



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20151018 T1

HR P20151018 T1

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

(51) MKP:

C07D 471/04 (2006.01)

A61K 31/437 (2006.01)

A61P 35/00 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 23.10.2015.

(21) Broj predmeta: P20151018T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 28.09.2015.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2009043691
Datum podnošenja međunarodne prijave: 13.05.2009.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 09747404.3
Datum podnošenja europske prijave patenta: 13.05.2009.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2009140320
Datum međunarodne objave: 19.11.2009.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2307409 A1
Datum objave europske prijave patenta: 13.04.2011.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2307409 B1
Datum objave europskog patenta: 12.08.2015.

(31) Broj prve prijave: 52926 P

(32) Datum podnošenja prve prijave: 13.05.2008.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelji:

Array Biopharma, Inc., 3200 Walnut Street, Boulder, CO 80301, US
Yvan Le Huerou, c/o Array BioPharma Inc., 3200 Walnut Street, Boulder, CO 80301, US
James F. Blake, c/o Array BioPharma Inc., 3200 Walnut Street, Boulder, CO 80301, US
Indrani W. Gunwardana, c/o Array BioPharma Inc., 3200 Walnut Street, Boulder, CO 80301, US
Peter J. Mohr, c/o Array BioPharma Inc., 3200 Walnut Street, Boulder, CO 80301, US
Eli M. Wallace, c/o Array BioPharma Inc., 3200 Walnut Street, Boulder, CO 80301, US
Bin Wang, c/o Array BioPharma Inc., 3200 Walnut Street, Boulder, CO 80301, US
Mark Chicarelli, c/o Array BioPharma Inc., 3200 Walnut Street, Boulder, CO 80301, US
Michael Lyon, c/o Array BioPharma Inc., 3200 Walnut Street, Boulder, CO 80301, US
Hraste & Partneri odvjetničko društvo, 10000 Zagreb, HR

(74) Zastupnik:

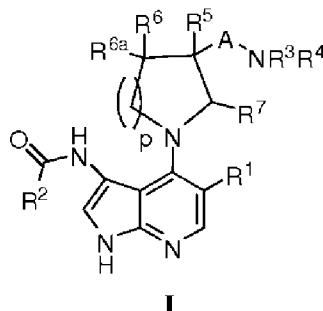
(54) Naziv izuma:

PIROLOPIRIDINI KAO INHIBITORI KINAZE

HR P20151018 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

1. Spoj, **naznačen time** što ga se bira iz Formule I:



i njegovi stereoizomeri, tautomeri i farmaceutski prihvatljive soli, gdje:
A se bira između izravne veze ili CR^aR^b;

R¹ se bira između vodika, halogena, CN, C₁-C₆ alkila, C₁-C₆ alkenila, -O(C₁-C₆ alkila), -S(C₁-C₆ alkila), C₃-C₆ cikloalkila, 4- do 6-eročlanog heterocikla, fenila i 5- ili 6-eročlanog heteroarila, gdje alkili, alkenil, cikloalkil, heterocikl, fenil ili heteroaril mogu biti supstituirani s jednom ili više skupina, koje se bira između halogena, CN, CF₃, C₁-C₃ alkila, -O(C₁-C₃ alkila) i NR^eR^d;

R² se bira između C₁-C₆ alkila, -O(C₁-C₆ alkila), -NH(C₁-C₆ alkila), zasićenog ili djelomično nezasićenog C₃-C₆ cikloalkila, fenila, zasićenog ili djelomično nezasićenog 4- do 6-eročlanog heterocikla, 5- ili 6-eročlanog heteroarila, 8- do 10-eročlanog bicikličkog arila, 8- do 10-eročlanog bicikličkog heterocikla i 8- do 10-eročlanog bicikličkog heteroarila, gdje alkili, cikloalkil, fenil, heterocikli, heteroarili i aril mogu biti supstituirani s jednom ili više skupina, koje se bira između OH, CN, halogena, okso (jedino ne na fenilu, arilu ili heteroarilu), CF₃, ciklopropila, ciklopropilmetila, -SO₂R¹, C₁-C₆ alkila, -O(C₁-C₆ alkila), -S(C₁-C₆ alkila), NR^eR^f i fenila, gdje fenil može biti supstituiran s jednom ili više skupina, koje se bira između OH, CN, halogena, CF₃, C₁-C₃ alkila, -O(C₁-C₃ alkil) i NR^eR^h;

R³ i R⁴ se neovisno bira između vodika ili C₁-C₄ alkila, koji može biti supstituiran s OH, F, -O(C₁-C₃ alkilom) ili C₃-C₆ cikloalkilom, ili

R³ i R⁴, zajedno s atomima na koje su vezani, tvore 5- ili 6-eročlani prsten;

R⁵ se bira između vodika i CH₃, ili

A je CR^aR^b, R^a i R^b su vodici, a R³ i R⁵, zajedno s atomima na koje su vezani, tvore 5- ili 6-eročlani prsten;

R⁶ se bira između vodika, F, OH, -OCH₃, C₁-C₃ alkila i ciklopropila, ili

A je izravna veza, R^{6a} je vodik, a R³ i R⁶, zajedno s atomima na koje su vezani, tvore 5- ili 6-eročlani prsten;

R^{6a} se bira između vodika, F, OH i CH₃;

R⁷ je vodik, ili

A je CR^aR^b, a R³ i R⁷, zajedno s atomima na koje su vezani, tvore 5- ili 6-eročlani prsten;

R^a je vodik, ili

R⁴ i R^b su odsutni, a R³ i R^a, zajedno s atomima na koje su vezani, tvore aromatski 5- ili 6-eročlani prsten;

R^b je vodik ili je odsutan;

R^e i R^d se neovisno bira između vodika i C₁-C₃ alkila, ili

R^e i R^d, zajedno s atom na koje su vezani, tvore 5- ili 6-eročlani prsten;

R^e i R^f se neovisno bira između vodika i C_1 - C_3 alkila;

R^g i R^h se neovisno bira između vodika i C_1 - C_3 alkila;

R^1 je C_1 - C_3 alkil; i

p je 0, 1, 2 ili 3.

2. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što je p 1 ili 2.

3. Spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 ili 2, **naznačen time** što se R^1 bira između vodika, Br, Cl, F, CN, CF_3 , metila, etila, izopropila, prop-1-en-2-ila, $-OCH_2CH_3$, $-OCH_2CH_2OCH_3$, $-SCH_3$, $-SCH_2CH_3$, $-SCH(CH_3)_2$, ciklopropila, fenila i 6-metilpiridin-3-ila.

4. Spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 3, **naznačen time** što se R^2 bira između metila, etila, propila, izopropila, *tert*-butila, izobutila, ciklopropilmetila, $-CH_2CF_3$, $-CH(CH_2CH_3)_2$, $-CH_2OH$, $-CH_2OCH_3$, $-CH_2OCH_2CH_3$, $-CH(CH_3)OCH_3$, $-CH_2CH_2OCH_3$, $-CH(CH_3)OH$, $-C(CH_3)_2OH$, $-CH_2CN$, $-CH_2CH_2F$, $-C(CH_3)_2F$, $-CH(CH_3)CH_2CH_3$, $-CH_2OCH(CH_3)_2$, $-CH(CH_3)OCH(CH_3)_2$, $-CH_2SO_2CH_3$, $-CH(CH_3)$ fenil, $-CH_2$ (fenil), $-OCH_2CH_3$, $-NH(CH_2CH_3)$, ciklopropila, ciklobutila, ciklopentila, 1-(trifluormetil)ciklopropila, 1-(metoksi)ciklopropila, 2,2-difluorciklopropila, 1-metilciklopropila, 2-fenilciklopropila, 2,2-dimetilciklopropila, fenila, 3-metilfenila, 4-fluorfenila, 3-metoksifenila, 3-fluorfenila, 3-klor-4-fluorfenila, 3-fluor-4-metoksifenila, 3-trifluormetilfenila, 2-fluor-5-metilfenila, 3-metiloksetan-3-ila, azetidin-1-ila, tetrahidrofuran-2-ila, tetrahidrofuran-3-ila, 1-metil-6-okso-1,6-dihidropiridin-3-ila, 1-metil-6-okso-1,6-dihidropiridazin-3-ila, 1-izopropil-6-okso-1,6-dihidropiridazin-3-ila, 1-(ciklopropilmetil)-6-okso-1,6-dihidropiridazin-3-ila, morfolin-2-ila, pirolidin-1-ila, 5-oksopirolidin-2-ila, pirazol-4-ila, 1-metil-1*H*-pirazol-3-ila, 1-metil-1*H*-pirazol-4-ila, 2-metiloksazol-4-ila, 5-metilzoksazol-3-ila, 2-metiltiazol-4-ila, piridin-2-ila, piridin-3-ila, 6-metoksipiridin-2-ila, 3-metilpiridin-2-ila, 5-klorpiridin-2-ila, 5-trifluormetilpiridin-2-ila, 2-metilpiridin-3-ila, 5-metilpiridin-3-ila, 5-klorpiridin-3-ila, 6-metilpiridin-3-ila, pirimidin-2-ila, 5-etilpirimidin-2-ila, pirazin-2-ila, 5-metilpirazin-2-ila i kinoksalin-2-ila.

5. Spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 4, **naznačen time** što je A izravna veza.

6. Spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 4, **naznačen time** što je A CR^aR^b .

7. Spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 6, **naznačen time** što se R^3 bira između vodika, metila, etila, izopropila, izobutila, CH_2CH_2OH , $CH_2CH_2OCH_3$, CH_2CH_2F i ciklopropilmetila.

8. Spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 7, **naznačen time** što se R^4 bira između vodika i metila.

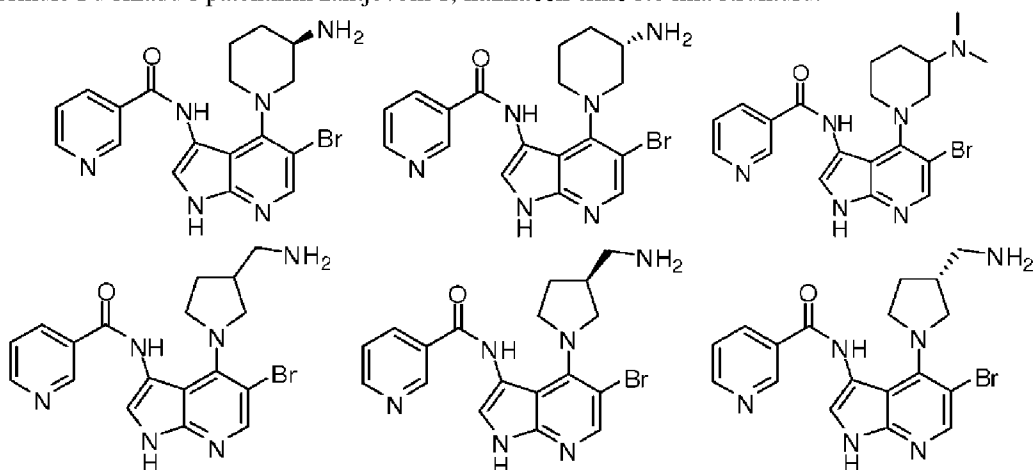
9. Spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 4, **naznačen time** što su R^4 i R^b odsutni, a R^3 i R^a , zajedno s atomima na koje su vezani, tvore aromatski 5- ili 6-eročlani prsten.

