



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20240907 T1

HR P20240907 T1

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

(51) MKP:

A61K 47/54 (2017.01)
C07K 14/705 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 25.10.2024.

(21) Broj predmeta: P20240907T

(22) Datum podnošenja : 26.04.2019.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2019029393
Datum podnošenja međunarodne prijave: 26.04.2019.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 19794009.1
Datum podnošenja europske prijave patenta: 26.04.2019.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2019210200
Datum međunarodne objave: 31.10.2019.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3784269 A1
Datum objave europske prijave patenta: 03.03.2021.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3784269 B1
Datum objave europskog patenta: 05.06.2024.

(31) Broj prve prijave: 201862663763 P (32) Datum podnošenja prve prijave: 27.04.2018. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US
201962790372 P 09.01.2019. US

(73) Nositelj patenta:

**Arrowhead Pharmaceuticals, Inc., 177 E. Colorado Boulevard, Suite 700,
Pasadena, CA 91105, US**

(72) Izumitelji:

Zhen Li, 6 Hawthorn Drive, Westfield, NJ 07090, US
**Jeffrey Carlson, Arrowhead Pharmaceuticals, Inc. 502 S. Rosa Road,
Madison, WI 53719, US**
**Anthony Nicholas, Arrowhead Pharmaceuticals, Inc., 502 S. Rosa Road,
Madison, WI 53719, US**
**Xiaokai Li, Arrowhead Pharmaceuticals, Inc., 502 S. Rosa Road,
Madison, WI 53719, US**
**Dongxu Shu, Arrowhead Pharmaceuticals, Inc., 502 S. Rosa Road,
Madison, WI 53719, US**
**Matthew Fowler-Watters, Arrowhead Pharmaceuticals, Inc., 502 S. Rosa
Road, Madison, WI 53719, US**

(74) Zastupnik:

Vukmir i suradnici odvjetničko društvo d.o.o., 10000 Zagreb, HR

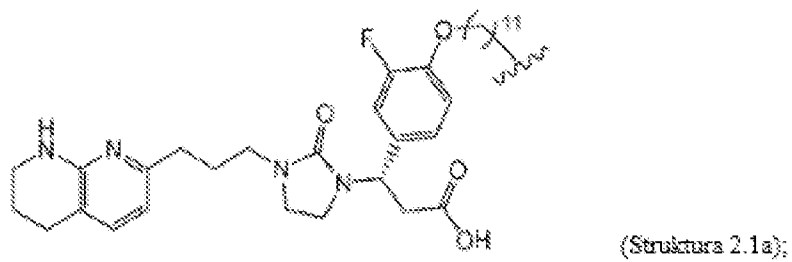
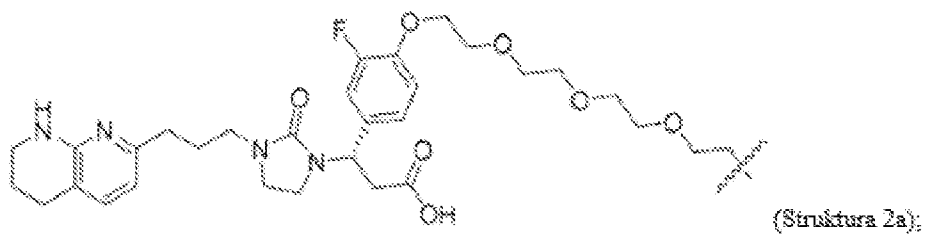
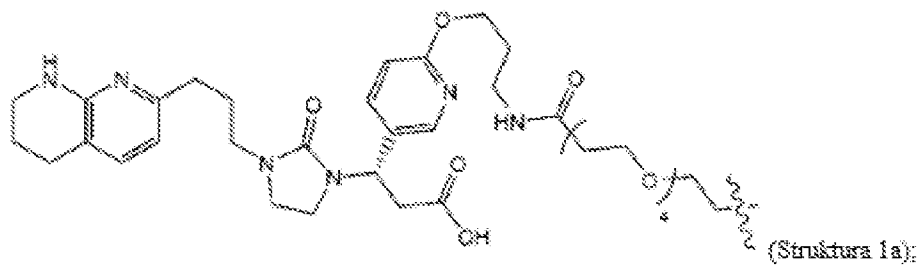
(54) Naziv izuma:

