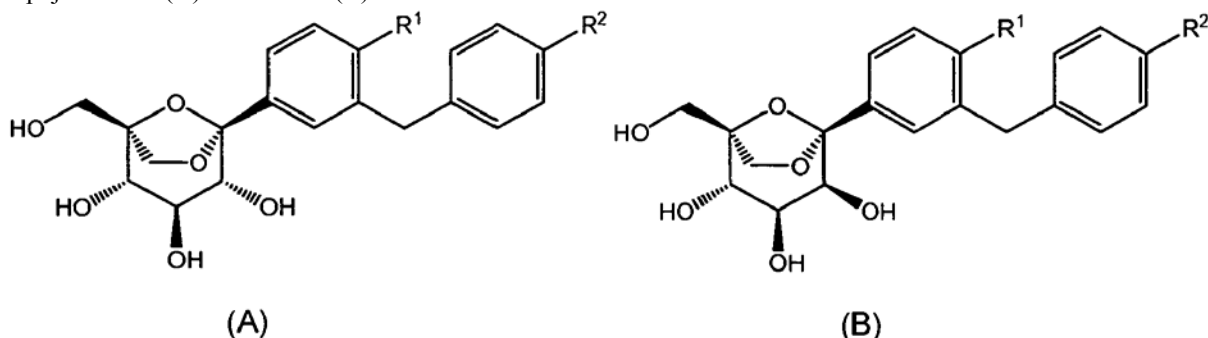


PATENTNI ZAHTJEVI

- 5 1. Spoj Formule (A) ili Formula (B)



naznačen time što

R¹ je H, (C₁-C₄)alkil, (C₁-C₄)alkoksi, Cl, F, cijano, fluorom supstituirani (C₁-C₂)alkil, (C₁-C₄)alkil-SO₂- ili (C₃-C₆)cikloalkil; i

10

R² je (C₁-C₄)alkil, (C₁-C₄)alkoksi, (C₂-C₄)alkinil, 3-oksetaniloksi, 3-tetrahidrofuraniloksi, Cl, F, cijano, fluorom supstituirani (C₁-C₂)alkil, (C₁-C₄)alkil-SO₂-, (C₃-C₆)cikloalkil ili (C₅-C₆)heterocikl koji sadrži 1 ili 2 heteroatoma, od kojih se svakog neovisno bira između N, O ili S.

2. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što je navedeni spoj spoj Formule (A).

- 15 3. Spoj u skladu s patentnim zahtjevima 1 ili 2, **naznačen time** što

R¹ je H, metil, etil, propil, izopropil, metoksi, etoksi, F, Cl, cijano, -CF₃, ciklopropil ili ciklobutil; i

R² je metil, etil, propil, izopropil, metoksi, etoksi, F, Cl, cijano, -CF₃, -CF₂CH₃, etinil, 3-oksetaniloksi, 3-tetrahidrofuraniloksi ili ciklopropil.

- 20 4. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 3, **naznačen time** što

R¹ je H, metil, etil, izopropil, metoksi, etoksi, F, Cl, cijano, -CF₃ ili ciklopropil; i

R² je metil, etil, izopropil, metoksi, etoksi, F, Cl, cijano, -CF₃, -CF₂CH₃, etinil, 3-oksetaniloksi, 3-tetrahidrofuraniloksi ili ciklopropil.

- 25 5. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 4, **naznačen time** što

R¹ je H, metil, etil, metoksi, etoksi, F, Cl, cijano, -CF₃ ili ciklopropil; i

R² je metil, etil, metoksi, etoksi, F, Cl, cijano, -CF₃, -CF₂CH₃, etinil, 3-oksetaniloksi, 3-tetrahidrofuraniloksi ili ciklopropil.

- 30 6. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 5, **naznačen time** što

R¹ je metil, etil, F, Cl, cijano, CF₃ ili ciklopropil; i

R² je metoksi ili etoksi.