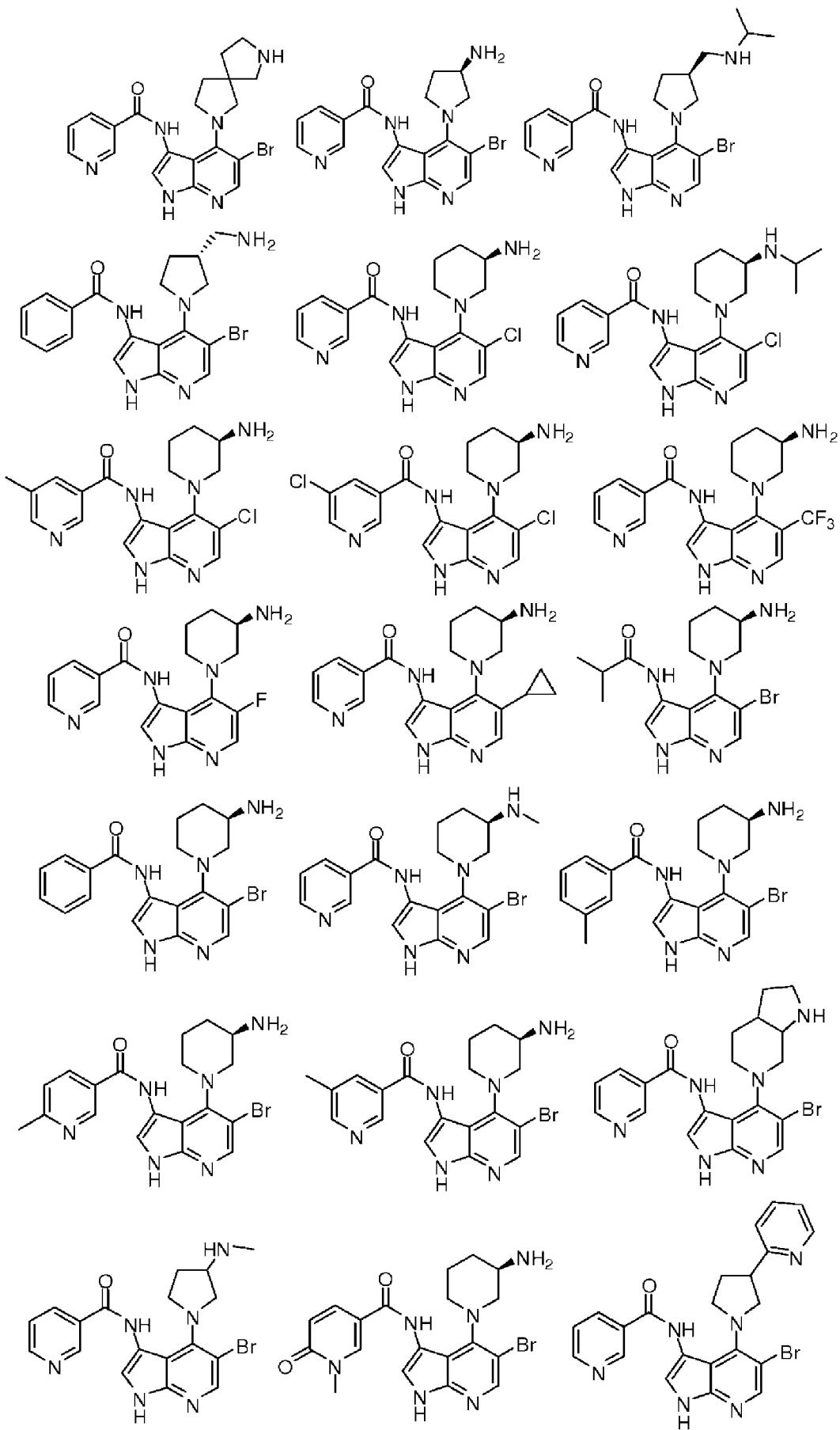
10. Spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 9, **naznačen time** što se R^5 bira između vodika i CH_3 .

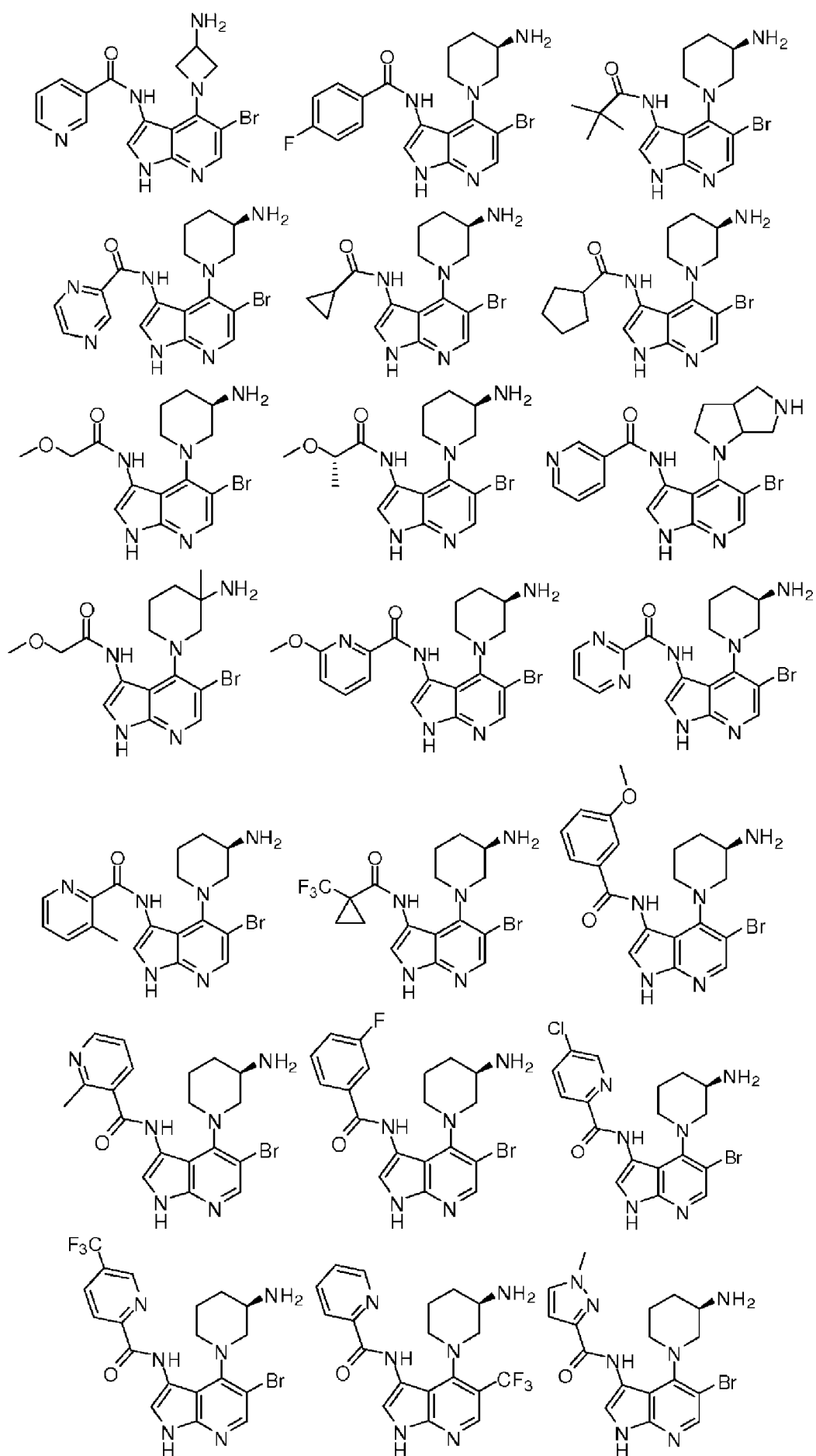
11. Spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 4, **naznačen time** što je A CR^aR^b , R^a i R^b su vodici, a R^3 i R^5 , zajedno s atomima na koje su vezani, tvore 5- ili 6-eročlani prsten, ili A je izravna veza, R^{6a} je vodik, a R^3 i R^6 , zajedno s atomima na koje su vezani, tvore 5- ili 6-eročlani prsten.