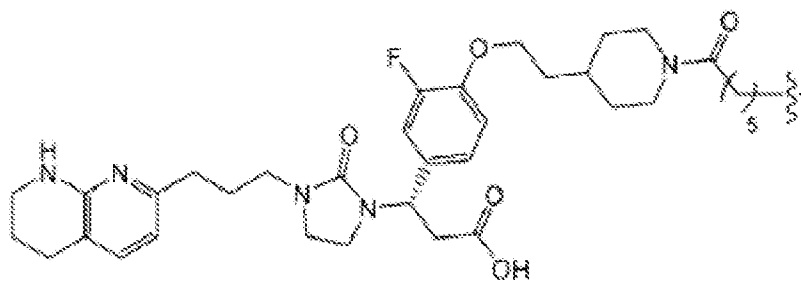
LIGANDI ZA CILJANJE INTEGRINA I NJIHOVA PRIMJENA

HR P20240907 T1

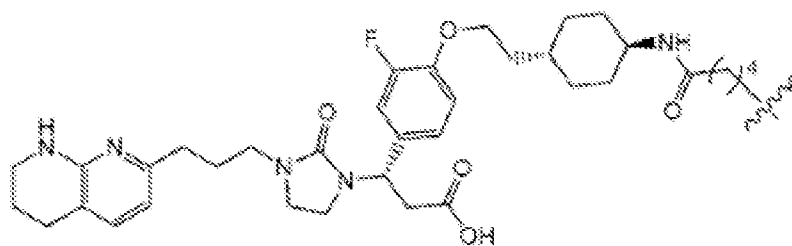
PATENTNI ZAHTJEVI

1. Ligand za ciljanje integrina koji sadrži formulu odabranu iz:

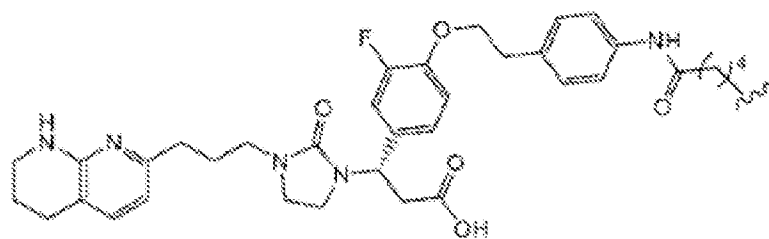




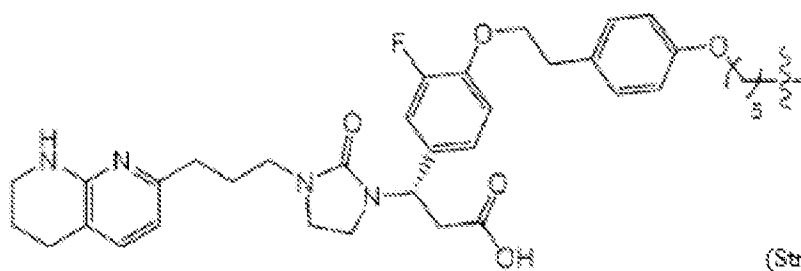
(Struktura 2.2a);



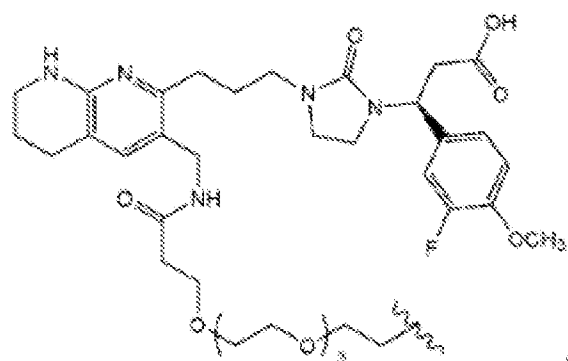
(Struktura 2.3a):



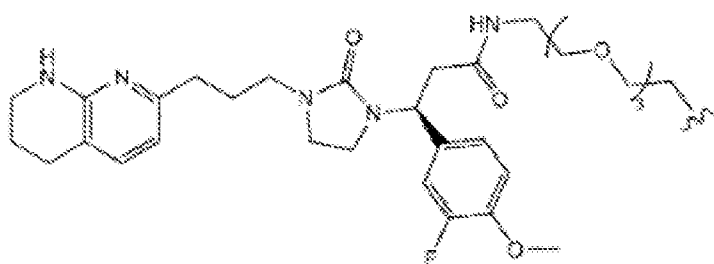
(Struktura 2.4a):



