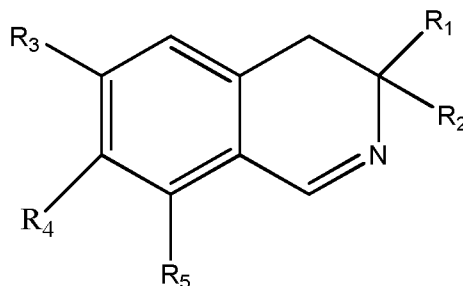


### Zastrzeżenia patentowe

1. Pochodna 3,4-dihydroizochinoliny o strukturze reprezentowanej wzorem I:



Wzór I

w którym

R<sub>1</sub> oznacza atom H, COOEt, COOH, COOBn

R<sub>2</sub> oznacza atom H, COOEt, COOH, COOBn

R<sub>3</sub> oznacza OH, OBn

R<sub>4</sub> oznacza OH, atom H, OBn

R<sub>5</sub> oznacza OH, OBn

oraz jej izomery, sole, hydraty i solwaty.

2. Związek według zastrz. 1, wybrany spośród takich jak

ester dietylowy kwasu 6,8-dihydroksy-3,4-dihydroizochinolino-3,3-dikarboksylowego

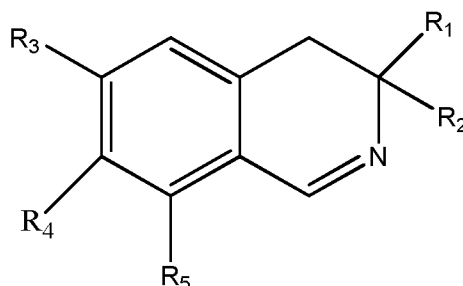
ester dietylowy kwasu 6,8-dibenzyloksi-3,4-dihydroizochinolino-3,3-dikarboksylowego

ester dibenzylowy kwasu 6,7,8-tribenzyloksi-3,4-dihydroizochinolino-3,3-dikarboksylowego

kwas 6,7,8-trihydroksy-3,4-dihydroizochinolino-3-karboksylowy

oraz jego izomery, sole, hydraty i solwaty.

3. Sposób wytwarzania pochodnej 3,4-dihydroizochinoliny o strukturze reprezentowanej wzorem I:

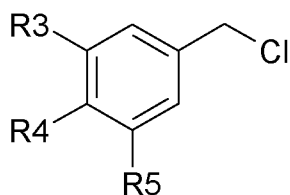


Wzór I

w którym podstawniki mają podane wyżej znaczenia,

**znamienny tym, że** obejmuje etapy, w których

a) związek o wzorze II



Wzór II

w którym

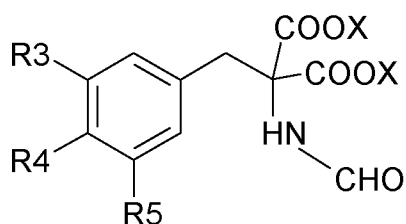
R<sub>3</sub> oznacza OBn

R<sub>4</sub> oznacza atom H albo OBn

R<sub>5</sub> oznacza OBn,

a pozostałe podstawniki mają podane powyżej znaczenia

poddaje się reakcji z formamidomalonianem dietylu albo dibenzylu z wytworzeniem związku o wzorze III



Wzór III;

w którym

R<sub>3</sub> oznacza OBn

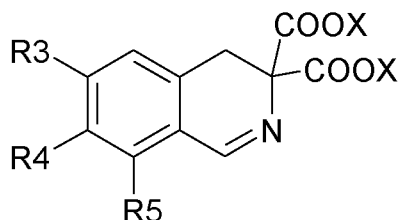
R<sub>4</sub> oznacza atom H albo OBn

R<sub>5</sub> oznacza OBn

X oznacza Et albo Bn;

a pozostałe podstawniki mają podane powyżej znaczenia

b) związek o wzorze III poddaje się reakcji cyklizacji Bischlera-Napieralskiego z wytworzeniem związku o wzorze IV



