



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20201915 T1



HR P20201915 T1

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

(51) MKP:

A61K 31/222 (2006.01)
C07C 235/16 (2006.01)
A61K 8/49 (2006.01)
A61K 8/42 (2006.01)
A61K 31/216 (2006.01)
A61K 31/215 (2006.01)
C07D 413/12 (2006.01)
C07C 235/38 (2006.01)
A61P 17/00 (2006.01)
A61K 31/422 (2006.01)
A61K 31/42 (2006.01)
C07D 261/14 (2006.01)
A61P 17/02 (2006.01)
A61P 17/04 (2006.01)
A61P 17/10 (2006.01)
A61P 17/06 (2006.01)
A61P 37/08 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 22.01.2021.

(21) Broj predmeta: P20201915T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 01.12.2020.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/SE2015050060
Datum podnošenja međunarodne prijave: 22.01.2015.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 15740983.0
Datum podnošenja europske prijave patenta: 22.01.2015.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2015112079
Datum međunarodne objave: 30.07.2015.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3097084 A1
Datum objave europske prijave patenta: 30.11.2016.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3097084 B1
Datum objave europskog patenta: 30.09.2020.

(31) Broj prve prijave: 1430004

(32) Datum podnošenja prve prijave: 23.01.2014.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: SE

(73) Nositelj patenta:

Sixera Pharma AB, Fogdevreten 2A, 171 65 Solna, SE

(72) Izumitelj:

Marcel Linschoten, Brusewitz Väg 18, 13649 Vega, SE

(74) Zastupnik:

Odvjetničko društvo Vukmir i suradnici, 10000 Zagreb, HR

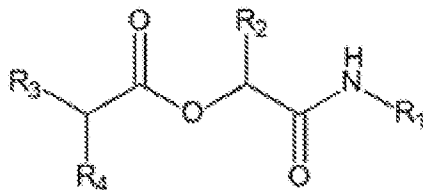
(54) Naziv izuma:

NOVI INHIBITORI ZA KALIKREIN 7

HR P20201915 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Spoj prema Formuli I



Formula I

pri čemu se R_1 odabire iz skupine koja sadrži aril, supstituirani aril, heteroaril i supstituirani heteroaril;

R_2 se odabire iz skupine koja sadrži vodik, alkil, supstituirani alkil, aril i supstituirani aril;

R_3 se odabire iz skupine koja sadrži alkil, cikloalkil, supstituirani cikloalkil, aril, supstituirani aril i $-C_1-C_3$ -alkil- R_5 , pri čemu se R_5 odabire iz skupine koja sadrži cikloalkil, supstituirani cikloalkil, aril, supstituirani aril;

R_4 se odabire iz skupine koja sadrži vodik, alkil, supstituirani alkil, aril, supstituirani aril, heteroaril, supstituirani aril i $-NH-CO-R_6$, pri čemu se R_6 odabire iz skupine koja sadrži aril, supstituirani aril, heteroaril i supstituirani heteroaril;

ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol za upotrebu u profilaksi, prevenciji i/ili liječenju kožnih bolesti.

2. Spoj za upotrebu prema zahtjevu 1,

pri čemu se R_1 odabire iz skupine koja sadrži fenil, supstituirani fenil, izoksazolil, supstituirani izoksazolil;

R_2 se odabire iz skupine koja sadrži vodik, $-C_1-C_6$ -alkil, C_1-C_3 -alkiloksi- C_1-C_6 -alkil i fenil;

R_3 se odabire iz skupine koja sadrži alkil, cikloalkil, supstituirani cikloalkil, aril, supstituirani aril i $-C_1-C_3$ -alkil- R_5 , pri čemu se R_5 odabire iz skupine koja sadrži cikloalkil, supstituirani cikloalkil, aril, supstituirani aril;

R_4 se odabire iz skupine koja sadrži vodik, alkil, supstituirani alkil, aril, supstituirani aril i $-NH-CO-R_6$, pri čemu se R_6 odabire iz skupine koja sadrži aril, supstituirani aril; ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

3. Spoj prema zahtjevu 1 ili 2 za upotrebu u profilaksi, prevenciji i/ili liječenju upalnih kožnih bolesti.

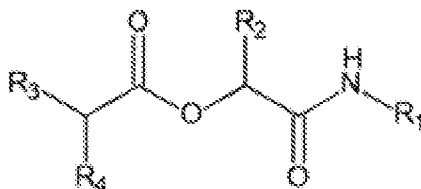
4. Spoj za upotrebu prema zahtjevu 1 ili 2,

pri čemu kožna bolest može biti Nethertonov sindrom, atopijski dermatitis, kontaktni dermatitis, ekcem, psorijaza, akne, epidermalna hiperkeratoza, akantoza, upala epiderme, dermalna upala i pruritus (svrbež).

