



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20210095 T1



HR P20210095 T1

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

(51) MKP:

C07D 471/04 (2006.01)
A61K 45/06 (2006.01)
A61P 17/00 (2006.01)
A61P 29/00 (2006.01)
A61P 37/00 (2006.01)
A61P 37/08 (2006.01)
A61P 43/00 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 05.03.2021.

(21) Broj predmeta: P20210095T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 19.01.2021.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2018050548
Datum podnošenja međunarodne prijave: 10.01.2018.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 18702412.0
Datum podnošenja europske prijave patenta: 10.01.2018.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2018130563
Datum međunarodne objave: 19.07.2018.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3568396 A1
Datum objave europske prijave patenta: 20.11.2019.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3568396 B1
Datum objave europskog patenta: 11.11.2020.

(31) Broj prve prijave: 17151020

(32) Datum podnošenja prve prijave: 11.01.2017.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: EP

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelji:

Leo Pharma A/S, Industriparken 55, 2750 Ballerup, DK
Jens Larsen, c/o LEO Pharma A/S, Industriparken 55, 2750 Ballerup, DK
Mogens Larsen, c/o LEO Pharma A/S, Industriparken 55, 2750 Ballerup, DK
Lars Kyhn Rasmussen, Kaløvej 19, 2720 Vanløse, DK
Andreas Ritzen, c/o LEO Pharma A/S, Industriparken 55, 2750 Ballerup, DK
Tine Marianne Duus, c/o LEO Pharma A/S, Industriparken 55, 2750 Ballerup, DK

(74) Zastupnik:

Odvjetnik Tomislav Hadžija, u suradnji sa DENNEMEYER & ASSOCIATES,
BCI- Business Center International - 1. kat, 10000 Zagreb, HR

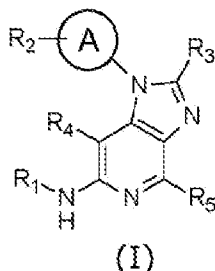
(54) Naziv izuma:

**NOVI DERIVATI AMINO-IMIDAZOPIRIDINA KAO INHIBITORI JANUS KINAZE I NJIHOVA
FARMACEUTSKA UPOTREBA**

HR P20210095 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Spoj prema općoj formuli (I)



gdje

A predstavlja C₆-cikloalkil, pri čemu je navedeni C₆-cikloalkil opcionalno supstituiran sa jednim ili više deuterija;

R₁ predstavlja C₁-alkil, pri čemu je navedeni C₁-alkil opcionalno supstituiran sa jednim ili više deuterija;

R₂ predstavlja C₁-alkil, pri čemu je navedeni C₁-alkil supstituiran sa supstituentom izabranim od R₆; i pri čemu je navedeni C₁-alkil opcionalno supstituiran sa jednim ili više deuterija;

R₃ predstavlja C₂-alkil, pri čemu je navedeni C₂-alkil supstituiran sa supstituentom izabranim od R₇ i pri čemu je navedeni C₂-alkil opcionalno supstituiran sa jednim ili više deuterija;

R₄ predstavlja vodik ili deuterij;

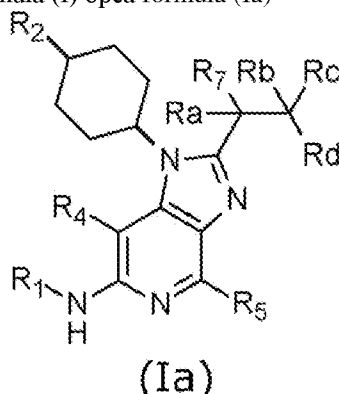
R₅ predstavlja vodik ili deuterij;

R₆ predstavlja cijano;

R₇ predstavlja hidroksil;

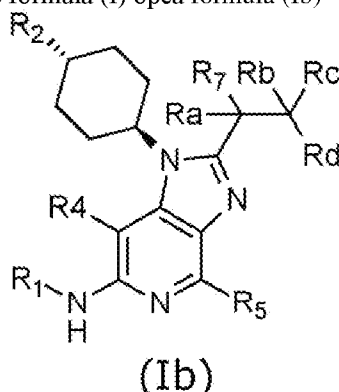
ili njegove farmaceutski prihvatljive soli, hidrati ili solvati.