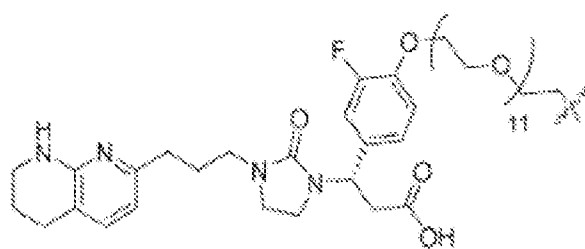
(Struktur 2.5a):



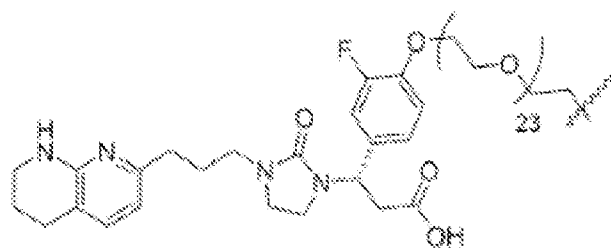
(Struktura 2.6a);



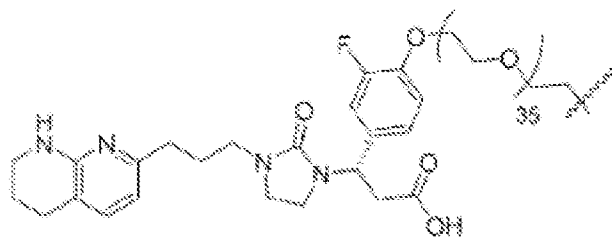
(Struktura 2.7a);



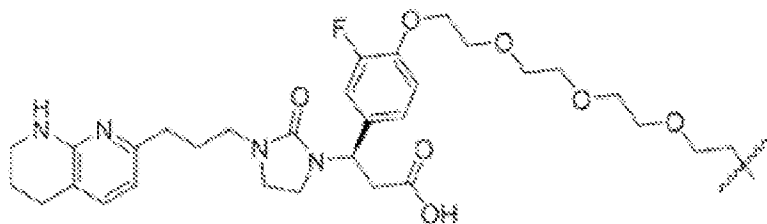
(Struktura 2.8a);



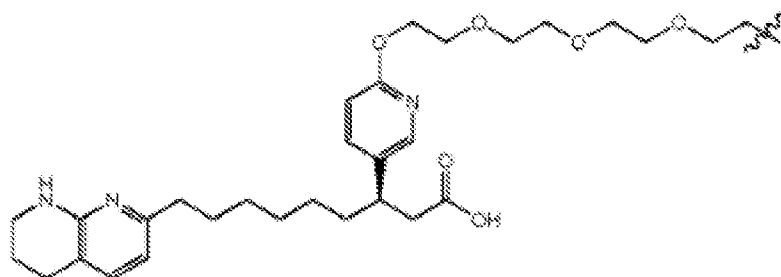
(Struktura 2.9a);



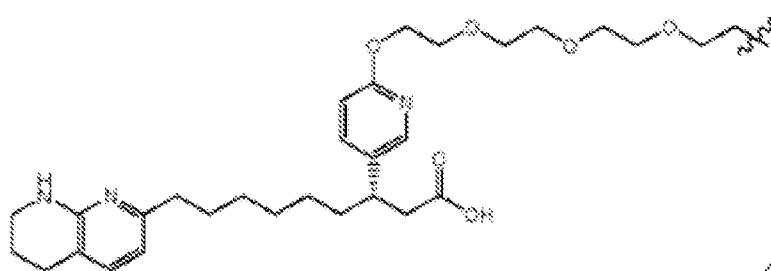
(Structure 2.10a);



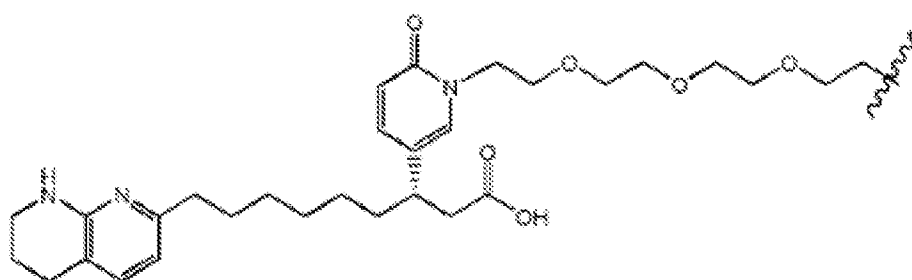
(Struktura 2.11a);



