



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20160531 T1

HR P20160531 T1

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

(51) MKP:

A61K 31/70 (2006.01)
C07H 19/00 (2006.01)
C07H 19/04 (2006.01)
C07H 21/00 (2006.01)
A61P 31/20 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 12.08.2016.

(21) Broj predmeta: P20160531T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 18.05.2016.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2006047617
Datum podnošenja međunarodne prijave: 13.12.2006.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 06848625.7
Datum podnošenja europske prijave patenta: 13.12.2006.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2007070598
Datum međunarodne objave: 21.06.2007.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 1968612 A2
Datum objave europske prijave patenta: 17.09.2008.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 1968612 B1
Datum objave europskog patenta: 09.03.2016.

(31) Broj prve prijave: 750036 P
800294 P
637520

(32) Datum podnošenja prve prijave: 13.12.2005.
15.05.2006.
12.12.2006.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US
US
US

(73) Nositelj patenta:

**Spring Bank Pharmaceuticals, Inc., 113 Cedar Street, Suite S-7, Milford,
MA 01757, US**

(72) Izumitelj:

Radhakrishnan P. Iyer, 15 Quail Hollow Drive, Shrewsbury, MA 01545, US
**Seetharamaiyer Padmanabhan, 67 Fottler Avenue, Lexington, MA 02420,
US**

(74) Zastupnik:

ZMP IP d.o.o., 10000 Zagreb, HR

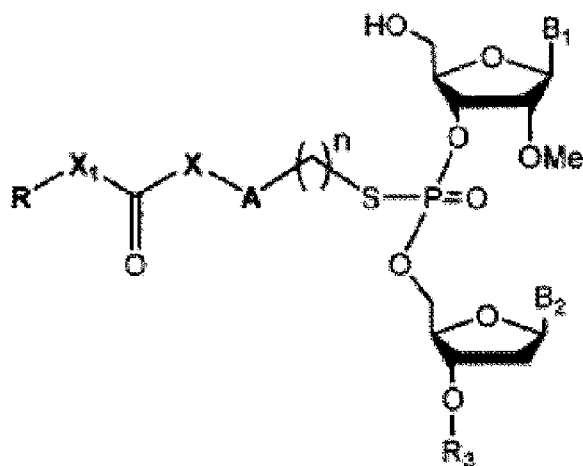
(54) Naziv izuma:

DINUKLEOTIDNI PROLIJEKOVI

HR P20160531 T1

PATENTNI ZAHITJEVI

- 5 1. Pronukleotid predstavljen formulom (III):



(III)

ili njegovi racemati, enantiomeri, diastereomeri, geometrijski izomeri, tautomeri,
u kojima

10 X je odsutan, O, NH, NR, S;

X₁ je odsutan, O, NH;

A je odsutan, aril, aralkil;

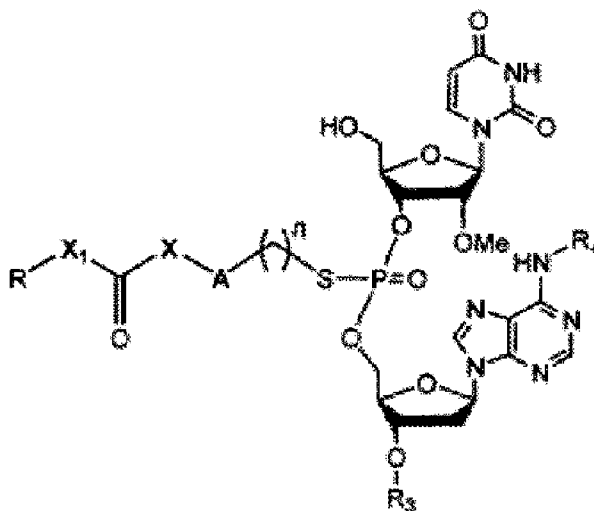
n je 0, 1, 2, 3, 4, 5;

R je alkil, supstituirani alkil, cikloalkil, aril, supstituirani aril, aralkil, heterociklik, O-alkil, O-heteroaril, steroidni;

15 R₃ je izabran od vodika, alkil, supstituirani alkil, C(O)-alkil, C(O)O-alkil, C(O)-aril, C(O)O-aril, C(O)NHalkil i C(O)NH-aril; i

B₁ i B₂ su nezavisno adenin, guanin, timin, citozin, uracil ili modificirane nukleobaze.