2. Spoj prema zahtjevu 1 pri čemu je formula (I) opća formula (Ia)



gdje su R₁-R₂, R₄-R₇ kako je definirano u zahtjevu 1 i gdje su Ra, Rb, Rc i Rd svaki nezavisno izabrani od vodika i deuterija.

3. Spoj prema zahtjevu 1 ili 2 pri čemu je formula (I) opća formula (Ib)



gdje R₁-R₂, R₄-R₇, Ra, Rb, Rc i Rd su kako je definirano u zahtjevu 1 ili 2.

4. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1-3 izabran od

trans-2-[4-[2-[1-hidroksietil]-6-(metilamino)imidazo[4,5-*c*]piridin-1-il]cikloheksil]acetonitrila, *trans*-2-[4-[2-[(1*S*)-1-hidroksietil]-6-(metilamino)imidazo[4,5-*c*]piridin-1-il]cikloheksil]-acetonitrila, *trans*-2-[4-[2-[(1*R*)-1-hidroksietil]-6-(metilamino)imidazo[4,5-*c*]piridin-1-il]cikloheksil]acetonitrila, *trans*-2-[4-[2-[(1*R*)-1-hidroksietil]-6-(trideuteriometilamino)imidazo[4,5-*c*]piridin-1-il]cikloheksil]acetonitrila,

trans-2-[4-[2-[1,2,2,2-tetradeuterio-1-hidroksietil]-6-(metilamino)imidazo[4,5-c]piridin-1-il]cikloheksil]acetonitrila,

cis-2-[4-[2-[1-hidroksietil]-6-(metilamino)imidazo[4,5-c]piridin-1-il]cikloheksil]acetonitrila i

cis-2-[4-[2-[(1*R*)-1-hidroksietil]-6-(metilamino)imidazo[4,5-c]piridin-1-il]cikloheksil]acetonitrila,

ili njihovih farmaceutski prihvatljivih soli, hidrata ili solvata.

5. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1-4, pri čemu je naveden spoj *trans*-2-[4-[2-[(1*R*)-1-hidroksietil]-6-(metilamino)imidazo[4,5-c]piridin-1-il]cikloheksil]acetonitril, ili njegove farmaceutski prihvatljive soli.

6. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1-5 za upotrebu kao lijek.

7. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1-5 za upotrebu u preventivi i/ili liječenju bolesti imunološkog sustava kao što su autoimune bolesti, ili bolesti povezane s deregulacijom imunološkog sustava.

8. Spoj za upotrebu prema zahtjevu 7 u preventivi i/ili liječenju atopijskog dermatitisa.

9. Farmaceutski sastav koja sadrži spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1-5 zajedno s farmaceutski prihvatljivim prijenosnikom ili pomoćnom tvari ili farmaceutski prihvatljivim nosačem(ima).

10. Farmaceutski sastav prema zahtjevu 9 zajedno s jednim ili više drugih terapijski aktivnih spojeva.

11. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1-5 za upotrebu u liječenju bolesti, gdje bolest reagira na inhibiciju aktivnosti JAK1 kinaze.

12. Spoj izabran od 2-[*trans*-4-[(5-amino-2-kloropiridin-4-il)amino]cikloheksil]acetonitrila ili njegovih soli.

13. Spoj izabran od

2-[*trans*-4-[6-kloro-2-(1-hidroksietil)-1*H*-imidazo[4,5-c]piridin-1-il]cikloheksil]acetonitrila,

2-[*trans*-4-[6-kloro-2-[(1*R*)-1-hidroksietil]-1*H*-imidazo[4,5-c]piridin-1-il]cikloheksil]acetonitrila i

trans-2-[4-[6-kloro-2-(1,2,2,2-tetradeuterio-1-hidroksi-etil)imidazo[4,5-c]piridin-1-il]cikloheksil]acetonitrila,

ili njihovih soli.