



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20240793 T1

HR P20240793 T1

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

(51) MKP:

C07D 405/14 (2006.01)
C07D 405/12 (2006.01)
A61K 31/44 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 13.09.2024.

(21) Broj predmeta: P20240793T

(22) Datum podnošenja: 17.04.2019.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2019027932
Datum podnošenja međunarodne prijave: 17.04.2019.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 19722363.9
Datum podnošenja europske prijave patenta: 17.04.2019.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2019204490
Datum međunarodne objave: 24.10.2019.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3781561 A1
Datum objave europske prijave patenta: 24.02.2021.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3781561 B1
Datum objave europskog patenta: 13.03.2024.

(31) Broj prve prijave: 201862659408 P (32) Datum podnošenja prve prijave: 18.04.2018. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelj patenta:

**Constellation Pharmaceuticals, Inc., 470 Atlantic Avenue, Suite 1401,
Boston, MA 02210, US**

(72) Izumitelji:

**Alexandre Côté, 753 Union Boulevard, H7X 1X7 Laval, QC, CA
Victor, S. Gehling, 10 Ware Street Rear Unit, Somerville, MA 02144, US
Avinash Khanna, 63 Hurley Street, Apt. 1L, Cambridge, MA 02141, US
Ludivine Moine, 15 York Place 4, Cambridge, MA 02141, US
Jacob, I. Stuckey, 2 Claudette Circle, Framingham, MA 01701, US**

(74) Zastupnik:

PRODUCTA d.o.o., 10000 Zagreb, HR

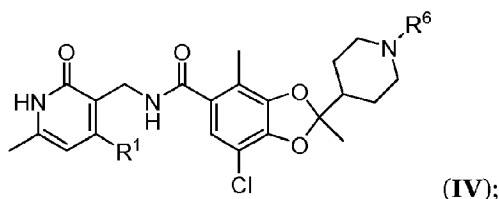
(54) Naziv izuma:

MODULATORI ENZIMA KOJI MODIFICIRAJU METIL, NJIHOVI PRIPRAVCI I UPOTREBA

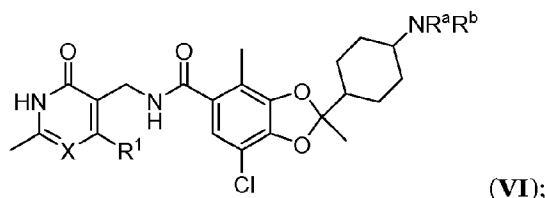
HR P20240793 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

1. Spoj formule IV ili VI:



5 ili



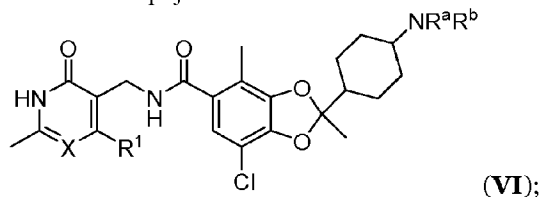
ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, naznačen time što:

R¹ je -SCH₃ ili klor;

X je CH;

10 R^a je vodik, (C₁-C₄)alkil, ili halo(C₁-C₄)alkil;R^b je (C₁-C₄)alkil, halo(C₁-C₄)alkil, ili 4-7 pri čemu je navedeni heterociklil izbornu supstituiran s 1 do 3 skupine odabrane iz niza koji sadrži halo, (C₁-C₄)alkil, halo(C₁-C₄)alkil, (C₁-C₄)alkoksi, i halo(C₁-C₄)alkoksi; iliR^a i R^b zajedno s atomom dušika na koji su oni vezani tvore 4-7 člani heterociklil po izboru supstituiran s 1 do 3 skupine odabrane iz niza koji sadrži halo, (C₁-C₄)alkil, halo(C₁-C₄)alkil, i -OR^c;15 R^c je (C₁-C₄)alkil, halo(C₁-C₄)alkil, ili (C₃-C₇)cikloalkil;R⁶ je halo(C₁-C₄)alkil.

