NPY, agonista MC₄, oreksinskih agonista, agonista H₃, agonista TNF, agonista CRF, CRF BP antagonisti, urokortinskih agonista, agonista β ₃, antagonista receptora CB₁, agonista MSH (hormon stimulacije melanocita), agonista CCK, inhibitora povratnog unosa serotonin, miješanih serotoninergičkih i noradrenergičkih spojeva, agonista 5-HT, bombezinskih agonista, galaninskih antagonista, hormona rasta, liberatora hormona rasta, agonista TRH, modulatora rasprežućeg proteina 2 ili 3, leptinskih agonista, agonista DA, inhibitora lipaze/amilaze, modulatora PPAR, modulatora RXR ili agonista TR- β ili amfetamina.
 40
 45
 50 6. Upotreba spojeva u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačena time** što su navedeni spojevi namijenjeni proizvodnji medikamenta za snižavanje razine glukoze u krvi.

7. Upotreba spojeva u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačena time** što su navedeni spojevi namijenjeni proizvodnji medikamenta za liječenje dijabetesa.
8. Upotreba spojeva u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačena time** što su navedeni spojevi namijenjeni proizvodnji medikamenta za pojačavanje otpuštanja inzulina.
- 5 9. Postupak proizvodnje medikamenta koji sadrži jedan ili više spojeva u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što se sastoji u miješanju aktivne tvari s farmaceutski prihvatljivom podlogom i prevođenju te smjese u oblik pogodan za primjenu.