



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20220414 T1



HR P20220414 T1

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

(51) MKP:

C07C 255/49 (2006.01)
C07D 401/04 (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01)
C07D 417/04 (2006.01)
C07D 417/06 (2006.01)
C07D 417/14 (2006.01)
C07D 471/04 (2006.01)
C07D 471/10 (2006.01)
C07D 487/04 (2006.01)
C07D 519/00 (2006.01)
A61K 31/545 (2006.01)
A61K 31/5517 (2006.01)
A61K 31/513 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 27.05.2022.

(21) Broj predmeta: P20220414T

(22) Datum podnošenja : 29.06.2015.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2015038345
Datum podnošenja međunarodne prijave: 29.06.2015.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 15814038.4
Datum podnošenja europske prijave patenta: 29.06.2015.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2016003917
Datum međunarodne objave: 07.01.2016.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3164380 A1
Datum objave europske prijave patenta: 10.05.2017.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3164380 B1
Datum objave europskog patenta: 09.02.2022.

(31) Broj prve prijave: 201462020886 P (32) Datum podnošenja prve prijave: 03.07.2014. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelj patenta:

**Celgene Quanticel Research, Inc., 9393 Towne Centre Drive, Suite 110,
San Diego, CA 92121, US**

(72) Izumitelji:

Young K. Chen, 746 Santa Barbara Drive, San Marcos, CA 92078, US
Toufike Kanouni, 3797 via Vuelta, Rancho Santa Fe, CA 92091, US
Zhe Nie, 17104 Monterey Ridge Way, San Diego, CA 92127, US
Jeffrey Alan Stafford, 12752 Sandy Crest Court, San Diego, CA 92130, US
James Marvin Veal, 8916 Weaver Crossing Road, Apex, NC 27502, US

(74) Zastupnik:

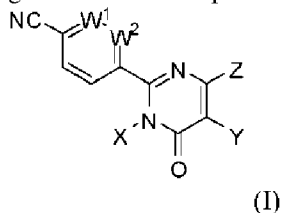
Odvjetnica Gorana Grubišić, dipl.iur., 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma: **INHIBITORI LIZIN SPECIFIČNE DEMETILAZE-1**

HR P20220414 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

1. Spoj koji ima strukturu Formule (I), ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol,



pri čemu,

W^1 i W^2 su nezavisno odabrani od N, C-H, ili C-F;

X je odabran od vodika, opcionalno supstituiranog alkila, opcionalno supstituiranog cikloalkila, opcionalno supstituiranog heterociklila, opcionalno supstituiranog cikloalkilalkila, opcionalno supstituiranog heterociklilalkila, opcionalno supstituiranog aralkila, opcionalno supstituiranog heteroarilalkila, opcionalno

supstituiranog arila, ili opcionalno supstituiranog heteroarila;

Y je odabran od vodika, halogena, opcionalno supstituiranog alkila, ili opcionalno supstituiranog cikloalkilalkila; i

Z je odabran od opcionalno supstituirane grupe odabrane od *N*-heterociklila, -O-heterociklilalkila, -N(H)-heterociklilalkila, -N(H)-alkila, -N(Me)-alkila, ili -N(Me)-heterociklilalkila.