5. Kozmetički pripravak ili pripravak za njegu kože koji sadrži barem jedan spoj s Formulom I, kako je definirano u zahtjevu 1 ili

njegovu farmaceutski prihvatljivu sol, pri čemu je navedeni pripravak u obliku koji je pogodan za lokalnu primjenu, a odabran je iz skupine koja se sastoji od kreme, masti, losiona, melema, gela, paste, štapića, spreja, šampona, sapuna, regeneratora za kosu i praška.

6. Spoj prema Formuli I



Formula I

pri čemu se R_1 odabire iz skupine koja sadrži aril, supstituirani aril, heteroaril i supstituirani heteroaril;

R_2 se odabire iz skupine koja sadrži vodik, alkil, supstituirani alkil, aril i supstituirani aril;

R_3 se odabire iz skupine koja sadrži alkil, cikloalkil, supstituirani cikloalkil, aril, supstituirani aril, heteroaril, supstituirani heteroaril i $-C_1-C_3$ -alkil- R_5 , pri čemu se R_5 odabire iz skupine koja sadrži cikloalkil, supstituirani cikloalkil, aril, supstituirani aril;

R_4 se odabire iz skupine koja sadrži vodik, alkil, supstituirani alkil, aril, supstituirani aril, heteroaril, supstituirani aril i $-NH-CO-R_6$, pri čemu se R_6 odabire iz skupine koja sadrži aril, supstituirani aril, heteroaril i supstituirani heteroaril;

pri čemu se spoj odabire iz skupine koja sadrži [1-metil-2-[(5-metilizoksazol-3-il)amino]-2-okso-etil] 2-(4-klorofenil) acetat 1-[(5-metilizoksazol-3-il)karbamoil]propil 2-(4-klorofenil)acetat [1-metil-2-[(5-metilizoksazol-3-il)amino]-2-okso-etil] 2-(4-metoksifenil) acetat 1-[(5-metilizoksazol-3-il)karbamoil]propil 2-(4-metoksifenil) acetat [1-metil-2-[(5-metilizoksazol-3-il)amino]-2-okso-etil] 3-ciklopentilpropanoat [2-(4-metoksianilin)-1-metil-2-okso-etil] 2-(4-metoksifenil) acetat 1-[(5-metilizoksazol-3-il)karbamoil]propil 3-ciklopentilpropanoat [2-[(5-metilizoksazol-3-il)amino]-2-okso-1-fenil-etil] 2-(4-klorofenil)acetat [2-[(5-metilizoksazol-3-il)amino]-2-okso-1-fenil-etil] 3-ciklopentilpropanoat 1-[(5-metilizoksazol-3-il)karbamoil]propil 2-(4-metoksifenil)acetat 1-[(5-metilizoksazol-3-il)karbamoil]propil 2-(1,3-benzodioksol-5-il)acetat [2-[(5-metilizoksazol-3-il)amino]-2-okso-1-fenil-etil] 2-(4-metoksifenil) acetat 1-[(5-metilizoksazol-3-