- 35 7. Spoj, **naznačen time** što ga se bira iz skupine koju čine:

(1S,2S,3S,4R,5S)-1-hidroksimetil-5-[3-(4-metoksibenzil)-4-metilfenil]-6,8-dioksabiciklo[3.2.1]oktan-2,3,4-triol;

(1S,2S,3S,4R,5S)-5-[3-(4-etoksibenzil)-4-metilfenil]-1-hidroksimetil-6,8-dioksabiciklo[3.2.1]oktan-2,3,4-triol;

(1S,2S,3S,4R,5S)-5-[4-klor-3-(4-metoksibenzil)fenil]-1-hidroksimetil-6,8-dioksabiciklo[3.2.1]oktan-2,3,4-triol;

(1S,2S,3S,4R,5S)-5-[4-klor-3-(4-etoksibenzil)fenil]-1-hidroksimetil-6,8-dioksabiciklo[3.2.1]oktan-2,3,4-triol;

(1S,2S,3S,4R,5S)-5-[4-fluor-3-(4-metoksibenzil)fenil]-1-hidroksimetil-6,8-dioksabiciklo[3.2.1]oktan-2,3,4-triol;

40 2-(4-metoksibenzil)-4-((1S,2S,3S,4R,5S)-2,3,4-trihidroksi-1-(hidroksimetil)-6,8-dioksabiciklo[3.2.1]okt-5-il)benzonitril;

2-(4-etoksibenzil)-4-((1S,2S,3S,4R,5S)-2,3,4-trihidroksi-1-(hidroksimetil)-6,8-dioksabiciklo[3.2.1]okt-5-il)benzonitril;

(1S,2S,3S,4R,5S)-5-[3-(4-etoksibenzil)-4-fluorfenil]-1-hidroksimetil-6,8-dioksabiciklo[3.2.1]oktan-2,3,4-triol;

45 (1S,2S,3S,4R,5S)-5-{4-fluor-3-[4-(tetrahidrofuran-3-iloksi)benzil]fenil}-1-hidroksimetil-6,8-dioksabiciklo[3.2.1]oktan-2,3,4-triol;

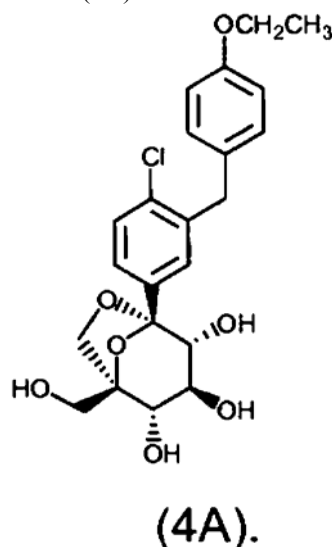
(1S,2S,3S,4R,5S)-5-[3-(4-klorbenzil)-4-fluorfenil]-1-hidroksimetil-6,8-dioksabiciklo[3.2.1]oktan-2,3,4-triol;

(1S,2S,3S,4R,5S)-5-{4-fluor-3-[4-(oksetan-3-iloksi)benzil]fenil}-1-hidroksimetil-6,8-dioksabiciklo[3.2.1]oktan-

2,3,4-triol; i

50 (1S,2S,3S,4R,5S)-5-{4-klor-3-[4-(oksetan-3-iloksi)benzil]fenil}-1-hidroksimetil-6,8-dioksabiciklo[3.2.1]oktan-2,3,4-triol.