2. Spoj ili farmaceutski prihvatljiva sol prema patentnom zahtjevu 1, pri čemu W^2 je C-H.
3. Spoj ili farmaceutski prihvatljiva sol prema patentnom zahtjevu 1 ili 2, pri čemu W^1 je odabran iz grupe koja se sastoji od C-F, C-H, i N.
4. Spoj ili farmaceutski prihvatljiva sol prema patentnim zahtjevima 1-3, pri čemu X je opcionalno supstituirani aril, ili opcionalno supstituirani heteroaril.
5. Spoj ili farmaceutski prihvatljiva sol prema patentnom zahtjevu 4, pri čemu opcionalno supstituirani aril je opcionalno supstituirani fenil.
6. Spoj ili farmaceutski prihvatljiva sol prema patentnom zahtjevu 4, pri čemu opcionalno supstituirani heteroaril je odabran od opcionalno supstituiranog piridinila, opcionalno supstituiranog pirimidinila, opcionalno supstituiranog pirazinila, opcionalno supstituiranog pirazolila, opcionalno supstituiranog indazolila, opcionalno supstituiranog azaindazolila, opcionalno supstituiranog izoindazolila, opcionalno supstituiranog indolila, ili opcionalno supstituiranog azaindolila.
7. Spoj ili farmaceutski prihvatljiva sol prema patentnim zahtjevima 1-6, pri čemu Z je odabran iz grupe koja se sastoji od opcionalno supstituiranog -O-heterociklilalkila, opcionalno supstituiranog -N(H)-heterociklilalkila i opcionalno supstituiranog -N(Me)-heterociklilalkila.
8. Spoj ili farmaceutski prihvatljiva sol prema patentnom zahtjevu 7, pri čemu heterociklilalkil grupa ima formulu - R^c -heterociklil i R^c je opcionalno supstituirani C_1 - C_3 alkilenski lanac, ili pri čemu heterociklilalkil grupa ima formulu - R^c -heterociklil i R^c je opcionalno supstituirani C_1 alkilenski lanac, ili pri čemu heterociklilalkil grupa ima formulu - R^c -heterociklil i heterociklil je opcionalno supstituirani 4-, 5-, 6-, ili 7-člani heterociklil koji sadrži dušik.
9. Spoj ili farmaceutski prihvatljiva sol prema patentnim zahtjevima 1-6, pri čemu Z je opcionalno supstituirani *N*-heterociklil.
10. Spoj ili farmaceutski prihvatljiva sol prema patentnom zahtjevu 9, pri čemu opcionalno supstituirani *N*-heterociklil je odabran iz grupe koja se sastoji od 4-, 5-, 6-, ili 7-članog *N*-heterociklila, opcionalno supstituiranog piperidina i opcionalno supstituiranog aminopiperidina.
11. Spoj ili farmaceutski prihvatljiva sol prema patentnim zahtjevima 1-10 pri čemu Y je odabran iz grupe koja se sastoji od vodika, halogena, opcionalno supstituiranog cikloalkilalkila, i opcionalno supstituiranog alkila.
12. Spoj ili farmaceutski prihvatljiva sol prema patentnom zahtjevu 11, pri čemu opcionalno supstituirani alkil je odabran iz grupe koja se sastoji od opcionalno supstituiranog C_1 - C_3 alkila, opcionalno supstituiranog C_1 alkila, i metil grupe.
13. Spoj ili farmaceutski prihvatljiva sol prema patentnom zahtjevu 1, pri čemu spoj je odabran iz grupe koja se sastoji od:
 - 4-[4-(4-aminopiperidin-1-il)-1-(4-ciklopropilfenil)-6-oksopirimidin-2-il]-2-fluorobenzonitrila;
 - 4-[4-(1,2,3,3a,4,6,7,7a-oktahidropirolo[3,2-c]piridin-5-il)-1-(4-ciklopropilfenil)-6-oksopirimidin-2-il]-2-fluorobenzonitrila;
 - 4-[4-(1,2,3,3a,4,6,7,7a-oktahidropirolo[3,4-c]piridin-5-il)-1-(4-ciklopropilfenil)-6-oksopirimidin-2-il]-2-fluorobenzonitrila;
 - 4-[1-(4-ciklopropilfenil)-4-(2,8-diazaspiro[4.5]dekan-8-il)-6-oksopirimidin-2-il]-2-fluorobenzonitrila;
 - 4-[4-(4-aminopiperidin-1-il)-1-(3-fluoro-4-metoksifenil)-6-oksopirimidin-2-il]-2-fluorobenzonitrila;
 - 4-[4-(4-aminopiperidin-1-il)-1-(2-metilindazol-5-il)-6-oksopirimidin-2-il]-2-fluorobenzonitrila;
 - 4-[4-(4-aminopiperidin-1-il)-1-(4-metoksifenil)-6-oksopirimidin-2-il]-2-fluorobenzonitrila; i
 - 4-[4-(4-aminopiperidin-1-il)-1-(4-ciklopropil-3-fluorofenil)-6-oksopirimidin-2-il]-2-fluorobenzonitrila.

- 5
14. Farmaceutska kompozicija koja sadrži spoj Formule (I), prema patentnom zahtjevu 1 ili njegovu farmaceutski prihvatljivu sol, i farmaceutski prihvatljiv ekscipijens.
 15. Spoj Formule (I), prema patentnom zahtjevu 1 ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol za primjenu u liječenju neoplastične bolesti kod pacijenta koja obuhvaća inhibiciju aktivnosti lizin specifične demetilaze 1 izlaganjem enzima lizin specifične demetilaze 1 spoju Formule (I).
 16. Spoj, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol prema patentnom zahtjevu 15, pri čemu neoplastična bolest je rak i poželjno je odabran iz grupe koja se sastoji od raka prostate, raka dojke, raka mokraćnog mjehura, raka pluća ili melanoma.