Wzór IV

w którym

R<sub>3</sub> oznacza OBn

R<sub>4</sub> oznacza atom H albo OBn

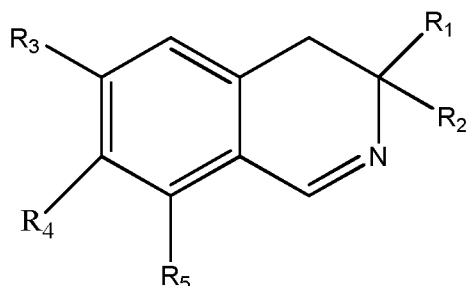
R<sub>5</sub> oznacza OBn

X oznacza Et albo Bn;

a pozostałe podstawniki mają podane powyżej znaczenia;

i ewentualnie

c) związek o wzorze IV poddaje się reakcji usuwania grup benzytowych z wytworzeniem związku o wzorze I



Wzór I

w którym

R<sub>1</sub> oznacza COOEt, COOBn

R<sub>2</sub> oznacza COOEt, COOBn

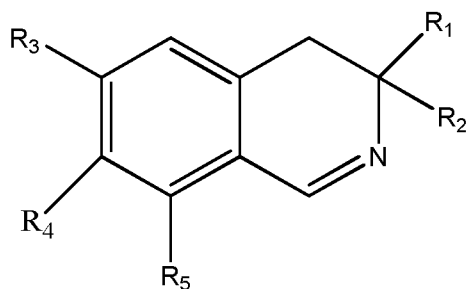
R<sub>3</sub> oznacza OH

R<sub>4</sub> oznacza OH, atom H

R<sub>5</sub> oznacza OH

albo

c1) związek o wzorze IV poddaje się reakcji usuwania grup benzytowych w środowisku kwaśnym z wytworzeniem związku o wzorze I



Wzór I

w którym

R<sub>1</sub> oznacza atom H, COOH

R<sub>2</sub> oznacza atom H, COOH

R<sub>3</sub> oznacza OH

R<sub>4</sub> oznacza OH, atom H,

R<sub>5</sub> oznacza OH.

4. Sposób według zastrz. 3, **znamienny tym, że** w etapie c) i c1) stosuje się tribromek boru.

5. Związek według zastrz. 1 do zastosowania jako lek.

6. Związek według zastrz. 1 do zastosowania w profilaktyce, leczeniu i łagodzeniu objawów stanów związanych z nadmierną aktywnością aminopeptydazy leucynowej oraz stanów związanych z nadmierną proliferacją komórek, takich jak rak, zwłaszcza rak gruczołu krokowego, okrężnicy oraz białaczka.

7. Kompozycja farmaceutyczna, **znamienna tym, że** jako substancję czynną zawiera związek według zastrz. 1.

8. Kompozycja według zastrz. 7 do zastosowania jako lek.

9. Kompozycja według zastrz. 7 albo 8 do stosowania w profilaktyce, leczeniu i łagodzeniu objawów stanów związanych z nadmierną aktywnością aminopeptydazy leucynowej oraz stanów związanych z nadmierną proliferacją komórek, takich jak rak, zwłaszcza rak gruczołu krokowego, okrężnicy oraz białaczka.

10. Kompozycja według któregośkolwiek z zastrz. 7-9, **znamienna tym, że** ma postać płynną na przykład do podawania doustnego, donosowego, doodbytniczego, dopochwowego, dożołądkowego jako roztwór, syrop albo eliksir; oraz do podawania pozajelitowego, podskórnego, doskórnego, domięśniowego lub dożylnego (jak przez wstrzykiwanie) jako sterylny roztwór lub emulsja, a także postać stałą, taką jak tabletki, pastylki, kapsułki, granulki, tabletki powlekane i proszek.

11. Zastosowanie związku według zastrz. 1 do wytwarzania leku do stosowania w profilaktyce, leczeniu i łagodzeniu objawów stanów związanych z nadmierną aktywnością aminopeptydazy leucynowej oraz stanów związanych z nadmierną proliferacją komórek, takich jak rak, zwłaszcza rak gruczołu krokowego, okrężnicy oraz białaczka.

12. Zastosowanie według zastrz. 11, w którym związek według zastrz. 1 stosuje się do wytwarzania leku w postaci płynnej, takiej jak roztwór, syrop, eliksir, sterylny roztwór lub emulsja, albo w postaci stałej, takiej jak tabletki, pastylki, kapsułki, granulki, tabletki powlekane i proszek.