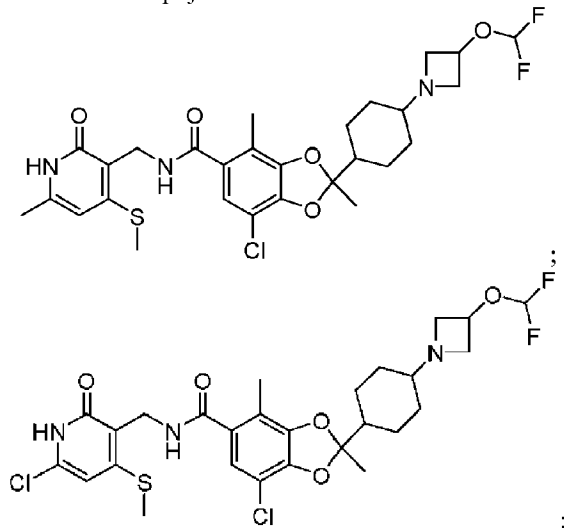
2. Spoj prema zahtjevu 1, naznačen time što spoj ima formulu:

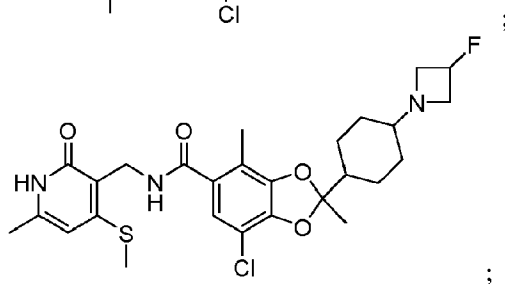
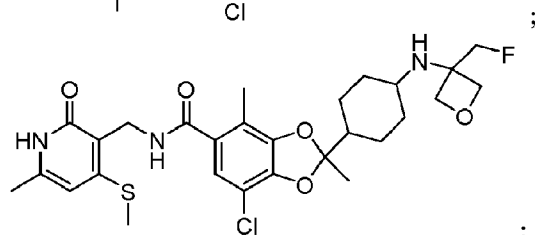
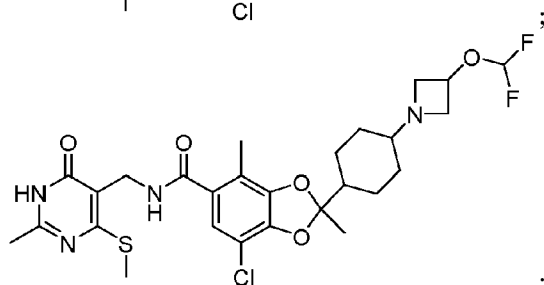
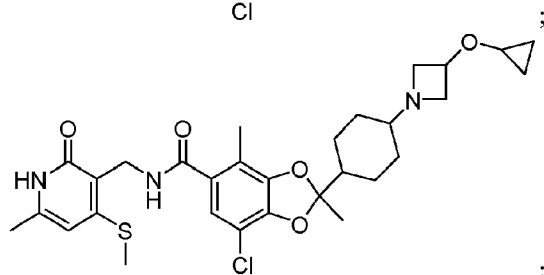
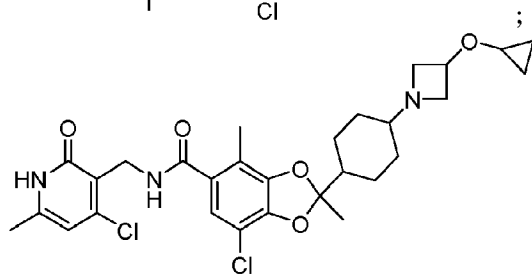
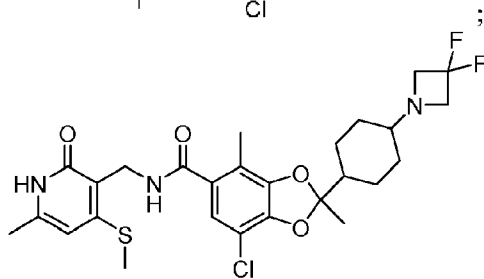
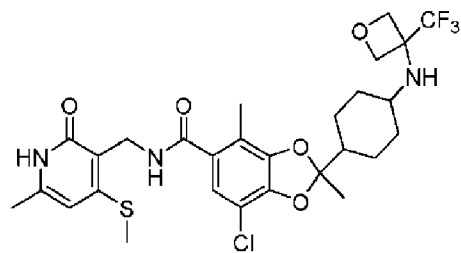


ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

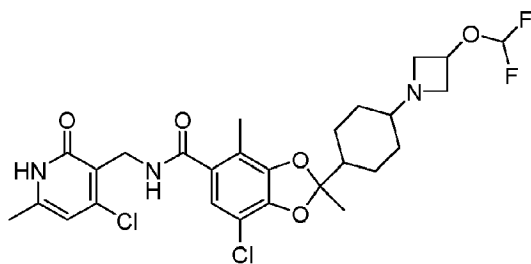
20 3. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 ili 2, naznačen time što R^b je (C₁-C₄)alkil ili oksetanil, pri čemu je navedeni oksetanil izbornu supstituiran s halo(C₁-C₄)alkilom; ili R^a i R^b zajedno s atomom dušika na koji su oni vezani tvore azetidinil izbornu supstituiran s halo ili -OR^c.4. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 3, naznačen time što R^a je vodik ili metil; i R^b je metil ili oksetanil, pri čemu je navedeni oksetanil izbornu supstituiran s -CH₂F ili -CF₃.25 5. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 4, naznačen time što R^a i R^b zajedno s atomom dušika na koji su oni vezani tvore azetidinil izbornu supstituiran s 1 do 2 fluora ili -OR^c; i R^c je -CH₃, -CHF₂, ili ciklopropil.