- il)karbamoil]propil 2-(3,4-diklorfenil)acetat 1-[(5-metilizoksazol-3-il)karbamoil]propil 2-(3,4-dimetoksifenil)acetat [1-metil-2-[(5-metilizoksazol-3-il)amino]-2-okso-etil] 2,2-difenilacetat[2-[(5-metilizoksazol-3-il)amino]-2-okso-1-fenil-etil] 2-benzamido-2-fenil-acetat [1-metil-2-[(5-metilizoksazol-3-il)amino]-2-okso-etil] 2-benzamido-2-fenil-acetat [2-[(5-metilizoksazol-3-il)amino]-2-okso-1-fenil-etil] 2,2-difenilacetat [2-[(5-metilizoksazol-3-il)amino]-2-okso-etil] 2-benzamido-2-fenil-acetat [2-metil-1-[(5-metilizoksazol-3-il)karbamoil]propil] 2-(4-klorofenil)acetat [2-metil-1-[(5-metilizoksazol-3-il)karbamoil]propil] 3-ciklopentilpropanoat [2-metil-1-[(5-metilizoksazol-3-il)karbamoil]propil] 2-benzamido-2-fenil-acetat [2-metil-1-[(5-metilizoksazol-3-il)karbamoil]propil] 2,2-difenilacetat [2-[(5-metilizoksazol-3-il)amino]-2-okso-etil] 2-(4-klorofenil)acetat [2-metil-1-[(5-metilizoksazol-3-il)karbamoil]propil] 2-(4-metoksifenil)acetat [2-(4-metoksianilin)-1-metil-2-okso-etil] 2-(4-klorofenil)acetat 1-[(4-metoksifenil)karbamoil]propil 2-(4-klorofenil)acetat 1-[(4-fluorofenil)karbamoil]propil 2-(4-klorofenil)acetat 1-(fenilkarbamoil)propil 2-(4-klorofenil)acetat [2-(4-metoksianilin)-1-metil-2-okso-etil] 3-ciklopentilpropanoat 1-[(4-metoksifenil)karbamoil]propil 3-ciklopentilpropanoat [2-(4-metoksianilin)-2-okso-1-fenil-etil] 2-(4-klorofenil)acetat [2-(4-metoksianilin)-2-okso-1-fenil-etil] 3-ciklopentilpropanoat 1-[(4-metoksifenil)karbamoil]propil 2-(4-karbamoil)acetat 1-[(4-fluorofenil)karbamoil]propil 3-ciklopentilpropanoat 1-[(4-fluorofenil)karbamoil]propil 2-(4-metoksifenil)acetat (2-anilino-1-metil-2-okso-etil) 3-ciklopentilpropanoat (2-anilino-2-okso-1-fenil-etil) 2-(4-klorofenil)acetat 1-(fenilkarbamoil)propil 2-(4-metoksifenil)acetat [2-(4-metoksianilin)-2-okso-1-fenil-etil] 2-(4-metoksifenil)acetat [2-(benzilamino)-2-okso-1-fenil-etil] 3-ciklopentilpropanoat [2-(4-metoksianilin)-2-okso-etil] 2-(4-metoksifenil)acetat 1-[(4-metoksifenil)karbamoil]propil 2,2-difenilacetat 1-[(4-fluorofenil)karbamoil]propil 2,2-difenilacetat 1-(fenilkarbamoil)propil 2,2-difenilacetat [2-(4-metoksianilin)-2-okso-etil] 2-benzamido-2-fenil-acetat [2-(4-fluoroanilin)-2-okso-etil] 2-benzamido-2-fenil-acetat (2-anilino-2-okso-etil) 2-benzamido-2-fenil-acetat 1-[(4-metoksifenil)karbamoil]propil 2-benzamido-2-fenil-acetat 1-[(4-fluorofenil)karbamoil]propil 2-benzamido-2-fenil-acetat (2-anilino-1-metil-2-okso-etil) 2-benzamido-2-fenil-acetat [2-(4-metoksianilin)-1-metil-2-okso-etil] 2-benzamido-2-fenil-acetat (2-anilino-2-okso-1-fenil-etil) 2-benzamido-2-fenil-acetat [2-(4-metoksianilin)-2-okso-1-fenil-etil] 2,2-difenilacetat [2-(benzilamino)-1-metil-2-okso-etil] 2-benzamido-2-fenil-acetat. [2-metil-1-(fenilkarbamoil)propil] 2-(4-klorofenil)acetat [1-[(4-metoksifenil)karbamoil]-2-metil-propil] 2-(4-klorofenil)acetat [2-metil-1-(fenilkarbamoil)propil] 2-benzamido-2-fenil-acetat [2-metil-1-(fenilkarbamoil)propil] 2-(4-metoksifenil)acetat [1-[(4-metoksifenil)karbamoil]-2-metil-propil] 2-benzamido-2-fenil-acetat i [1-[(4-fluorofenil)karbamoil]-2-metil-propil] 2-benzamido-2-fenil-acetat.
7. Farmaceutski pripravak koji sadrži spoj prema zahtjevu 6 u kombinaciji s farmaceutski prihvatljivim pomoćnim sredstvima, razrjeđivačima i/ili nositeljima.
 8. Spoj prema zahtjevu 6 ili farmaceutski pripravak prema zahtjevu 7 za upotrebu kao lijek.
 9. Spoj prema zahtjevu 6 ili farmaceutski pripravak prema zahtjevu 7 za upotrebu u profilaksi, prevenciji i/ili liječenju kožnih bolesti.
 10. Spoj ili farmaceutski pripravak za upotrebu prema zahtjevu 9, pri čemu se pod kožnom bolesti podrazumijeva upalna kožna bolest.
 11. Spoj ili farmaceutski pripravak za upotrebu prema zahtjevu 9, pri čemu kožna bolest može biti Nethertonov sindrom, atopijski dermatitis, kontaktni dermatitis, ekcem, psorijaza, akne, epidermalna hiperkeratoza, akantoza, upala epiderme, dermalna upala i pruritus (svrbež).
 12. Kozmetički pripravak ili pripravak za njegu kože koji sadrži barem jedan spoj prema zahtjevu 6 ili njegovu farmaceutski prihvatljivu sol, pri čemu je navedeni pripravak u obliku koji je pogodan za lokalnu primjenu, a odabran je iz skupine koja se sastoji od kreme, masti, losiona, melema, gela, paste, štapića, spreja, šampona, sapuna, regeneratora za kosu i praška.