



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20220401 T4

HR P20220401 T4

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

(51) MKP: C07B 59/00 (2006.01)	(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 27.05.2022.
	(46) Datum objave prijevoda izmijenjenih patentnih zahtjeva: 27.09.2024.
(21) Broj predmeta: P20220401T	(22) Datum podnošenja : 17.02.2009.
	(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2009000961 Datum podnošenja međunarodne prijave: 17.02.2009.
	(96) Broj europske prijave patenta: EP 09711194.2 Datum podnošenja europske prijave patenta: 17.02.2009.
	(87) Broj međunarodne objave: WO 2009102498 Datum međunarodne objave: 20.08.2009.
	(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2247558 A1 Datum objave europske prijave patenta: 10.11.2010.
	(97) Broj objave europskog patenta: EP 2247558 B1 Datum objave europskog patenta: 02.02.2022.
	(97) Broj objave izmijenjenog europskog patenta: EP 2247558 B2 Datum objave izmijenjenog europskog patenta: 03.07.2024.

(31) Broj prve prijave: 66101 P (32) Datum podnošenja prve prijave: 14.02.2008. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelj patenta:
(72) Izumitelji:

**Eli Lilly and Company, Lilly Corporate Center, Indianapolis, IN 46285, US
Hartmuth C. Kolb, 6413 Pacific Avenue, Playa Del Rey, CA 90293, US
Joseph C. Walsh, 831 Galloway Street, Pacific Palisades, CA 90272, US
Qianwa Liang, 2267 Clementina Dr., Hacienda Heights, CA 91745, US
Brian A. Duclos, 6568 Bela Avenue, Kalamazoo, MI 49009, US
Wei Zhang, 140 Plymouth Drive, Apt. 2B, Norwood, MA 02062, US
Peter J.H. Scott, 4077 Glencoe Avenue, Apt. 317, Marina-del-rey, CA 90292, US
Kai Chen, 3641 Westwood Blvd, Apt.6, Los Angeles, CA 90034, US
Zhiyong Gao, 32 Trent Road, Wynnwood, PA 19096, US
Tieming Zhao, 3701 Overland Avenue, Apt. H265, Los Angeles, CA 90034, US
Vani P. Mocharla, 3201 Overland Ave, Apt. 6125, Los Angeles, CA 90034, US
Dhanalakshmi Kasi, 3340 Overland Avenue, Apt. 4, Los Angeles, CA 90034, US
Gang Chen, 10770 Lawler Street, Apt. 2, Los Angeles, CA 90034, US
Eric Wang, 13846 Kerry Lane, San Diego, CA 92130, US
Anjana Sinha, 4663 Dunham Way, San Diego, CA 92130, US
Chunfang Xia, 3328 Oakhurst Ave, 301, Los Angeles, CA 90034, US
Henry Clifton Padgett, 1225 14th Street, Hermosa Beach, CA 90254, US
Farhad Karimi, 24 Ridgeview Lane, Mansfield, MA 02048, US
Hraste & Partneri odvjetničko društvo d.o.o., 10000 Zagreb, HR**

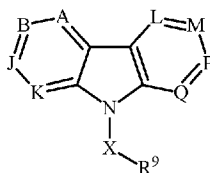
(74) Zastupnik:

(54) Naziv izuma: NOVA VIZUALIZACIJSKA SREDSTVA ZA DETEKTIRANJE NEUROLOŠKE DISFUNKCIJE

HR P20220401 T4

PATENTNI ZAHTEJVI

1. Spoj sljedeće Formule I:



Formula I

i njegove farmaceutski prihvatljive soli, **naznačen time** što:

A je N ili CR¹; B je N ili CR², J je N ili CR³, K je N ili CR⁴; L je N ili CR⁵; M je N; P je N ili CR⁷; i Q je N ili CR⁸; uz uvjet da najviše dva od A, B, J, K, L, M, P, te Q mogu biti N;

X je veza;

svaki od R¹, R², R⁴, R⁵, R⁷, te R⁸ je neovisno vodik ili se svakog od neovisno bira iz skupine koju čine C₁₋₆-alkil, C₃₋₆cikloalkil, C₃₋₁₂cikloalkilC₁₋₅alkil, heteroarilC₂₋₅alkoksi, C₆₋₁₄aril, C₆₋₁₀arilC₁₋₄alkil, heteroaril, C₃₋₆cikloalkoksi, C₃₋₁₂cikloalkilC₁₋₅alkoksi, C₆₋₁₄ariloksi, C₆₋₁₀arilC₁₋₄alkoksi, heteroariloksi, C₁₋₅alkilNR¹⁰C(O)-, (C₁₋₆alkil)₂NC(O)CH(C₁₋₅alkil)-, C₁₋₅alkilNR¹⁰C(O)O-, C₁₋₅alkilC(O)-, C₁₋₅alkilC(O)O-, C₆₋₁₀arilC(O)-, te C₆₋₁₀arilC(O)O-, a R³ se bira iz skupine koju čine C₃₋₆cikloalkil, C₃₋₁₂cikloalkilC₁₋₅alkil, heteroarilC₂₋₅alkoksi, C₆₋₁₄aril, C₆₋₁₀arilC₁₋₄alkil, heteroaril, C₃₋₆cikloalkoksi, C₃₋₁₂cikloalkilC₁₋₅alkoksi, C₆₋₁₄ariloksi, C₆₋₁₀arilC₁₋₄alkoksi, heteroariloksi, C₁₋₅alkilNR¹⁰C(O)-, (C₁₋₆alkil)₂NC(O)CH(C₁₋₅alkil)-, C₁₋₅alkilNR¹⁰C(O)O-, C₁₋₅alkilC(O)-, C₁₋₅alkilC(O)O-, C₆₋₁₀arilC(O)-, te C₆₋₁₀arilC(O)O-;

najmanje četiri od R¹, R², R⁴, R⁵, R⁷, te R⁸ su vodici;