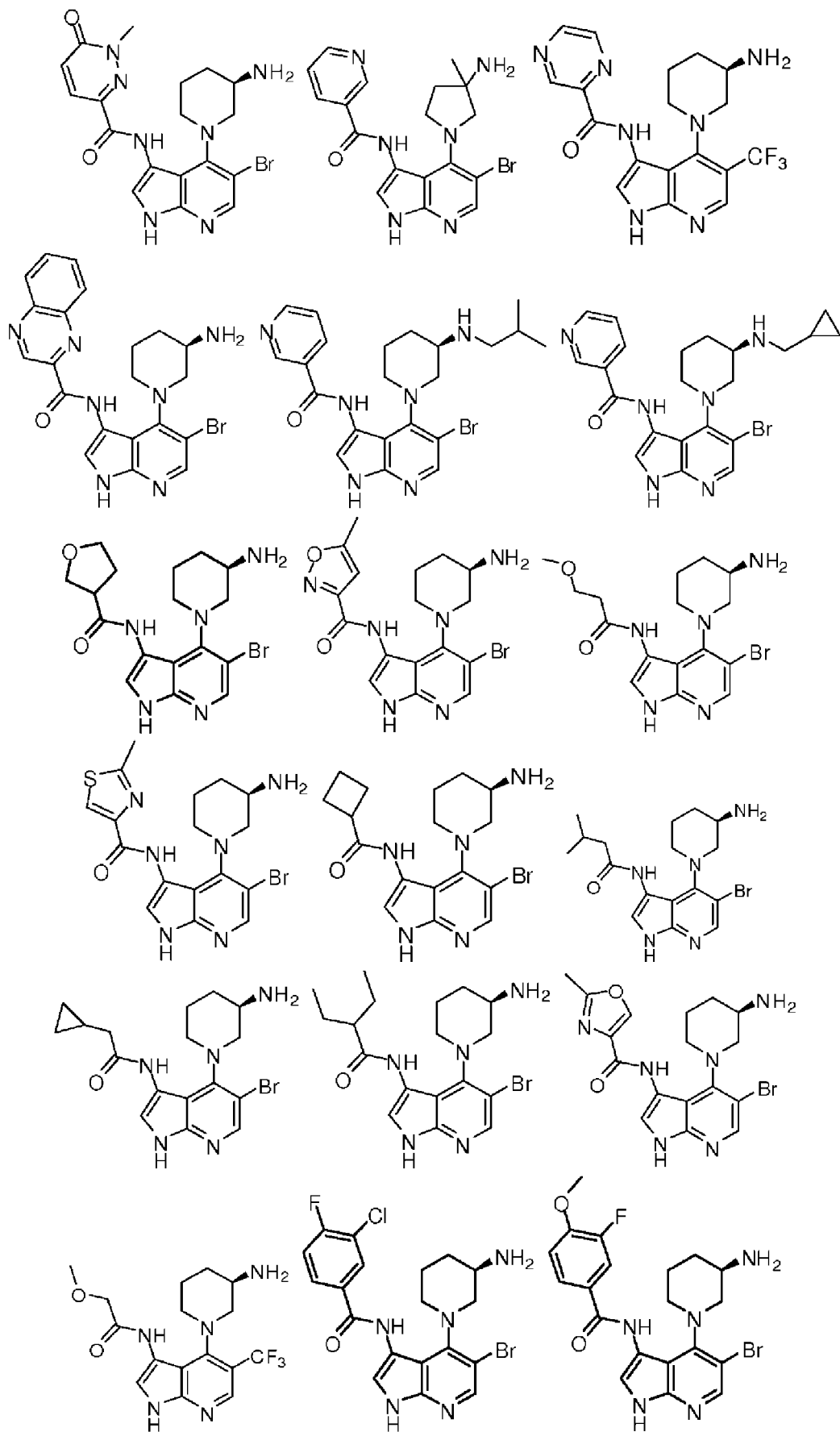
12. Spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 4, **naznačen time** što se R^6 bira između vodika, F, $-OCH_3$, metila i ciklopropila.