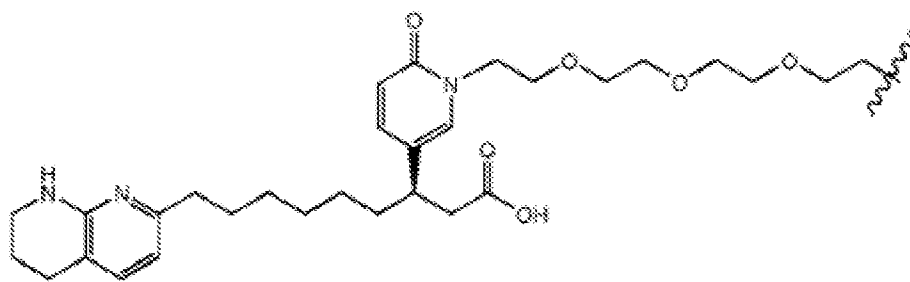
(Struktur 28a);



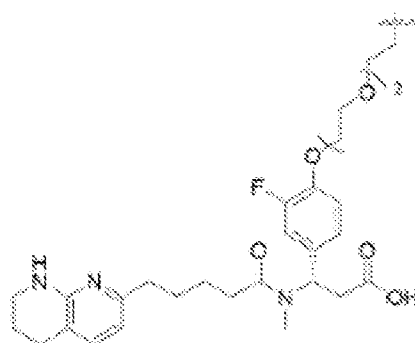
«Struktura 29a»;



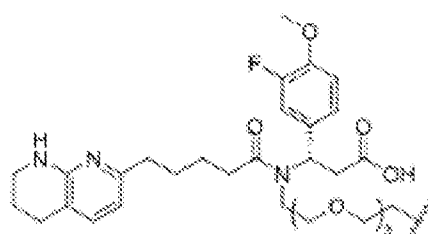
(Struktur 30a):



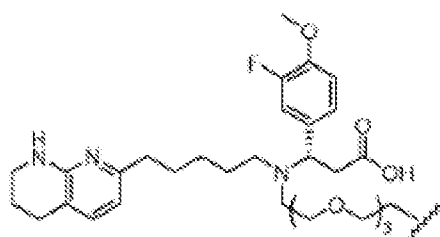
(Struktura 31a);



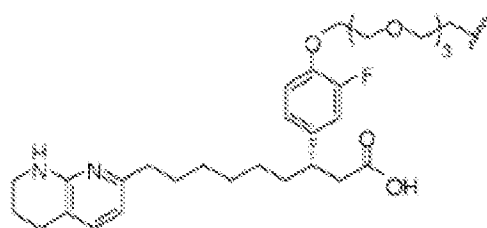
(Struktura 32a);



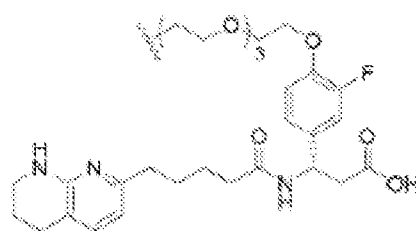
(Struktura 33a);



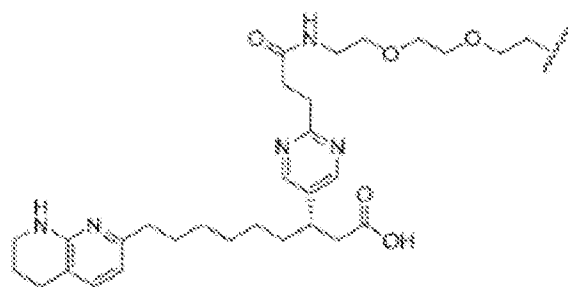
(Struktura 34a);



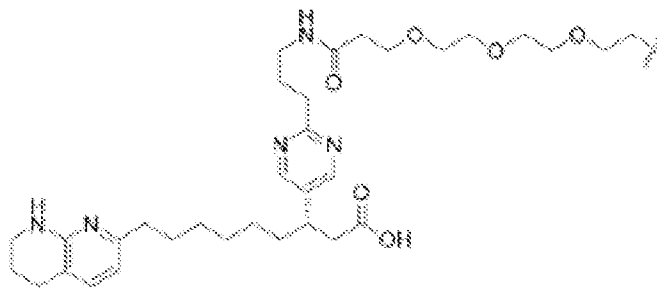
(Struktura 36a);