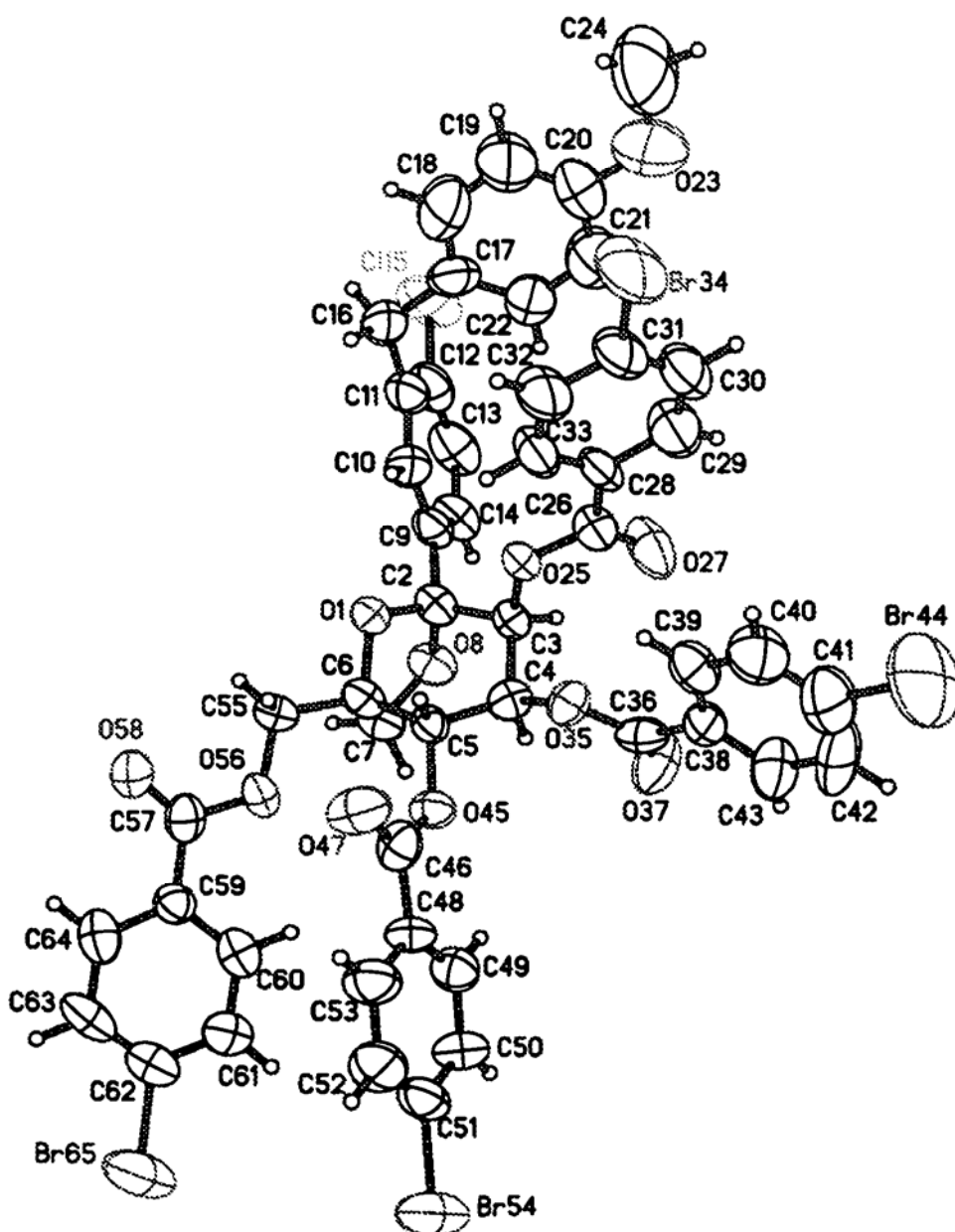
8. Spoj, **naznačen time** što je (1*S*,2*S*,3*S*,4*R*,5*S*)-5-[4-klor-3-(4-etoksibenzil)fenil]-1-hidroksimetil-6,8-dioksabiciklo[3.2.1]oktan-2,3,4-triol.
9. Spoj, **naznačen time** što ga se bira iz skupine koju čine:
 (1*S*,2*S*,3*S*,4*S*,5*S*)-1-hidroksimetil-5-[3-(4-metoksibenzil)-4-metilfenil]-6,8-dioksabiciklo[3.2.1]oktan-2,3,4-triol;
 (1*S*,2*S*,3*S*,4*S*,5*S*)-5-[3-(4-etoksibenzil)-4-metilfenil]-1-hidroksimetil-6,8-dioksabiciklo[3.2.1]oktan-2,3,4-triol;
 (1*S*,2*S*,3*S*,4*S*,5*S*)-5-[4-klor-3-(4-metoksibenzil)fenil]-1-hidroksimetil-6,8-dioksabiciklo[3.2.1]oktan-2,3,4-triol;
 (1*S*,2*S*,3*S*,4*S*,5*S*)-5-[4-klor-3-(4-etoksibenzil)fenil]-1-hidroksimetil-6,8-dioksabiciklo[3.2.1]oktan-2,3,4-triol;
 (1*S*,2*S*,3*S*,4*S*,5*S*)-5-[4-fluor-3-(4-metoksibenzil)fenil]-1-hidroksimetil-6,8-dioksabiciklo[3.2.1]oktan-2,3,4-triol;
 (1*S*,2*S*,3*S*,4*S*,5*S*)-5-[3-(4-etoksibenzil)-4-fluorfenil]-1-hidroksimetil-6,8-dioksabiciklo[3.2.1]oktan-2,3,4-triol; i
 (1*S*,2*S*,3*S*,4*S*,5*S*)-5-[3-(4-klorbenzil)-4-fluorfenil]-1-hidroksimetil-6,8-dioksabiciklo[3.2.1]oktan-2,3,4-triol.
10. Kristal, **naznačen time** što sadrži spoj formule (4A):