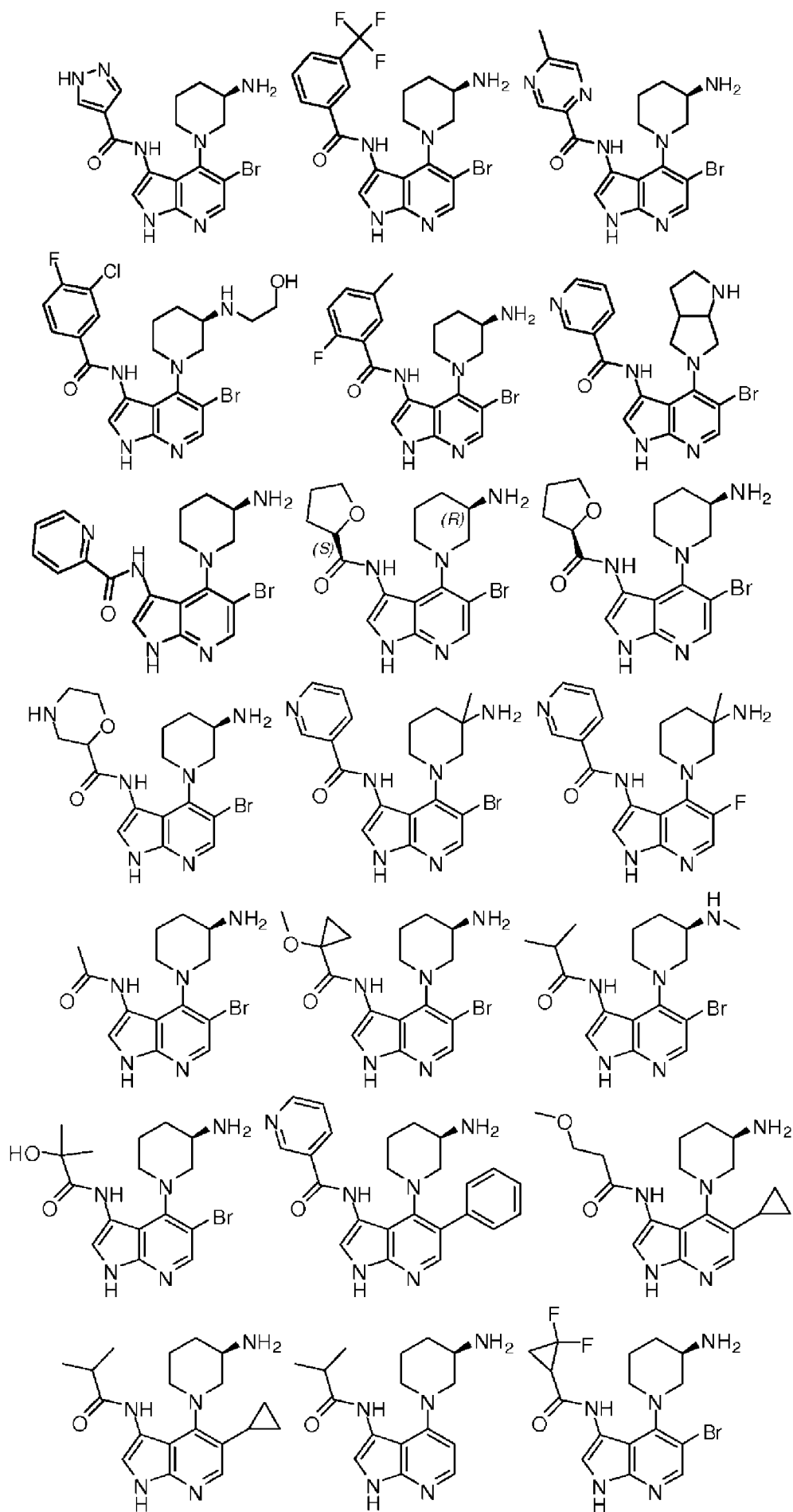
13. Spoj Formule I u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što ima strukturu:

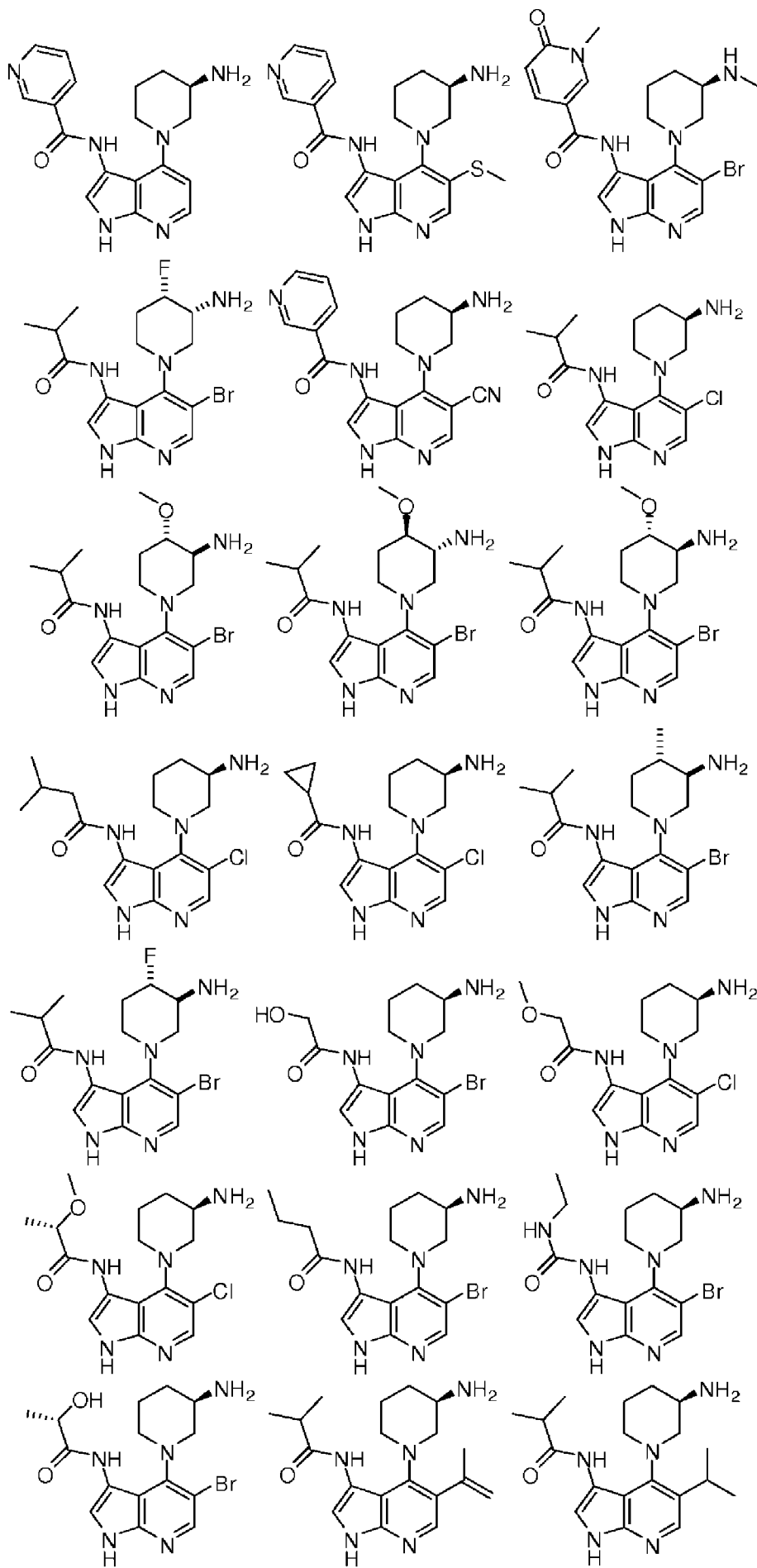


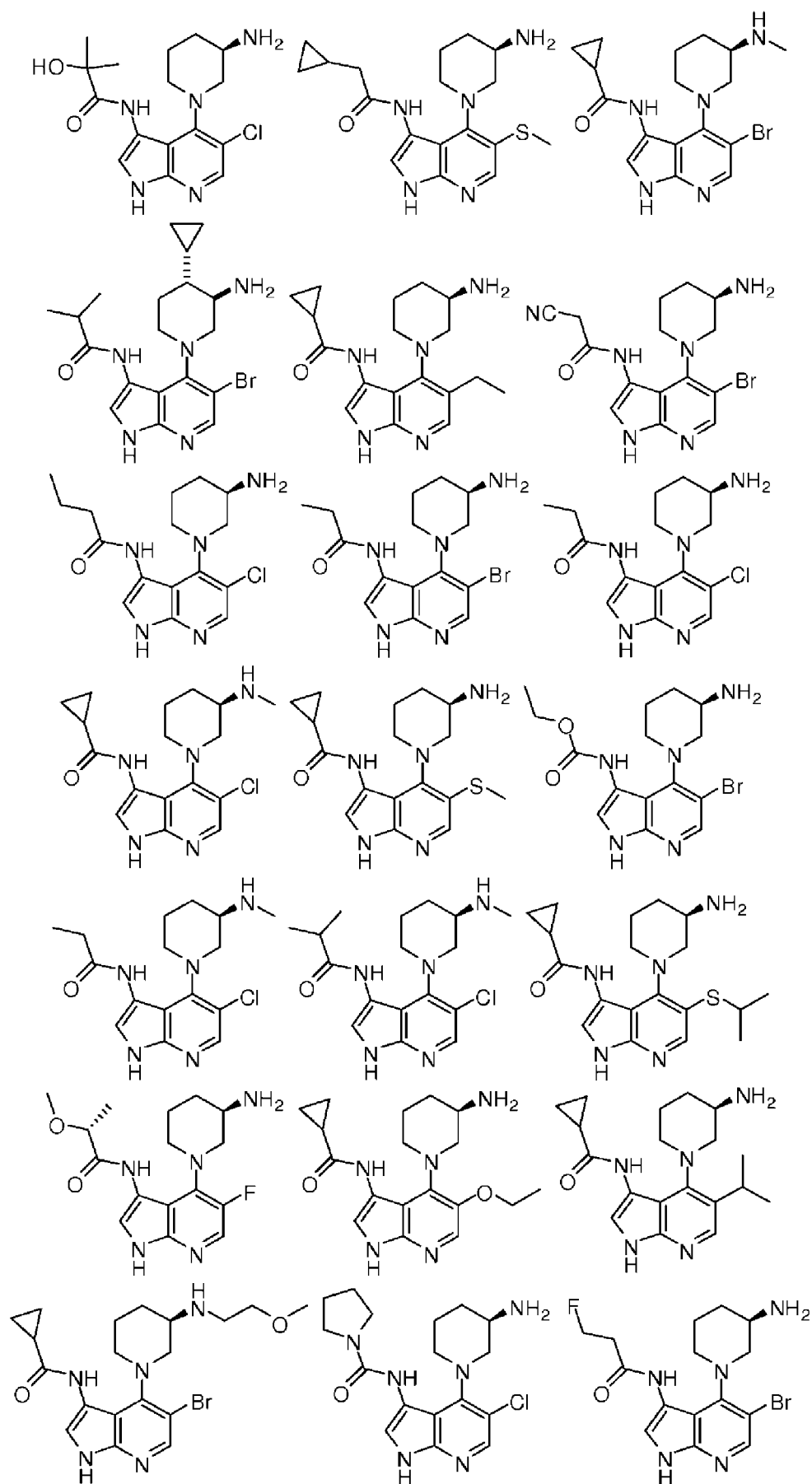


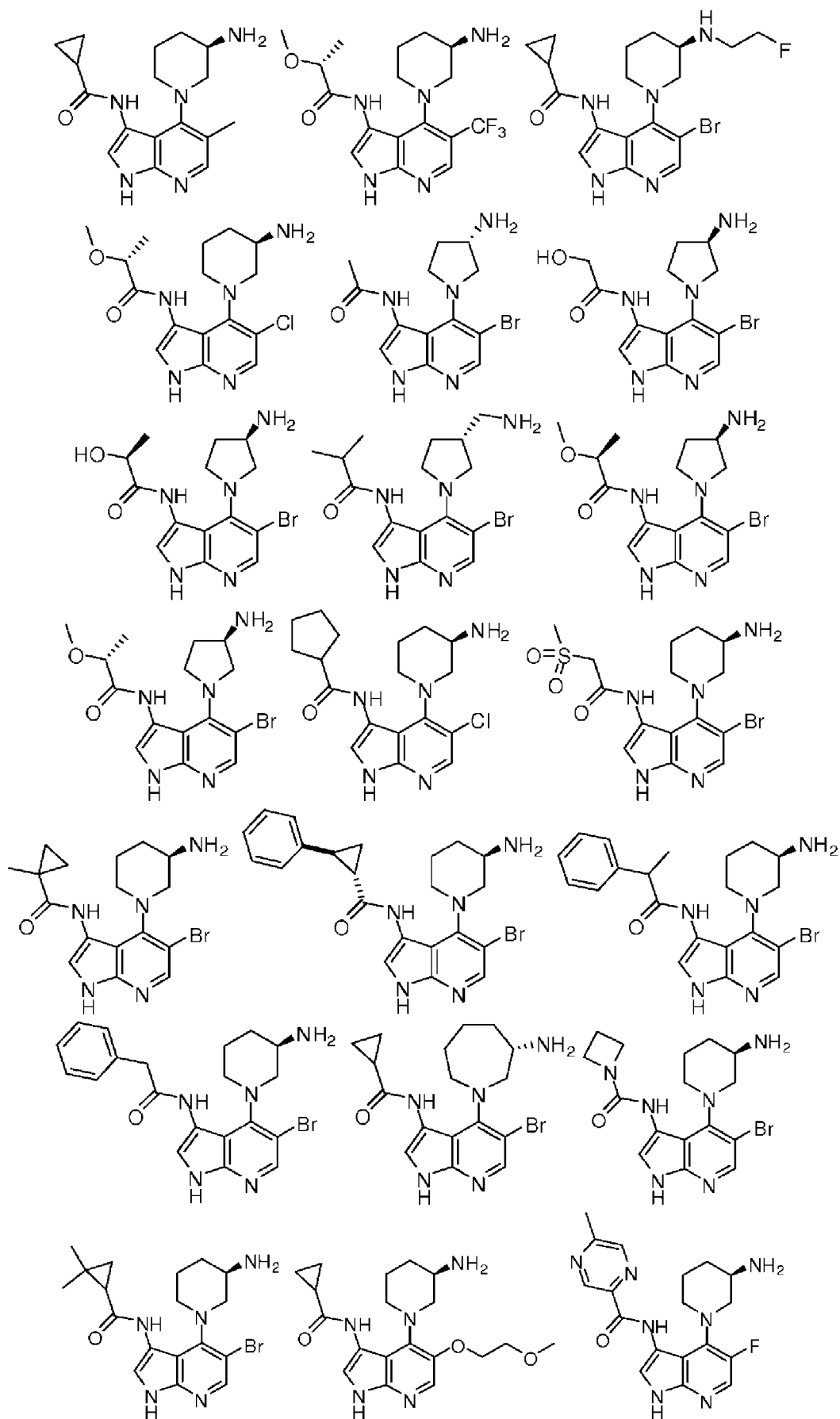


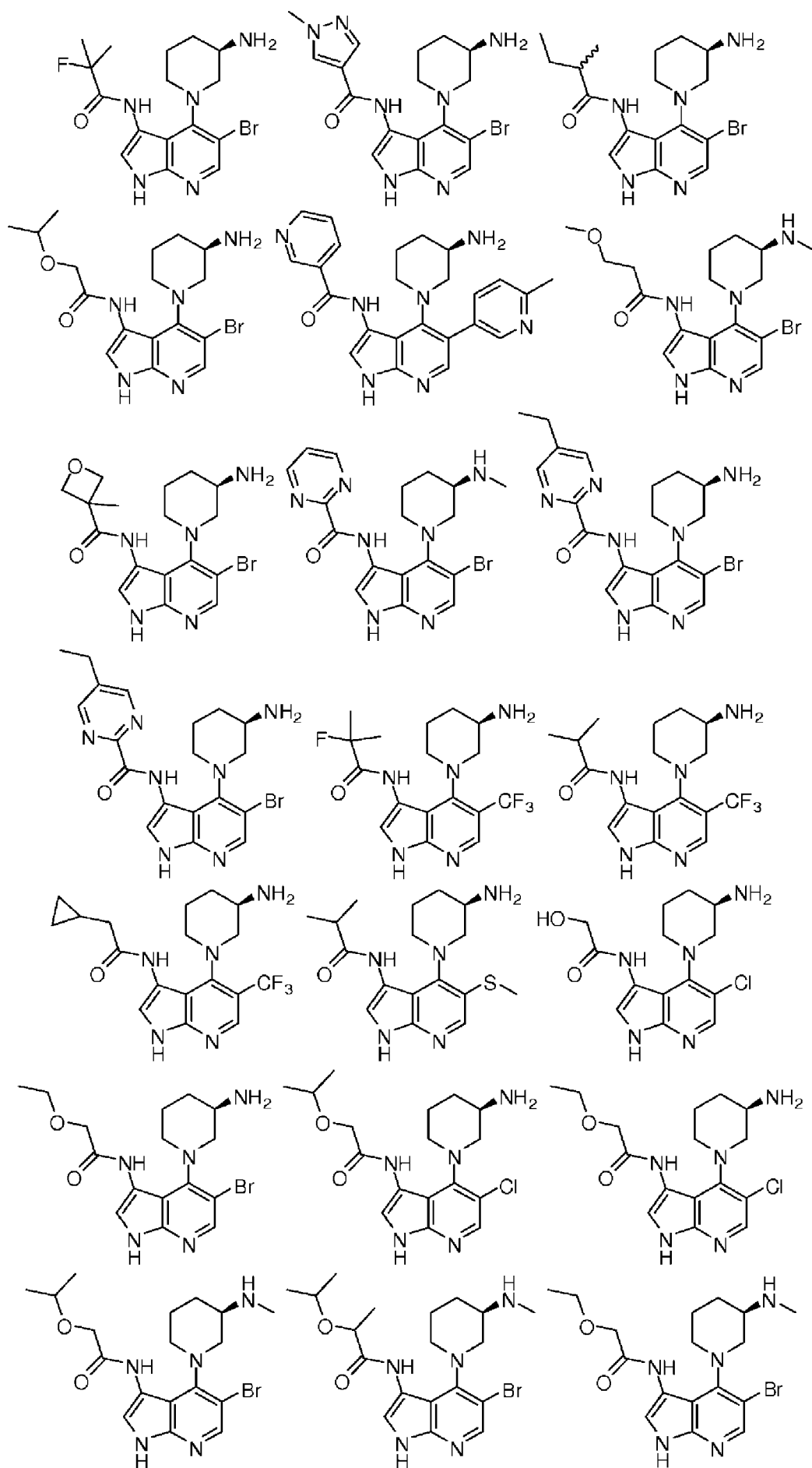


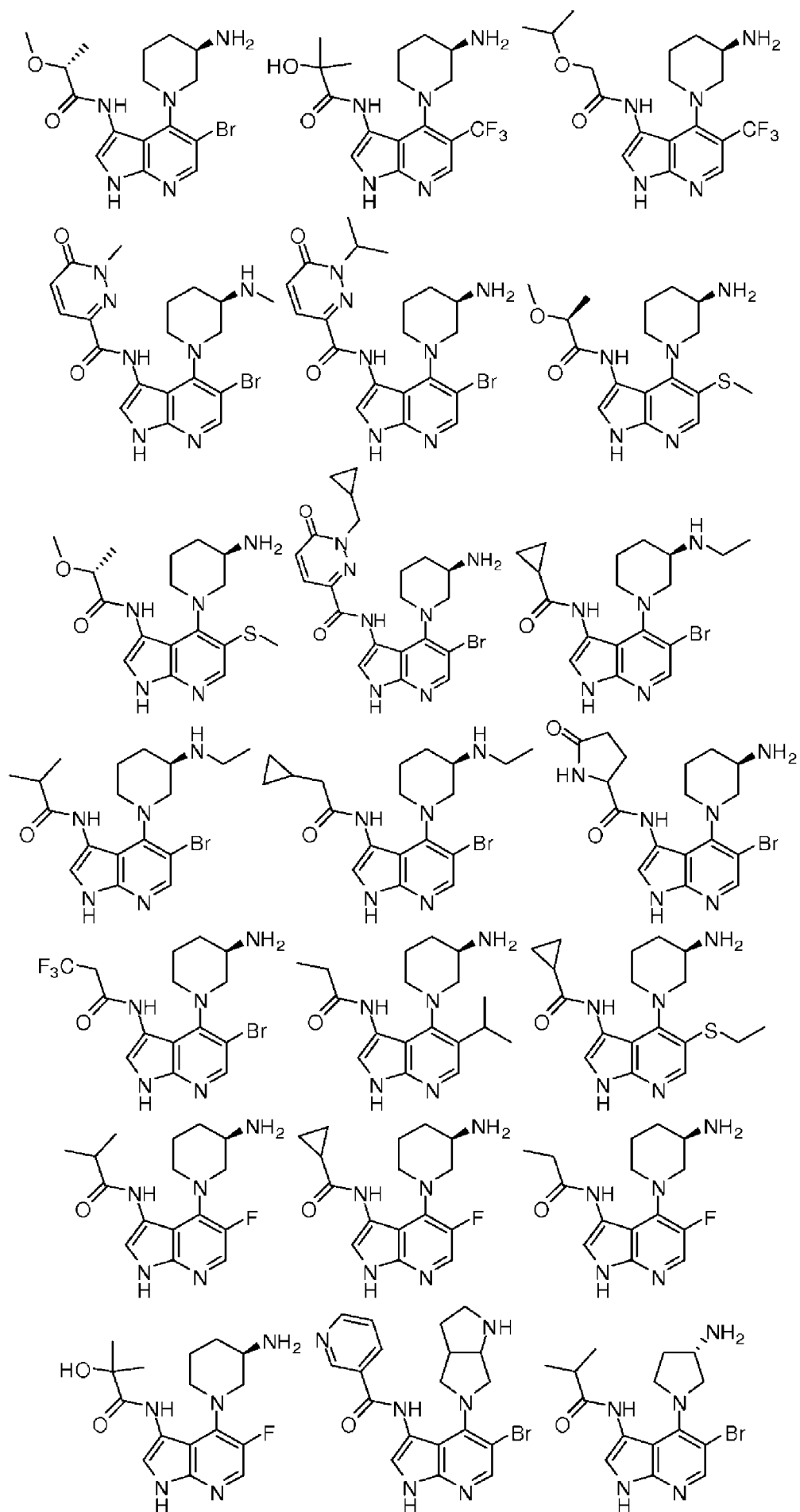


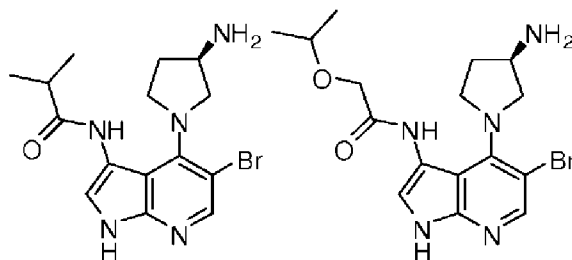








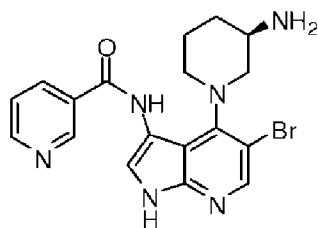




ili njihove farmaceutske prihvatljive soli.

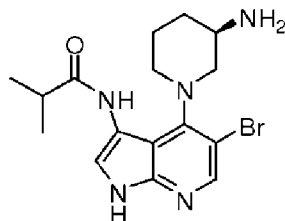
14. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što je:

5



ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol.

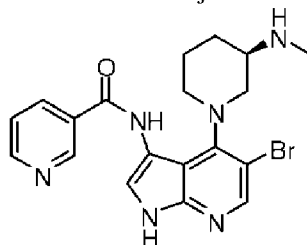
15. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što je:



10

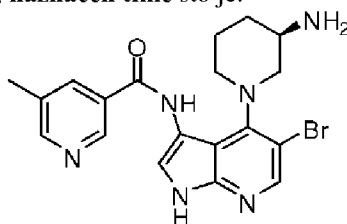
ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol.

16. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što je:



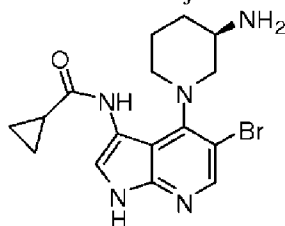
ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol.

15 17. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što je:



ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol.

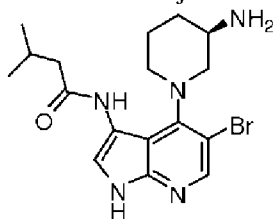
18. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što je:



20

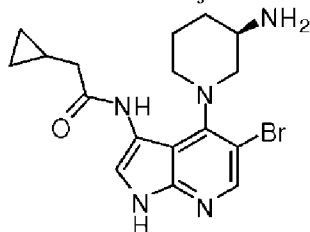
ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol.

19. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što je:



ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

20. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što je:



ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

21. Farmaceutski pripravak, **naznačen time** što sadrži spoj, ili njegovu farmaceutski prihvatljivu sol, u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 20, kao i farmaceutski prihvatljivu podlogu ili pomoćnu tvar.

22. Spoj, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 20, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi u terapiji.