



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20100715 T1

HR P20100715 T1

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

(51) MKP:

A61K 31/4196 (2006.01)
C07D 249/14 (2006.01)
C07D 401/04 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)
A61P 37/08 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 28.02.2011.

(21) Broj predmeta: P20100715T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 22.12.2010.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2005037830
Datum podnošenja međunarodne prijave: 21.10.2005.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 05815914.6
Datum podnošenja europske prijave patenta: 21.10.2005.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2006047256
Datum međunarodne objave: 04.05.2006.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 1811998 A1
Datum objave europske prijave patenta: 01.08.2007.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 1811998 B1
Datum objave europskog patenta: 20.10.2010.

(31) Broj prve prijave: 621270 P

(32) Datum podnošenja prve prijave: 21.10.2004.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelj patenta:

**Vertex Pharmaceuticals Incorporated, 130 Waverly Street, Cambridge,
MA, US**

(72) Izumitelji:

Robert J. Davies, 47 Princeton Street, 02144 Somerville, MA, US
Cornelia J. Forster, 8 Nancy Avenue, 03076 Pelham, NH, US
Michael J. Arnost, 29 Paddock Lane, 01845 N. Andover, MA, US
Jian Wang, 15 Elliot Street, 02461 Newton, MA, US

(74) Zastupnik:

Odvjetničko društvo Vukmir i suradnici, 10000 Zagreb, HR

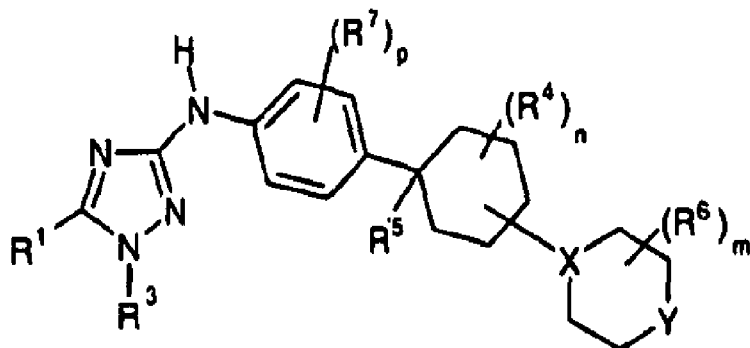
(54) Naziv izuma:

TRIAZOLI KORISNI KAO INHIBITORI PROTEIN KINAZA

HR P20100715 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Spoj formule (II):



(II)

pri čemu

X je N;

Y je NR^o, ili O;

n je 0;

m je 0;

p je 0;

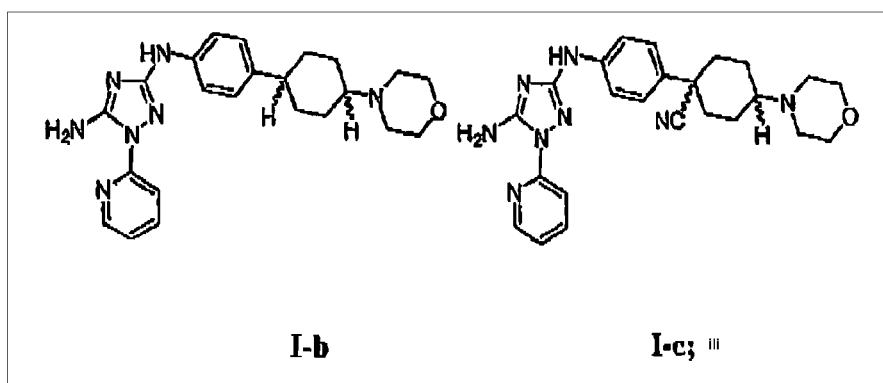
R¹ je -N(H)R₂;R² je vodik;R³ je 2-piridil;R⁵ je vodik, ili -CN;

naznačen time, da je svaki pojedini neovisni slučaj R^o odabran iz vodika, opcionalno supstituiranog C₁₋₆ alifatskog, nesupstituiranog 5-6-ero članog heteroarila ili heterocikličkog prstena (pod uvjetom da je dušikov atom u heterocikličkom prstenu opcijski supstituiran sa -R⁺ ili -C(O)R⁺, pri čemu R⁺ je (C₁₋₆alkil), bolje (C₁₋₄alkil), fenil, -O(Ph), ili -CH₂(Ph), ili, bez obzira na gornju definiciju, dva neovisna slučaja R^o, na istom supstituentu ili različitim supstituentima, uzeta zajedno sa atomom(ima) u kojima je pojedina R^o grupa vezana, formira 5-8-ero člani heterociklil, aril, ili heteroarilni prsten ili 3-8-ero člani cikloalkilni prsten koji ima 0-3 heteroatoma nezavisno odabrana iz dušika, kisika, ili sumpora;