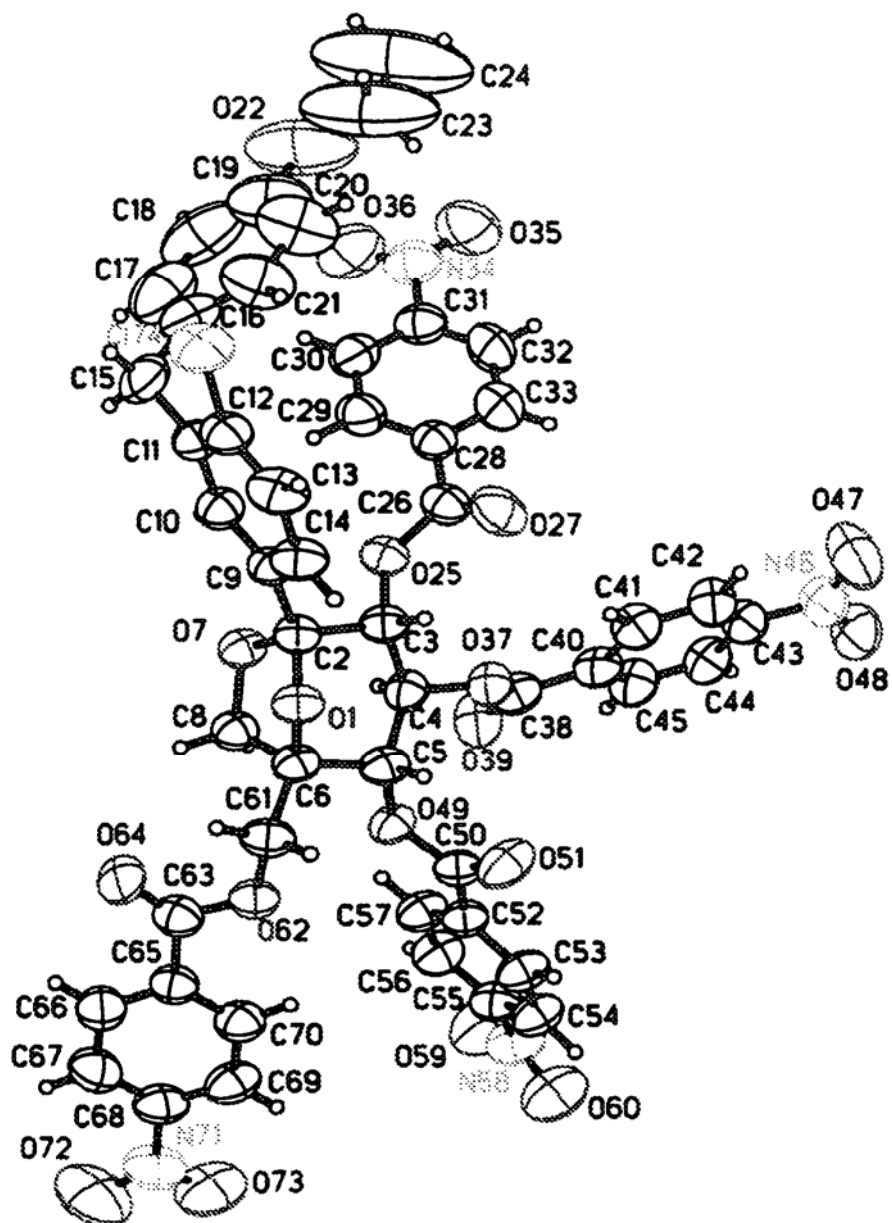
11. Kristal u skladu s patentnim zahtjevom 10, **naznačen time** što dodatno sadrži L-prolin ili L-piroglutaminska kiselina.
12. Kristal u skladu s patentnim zahtjevom 10, **naznačen time** što dodatno sadrži L-piroglutaminsku kiselinu, te jedno ili više od sljedećeg:
 a) prostorna skupina P2(1)2(1)2(1) i parametri jedinične ćelije uglavnom su jednaki sljedećem:
 $a = 7,4907(10) \text{ \AA}$ $\alpha = 90^\circ$;
 $b = 12,8626(15) \text{ \AA}$ $\beta = 90^\circ$;
 $c = 28,029(4) \text{ \AA}$ $\gamma = 90^\circ$;
 b) uzorak difrakcije rendgenskih zraka na prahu uključuje vrijednosti 2θ od (zračenje CuK_α , valne duljine 1,54056 Å) $6,4 \pm 0,2$, $16,7 \pm 0,2$, $17,4 \pm 0,2$ i $21,1 \pm 0,2$; ili
 c) ^{13}C -NMR spektar čvrstog stanja koji uključuje pikove na položajima $16,5 \pm 0,2$, $131,1 \pm 0,2$, $158,7 \pm 0,2$, te $181,5 \pm 0,2$ ppm, što je određeno 500 MHz spektrometrom u odnosu na kristalni adamantin od 29,5 ppm.
13. Kristal u skladu s patentnim zahtjevom 10, **naznačen time** što dodatno sadrži L-piroglutaminsku kiselinu, gdje je kristal sukristal, koji sadrži spoj formule (4A) i L-piroglutaminsku kiselinu u stehiometrijskom omjeru od 1:1.