6. Spoj prema zahtjevu 1, naznačen time što spoj ima formulu:

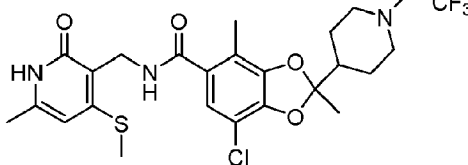




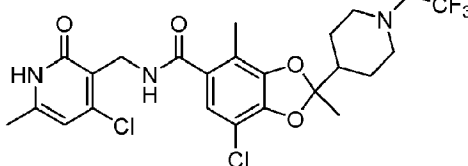
5



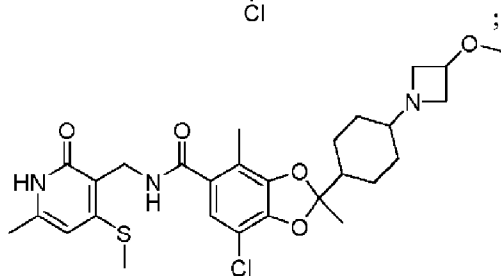
;



;

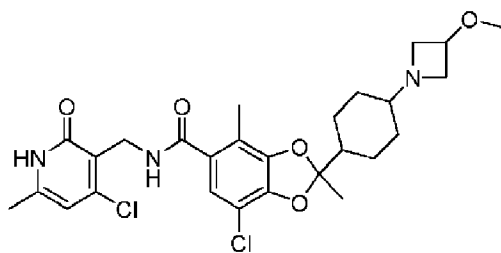


;



;

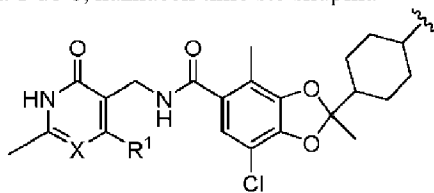
5 ili



;

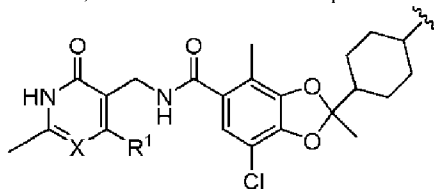
ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

7. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 6, naznačen time što skupina



10 i NR^aR^b su orijentirani trans oko cikloheksila.

8. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 6, naznačen time što skupina



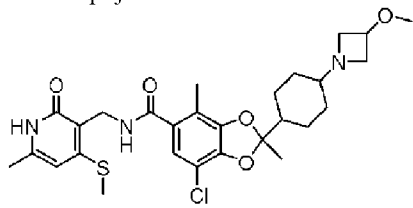
i NR^aR^b su orijentirani cis oko cikloheksila.

9. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 8, naznačen time što stereokemijska konfiguracija kiralnog središta 1,3-dioksolanila je R.

15

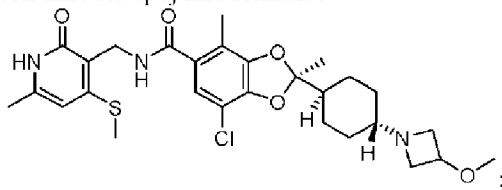
10. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 8, stereokemijska konfiguracija kiralnog središta 1,3-dioksolanila je S.

11. Spoj prema zahtjevu 1, naznačen time što spoj ima formulu:



ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

12. Spoj prema zahtjevu 11, naznačen time što spoj ima formulu:



ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

13. Farmaceutski pripravak naznačen time što sadrži spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 12, ili njegovu farmaceutski prihvatljivu sol, i farmaceutski prihvatljiv nosač.

14. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 12, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, za upotrebu u liječenju raka kod subjekta.

15. Spoj za upotrebu prema zahtjevu 14, naznačen time što je rak odabran između raka dojke, raka prostate, raka debelog crijeva, karcinoma bubrežnih stanica, multiformnog glioblastoma, raka mokraćnog mjehura, melanoma, raka bronha, limfoma, kolangiosarkoma, multiplog mijeloma, raka pluća, raka jajnika, i raka jetre.