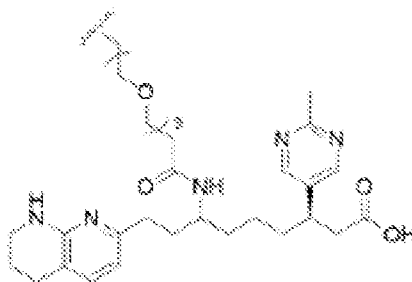
(Struktura 37a);



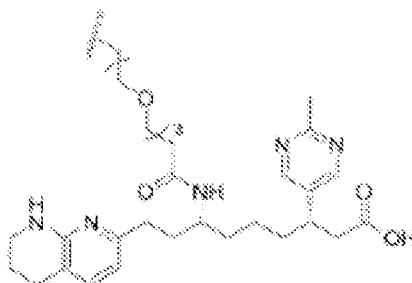
(Struktura 38a);



(Struktura 39a);



(Struktura 40a); i



(Struktura 41a);

ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, pri čemu  označava točku povezivanja sa spojem na bazi oligonukleotida.

2. Ligand za ciljanje integrina prema zahtjevu 1, pri čemu je ligand za ciljanje integrina konjugiran sa sredstvom RNKi.
3. Ligand za ciljanje integrina prema zahtjevu 1 ili zahtjevu 2, pri čemu ligand za ciljanje integrina nadalje sadrži
- 5 povezivač polietilen glikola koji ima 2 – 20 jedinica etilen-oksida.
4. Pripravak koji sadrži integrinski ligand prema bilo kojem od zahtjeva 1 – 3 i farmaceutski prihvatljivu pomoćnu tvar.
5. Pripravak prema zahtjevu 4, pri čemu je ligand za ciljanje integrina konjugiran sa spojem na bazi oligonukleotida koji je barem djelomično komplementaran kodirajućoj sekvenci ciljnog gena u stanici koja eksprimira integrin.
6. Pripravak prema zahtjevu 4 ili zahtjevu 5, pri čemu je spoj na bazi oligonukleotida sredstvo RNKi.
- 10 7. Pripravak prema bilo kojem od zahtjeva 4 do 6, pri čemu je integrin $\alpha\text{v}\beta 3$ ili $\alpha\text{v}\beta 5$ ili istovremeno $\alpha\text{v}\beta 3$ i $\alpha\text{v}\beta 5$.
8. Primjena (i) pripravka koji sadrži ligand za ciljanje integrina prema bilo kojem od zahtjeva 1 – 3 ili (ii) pripravka prema bilo kojem od zahtjeva 4 – 7 za isporuku spoja na bazi oligonukleotida u stanicu koja eksprimira integrin $\alpha\text{v}\beta 3$ ili $\alpha\text{v}\beta 5$ ili istovremeno $\alpha\text{v}\beta 3$ i $\alpha\text{v}\beta 5$ *in vitro*.
9. Primjena prema zahtjevu 8, pri čemu je spoj na bazi oligonukleotida sredstvo RNKi.
- 15 10. Pripravak koji sadrži ligand za ciljanje integrina prema bilo kojem od zahtjeva 1 – 3 ili pripravak prema bilo kojem od zahtjeva 4 – 7 za primjenu kao lijek za isporuku spoja na bazi oligonukleotida u stanicu ili tkivo ispitanika *in vivo*.
11. Pripravak za primjenu prema zahtjevu 10, pri čemu je stanica bubrežna stanica.
12. Pripravak za primjenu kao lijek prema zahtjevu 10 ili zahtjevu 11, pri čemu je spoj na bazi oligonukleotida sredstvo RNKi.

13. Pripravak koji uključuje sredstvo RNKi konjugirano s ligandom za ciljanje integrina prema bilo kojem od zahtjeva 1 – 3 ili (ii) pripravak prema bilo kojem od zahtjeva 4 – 7 za primjenu u liječenju koje sadrži inhibiciju ekspresije ciljnog gena u stanici koji eksprimira integrin $\alpha v\beta 3$ ili integrin $\alpha v\beta 5$ ili oba integrina $\alpha v\beta 3$ i $\alpha v\beta 5$.
14. Pripravak za primjenu prema zahtjevu 13, pri čemu je ciljni gen EPAS1 (HIF2 alfa).
- 5 15. Pripravak za primjenu prema zahtjevu 13 ili zahtjevu 14, pri čemu je stanica tumorska stanica svjetlostaničnog karcinoma bubrežnih stanica.