14. Kristal u skladu s patentnim zahtjevom 10, **naznačen time** što dodatno sadrži L-piroglutaminsku kiselinu i ima
 b) uzorak difrakcije rendgenskih zraka na prahu koji uključuje vrijednost 2θ od (zračenje CuK_α , valne duljine 1,54056 Å) $6,4 \pm 0,2$; i
 d) ^{13}C -NMR spektar čvrstog stanja koji uključuje pikove na položajima $16,5 \pm 0,2$, $158,7 \pm 0,2$, te $181,5 \pm 0,2$ ppm, što je određeno 500 MHz spektrometrom u odnosu na kristalni adamantin od 29,5 ppm.
15. Kristal u skladu s patentnim zahtjevom 10, **naznačen time** što dodatno sadrži L-prolin, te jedno ili više od sljedećeg:
 a) prostorna skupina C2 i parametri jedinične ćelije uglavnom su jednaki sljedećem:
 $a = 32,8399(16) \text{ \AA}$ $\alpha = 90^\circ$;
 $b = 7,2457(4) \text{ \AA}$ $\beta = 101,268(5)^\circ$;
 $c = 11,8023(6) \text{ \AA}$ $\gamma = 90^\circ$; ili
 b) uzorak difrakcije rendgenskih zraka na prahu uključuje vrijednosti 2θ od (zračenje CuK_α , valne duljine 1,54056 Å) $7,6 \pm 0,2$, $12,1 \pm 0,2$, $20,3 \pm 0,2$ i $28,8 \pm 0,2$.
16. Farmaceutski pripravak, **naznačen time** što sadrži (i) spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 9 ili kristal u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 10-15; i (ii) farmaceutski prihvatljivu pomoćnu tvar, razrjeđivač ili podlogu.

17. Spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 9, kristal u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 10-15 ili farmaceutski pripravak u skladu s patentnim zahtjevom 16, **naznačen time** što je navedeni spoj ili pripravak namijenjen upotrebi kao medikament.
- 5 18. Spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 9, kristal u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 10-15 ili farmaceutski pripravak u skladu s patentnim zahtjevom 16, **naznačen time** što je navedeni spoj ili pripravak namijenjen upotrebi u liječenju pretilosti i poremećaja povezanih s pretilošću s kod životinja.
- 10 19. Spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 9, kristal u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 10-15 ili farmaceutski pripravak u skladu s patentnim zahtjevom 16, **naznačen time** što je navedeni spoj ili pripravak namijenjen upotrebi u liječenju ili odgađanje napredovanja ili početka dijabetesa tip 2 i poremećaja povezanih s dijabetesom kod životinja.

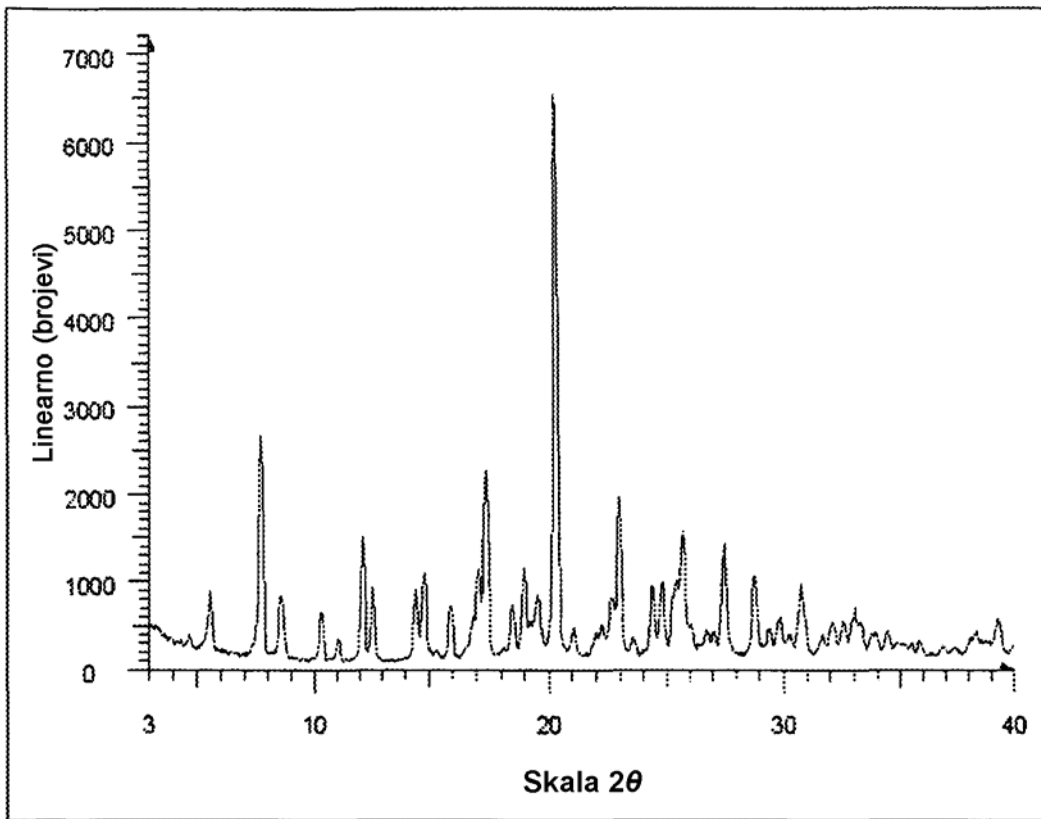
SL. 1



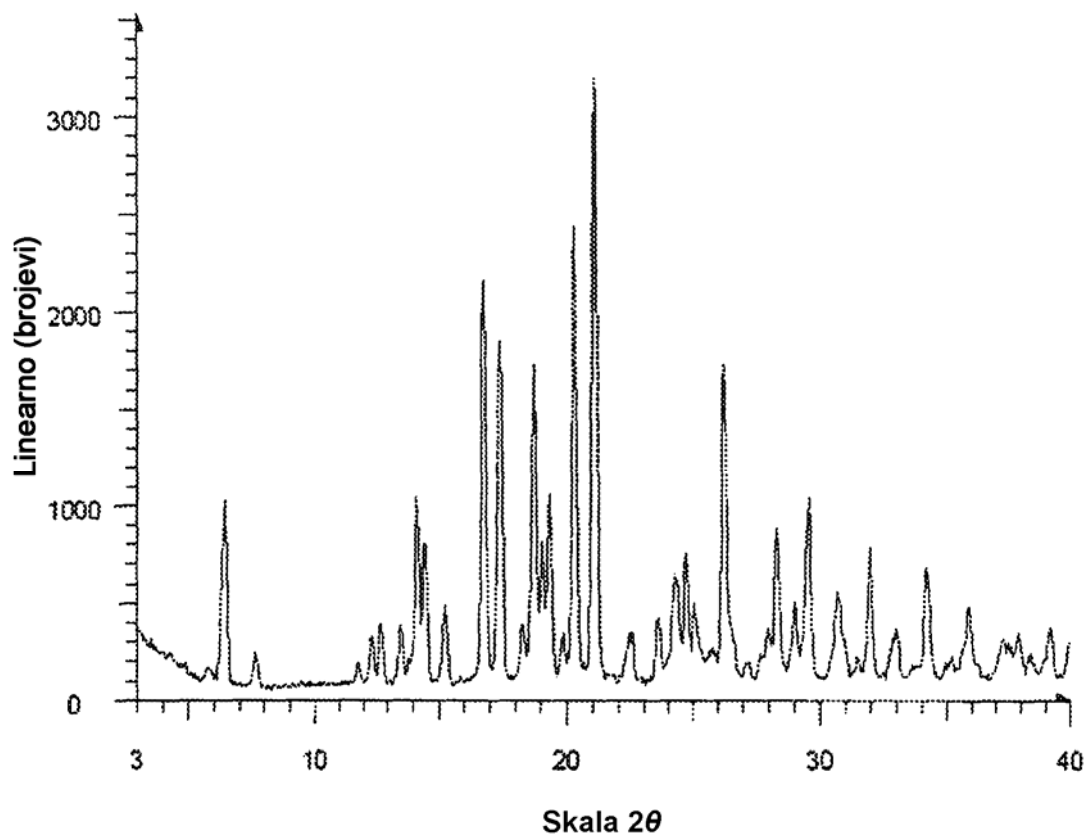
SL. 2



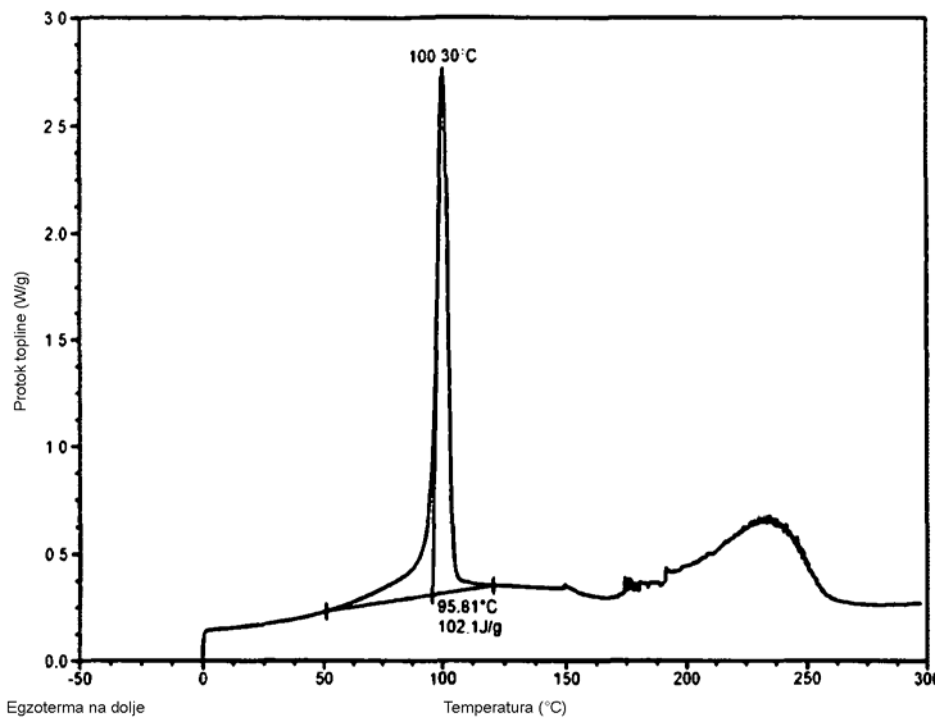
SL. 3



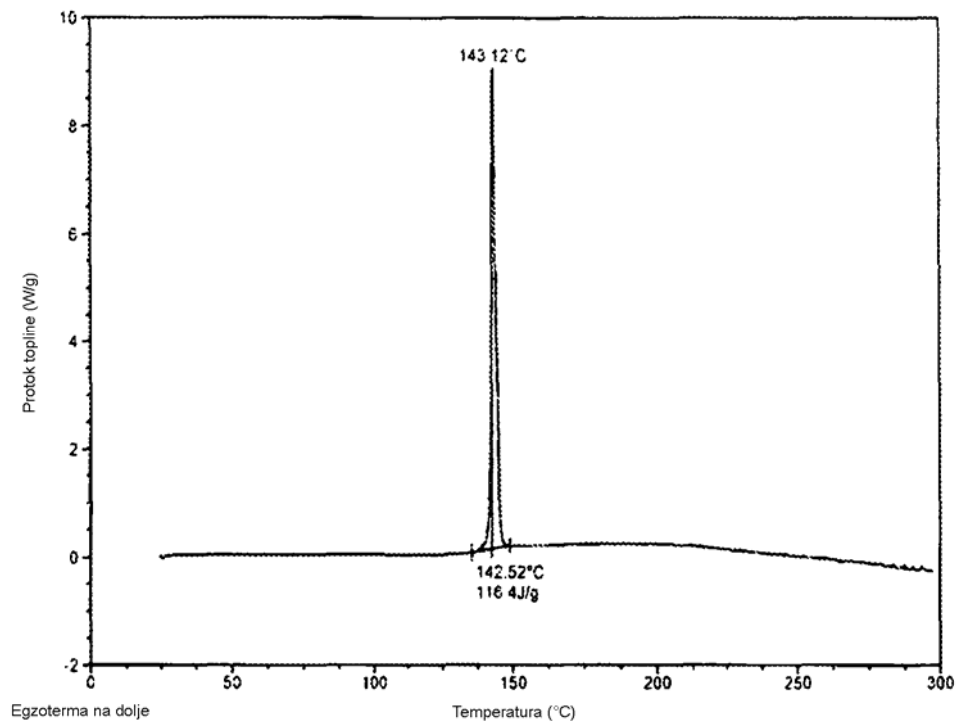
SL. 4



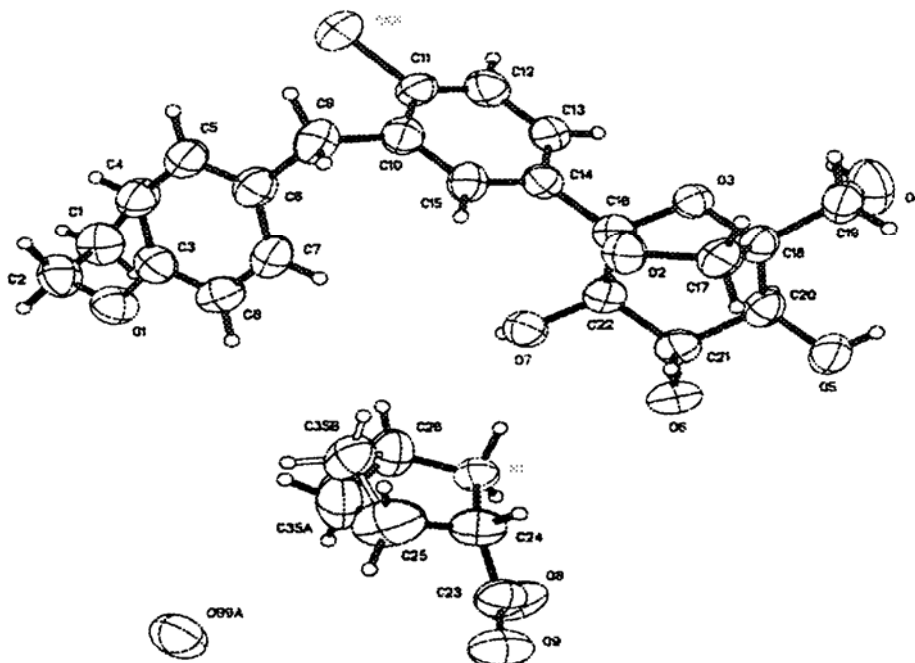
SL. 5



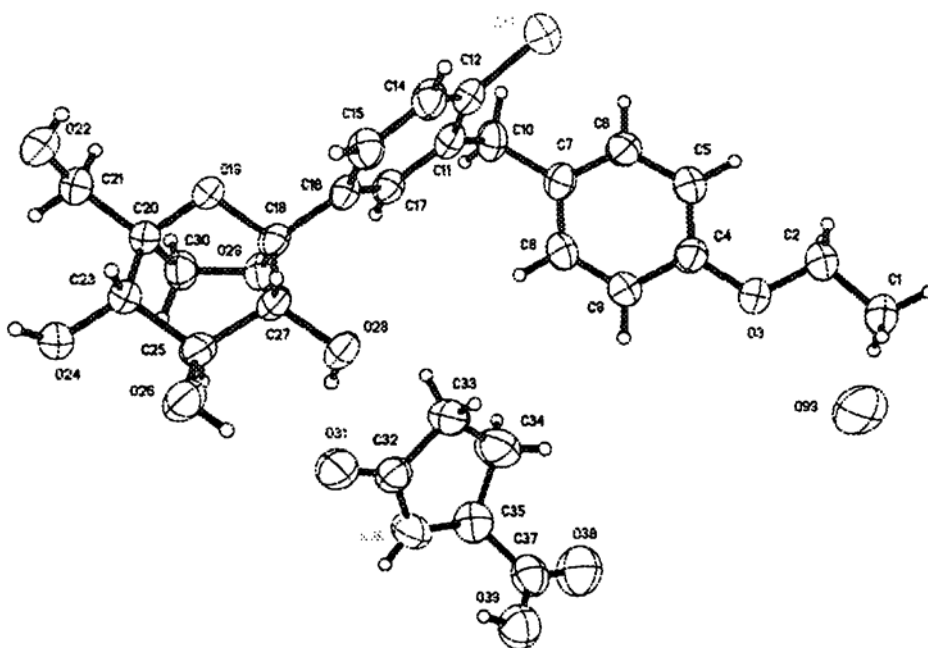
SL. 6



SL. 7



SL. 8



SL. 9