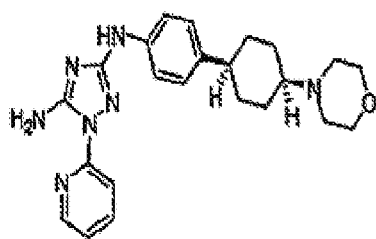
pri čemu svaki nezavisni slučaj R^o je odabran iz vodika, opcijski supstituiranog C₁₋₆ alifatskog, nesupstituiranog 5-6-ero članog heteroarila ili heterocikličkog prstena, fenila, -O(Ph), ili -CH₂(Ph), ili, bez obzira na gornju definiciju, dva neovisna slučaja R^o, na istom supstituentu ili različitim supstituentima, koji su uzeti zajedno s atomom(ima) u kojima pojedina R^o skupina je vezana, tvori 5-8-ero člani heterociklil, aril, ili heteroarilni prsten ili 3-8-ero člani cikloalkilni prsten koji ima 0-3 heteroatoma neovisno odabrana iz skupine dušika, kisika, ili sumpora; alifatska skupina R^o je opcijski supstituirana sa NH₂, NH(C₁₋₄ alifatski), N(C₁₋₄ alifatski)₂, halogen, C₁₋₄ alifatski, OH, O(C₁₋₄ alifatski), NO₂, CN, CO₂H, CO₂(C₁₋₄ alifatski), O(halo C₁₋₄ alifatski), ili halo(C₁₋₄ alifatski), pri čemu je svaka od gore navedenih C₁₋₄ alifatskih skupina nesupstituirana;

svaki pojedini R* je neovisno odabran iz vodika ili je C₁₋₆ alifatskog opcijski supstituiranog sa NH₂, NH(C₁₋₄ alifatski), N(C₁₋₄ alifatski)₂, halogen, C₁₋₄ alifatski, OH, O(C₁₋₄ alifatski), NO₂, CN, CO₂H, CO₂(C₁₋₄ alifatski), O(halo C₁₋₄ alifatski), ili halo(C₁₋₄ alifatski), pri čemu je svaka od gore navedenih C₁₋₄ alifatskih skupina nesupstituirana; i R je vodik ili C₁₋₆ alifatska skupina, opcijski supstituirana sa =O, =S, -NH₂, NH(C₁₋₄ alifatski), N(C₁₋₄ alifatski)₂, halogen, C₁₋₄ alifatski, OH, O(C₁₋₄ alifatski), NO₂, CN, CO₂H, CO₂(C₁₋₄ alifatski), O(halo C₁₋₄ alifatski), ili halo(C₁₋₄ alifatski), pri čemu je svaka od gore navedenih C₁₋₄ alifatskih skupina nesupstituirana.

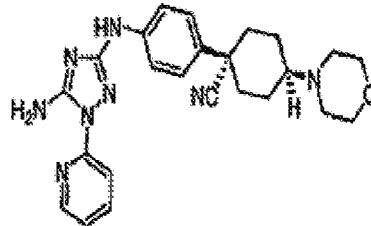
2. Spoj prema zahtjevu 1, koji ima formulu (I-b) ili (I-c):



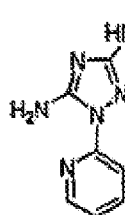
naznačen time, da je navedeni spoj odabran iz skupine koja se sastoji od:



I-1

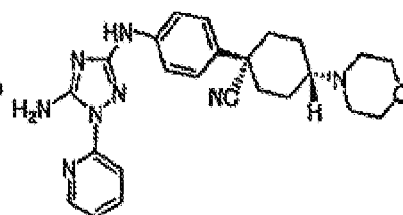


I-2



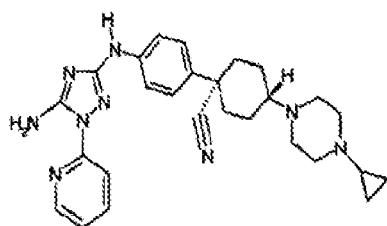
I-3

i

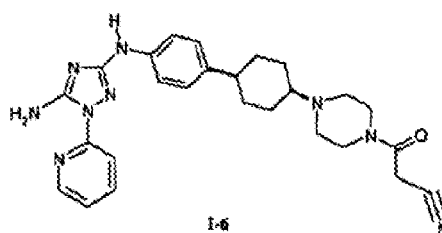


I-4.

5 3. Spoj prema zahtjevu 1, naznačen time, da je navedeni spoj odabran iz skupine koja se sastoji od:



I-5



I-6

skleroza, i multipla skleroza, neurodegenerativni poremećaji kao što je obiteljska amiotrofična lateralna skleroza (FALS), kao i u krutom i hematološkom malignom tkivu kao što su leukemije i limfomi;

pri čemu karcinom je karcinom pankreasa, prostate, ili jajnika.

- 5 11. Upotreba spoja prema bilo kojem od zahtjeva 1-3, ili sastojak prema bilo kojem od zahtjeva 4-5, **naznačena time**, da je za proizvodnju lijeka za liječenje ili ublažavanje težine bolesti odabranih iz alergijskih bolesti, proliferativnih bolesti, autoimunih oboljenja, bolesti povezanih s transplantacijom organa, upalnih oboljenja, imunološki povezanih oboljenja ili destruktivnih bolesti kostiju;
karcinoma, Alzheimerove bolesti, restenoze, angiogeneze, glomerulonefritisa, citomegalovirusa, HIV-a, herpesa, psorijaze, ateroskleroze, alopecije, autoimunog oboljenja, virusne infekcije, neurodegenerativnog poremećaja,
10 poremećaja povezanog s apoptozom timocita, ili proliferativnog poremećaja; hematološkog poremećaja, poglavito, akutne mijelogene leukemije (AML), akutne promijelocitne leukemija (APL), i akutne limfocitne leukemije (ALL);
Imunoloških odgovora kao što je alergija ili tip I hipersenzitivnih reakcija, astma, autoimune bolesti kao što su odbacivanje transplantata, reakcija transplantata protiv primatelja, reumatoidni artritis, amiotrofična lateralna skleroza, i multipla skleroza, neurodegenerativni poremećaji kao što je obiteljska amiotrofična lateralna skleroza
15 (FALS), kao i u krutom i hematološkom malignom tkivu kao što su leukemije i limfomi;
karcinoma pankreasa, prostate, ili jajnika.