R⁹ je vodik;

svaki R¹⁰ je neovisno H ili C₁₋₆alkil; i

supstituenti na R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁷, R⁸ i R¹⁰ mogu biti dodatno supstituirani supstituentima koje se bira iz skupine koju čine amino, halogen, cijano, nitro, hidroksil, -SH, -SC₁₋₆alkil, -C(O)NH₂, -C(S)NH₂, halogenC₁₋₆alkil, perhalogenC₁₋₆alkil, C₁₋₆alkil, C₃₋₆cikloalkil, C₃₋₁₂cikloalkil, C₆₋₁₄aril i heteroaril, uz uvjet da spoj Formule I nije 4-metil-3-(9H-pirimido[4,5-b]indol-6-il)anilin.

2. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1 koji je radioaktivno obilježen, **naznačen time** što radioaktivni biljeg sadrži radionuklid kojeg se bira iz skupine koju čine ¹¹C, ¹³N, ¹⁵O, ¹⁸F, ¹²³I, ¹²⁴I, ¹²⁵I, ¹³¹I i ⁷⁷Br, te njegove farmaceutski prihvatljive soli.

3. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1 ili 2, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi u liječenje bolesti ili stanja kod sisavca kojem je to potrebno, koje se bira iz skupine koju čine anksioznost, depresija, shizofrenija, Alzheimerova bolest, bolesti povezane sa stresom, panika, fobija, opsesivno-kompulzivni poremećaj, pretilost, posttraumatski stresni sindrom ili epilepsija.

4. Farmaceutski pripravak namijenjen vizualizaciji *in vivo* amiloidnih naslaga, **naznačen time** što sadrži: spoj u skladu s patentnim zahtjevom 2; i farmaceutski prihvatljivi nosač.

5. Spoj ili pripravak u skladu s patentnim zahtjevom 2 ili 4 namijenjeni upotrebi u postupku dijagnosticiranja Alzheimerove bolesti ili sklonosti prema navedenoj bolesti kod sisavca, **naznačeni time** što se postupak sastoji u:

a. primjeni na sisavcu dijagnostički djelotvorne količine radioaktivno obilježenog spoja ili pripravka u skladu s patentnim zahtjevom 2 ili 4, gdje spoj prolazi krvno-moždanu barijeru i preferencijalno se veže na topljive oligomere, polimere i vlakna AD u moždanom tkivu;

b. omogućavanju raspodjeljivanja spoja u moždanom tkivu; i

c. vizualizaciji moždanog tkiva, gdje pojačano vezanje spoja na moždano tkivo u usporedbi s normalnom kontrolnom razinom vezanja ukazuje da sisavac boluje od ili je u opasnosti od razvoja Alzheimerove bolesti.

6. Spoj ili pripravak u skladu s patentnim zahtjevom 2 ili 4 namijenjeni upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 5, **naznačeni time** što se spoj preferencijalno veže na vlakna.

7. Spoj ili pripravak u skladu s patentnim zahtjevom 2 ili 4 namijenjeni upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 5, **naznačeni time** što moždano tkivo sadrži frontotemporalno područje ili hipokampalno područje.

8. Spoj ili pripravak u skladu s patentnim zahtjevom 2 ili 4 namijenjeni upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 5, **naznačeni time** što je pojačano vezanje najmanje 10% veće od navedene normalne kontrolne vrijednosti.

9. Spoj ili pripravak u skladu s patentnim zahtjevom 2 ili 4 namijenjeni upotrebi u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 5 do 8, **naznačeni time** što se spoj primjenjuje intravenskom injekcijom.

10. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 2 namijenjen upotrebi u postupku dijagnosticiranja Alzheimerove bolesti ili sklonosti prema navedenoj bolesti kod sisavca, **naznačen time** što se postupak sastoji u:

a. primjeni na sisavcu dijagnostički djelotvorne količine spoja u skladu s patentnim zahtjevom 2, gdje spoj prolazi krvno-moždanu barijeru i preferencijalno se veže na topljive ili netopljive oligomere, polimere, vlakna AD, hiperfosforilirane tau, neurofibrilarna klupka, sparene spiralne filamente i/ili neurotoksične topljive oligomere u mozgu;

b. upotrebi tehnike nuklearne vizualizacije koju se bira iz skupine koju čine pozitronska emisijska tomografija (PET) i jednofotonska emisijska računalna tomografija (SPECT) u praćenju ili vizualizaciji raspodjele radioaktivno obilježenog spoja u mozgu ili u njegovom dijelu.