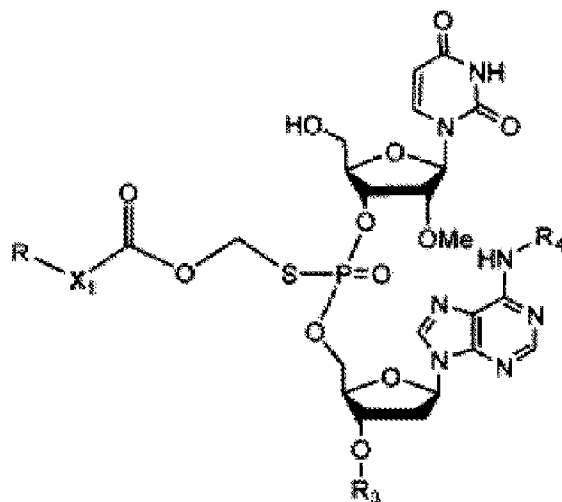
2. Pronukleotid prema patentnom zahtjevu 1, predstavljen formulom (IV):



(IV)

20 u kojem R₄ je izabran od vodika, C(O)-alkil, C(O)O-alkil, C(O)-aril, C(O)O-aril, C(O)NH-alkil i C(O)NH-aril; i R, R₃, X, X₁, A i n su kao što su prethodno definirani u patentnom zahtjevu 1.

3. Spoj prema patentnom zahtjevu 2 koji ima formulu A1, izabranu od spojeva 1-8 iz Tabele 1:



A1

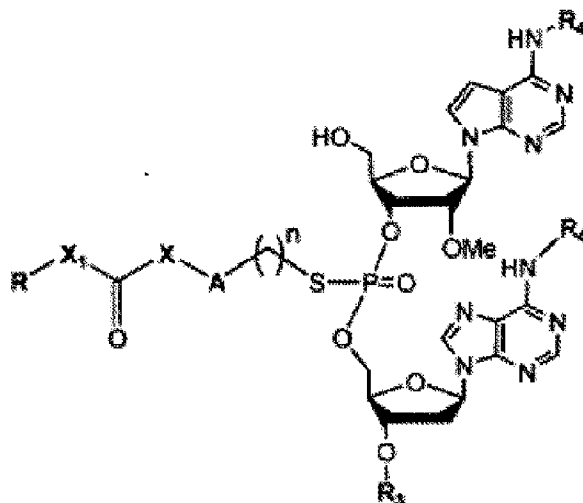
u kojima R, X₁, R₃ i R₄ su obilježeni za svaki primjer u Tabeli 1.

5

TABELA 1

Spoj br.	R	X ₁	R ₃	R ₄
1		odsutan	H	H
2		O	H	H
3		odsutan	H	H
4		O	H	H
5		O	C(O)PH	H
6		O	H	C(O)Ph
7		odsutan	H	H
8		O	H	H

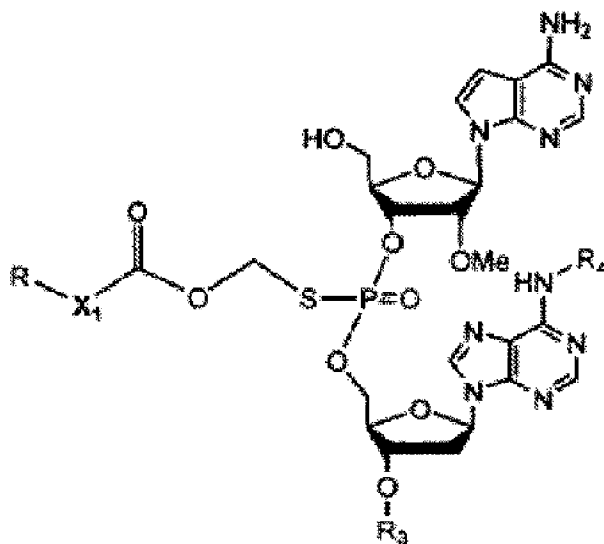
4. Pronukleotid prema patentnom zahtjevu 1, predstavljen formulom (V):



(V)

u kojem R₄ je izabran od vodika, C(O)-alkil, C(O)O-alkil, C(O)-aril, C(O)O-aril, C(O)NH-alkil i C(O)NH-aril; i R, R₃, X, X₁, A i n su kao što su prethodno definirani u patentnom zahtjevu 1.

5. Spoj prema patentnom zahtjevu 4 koji ima formulu B₁, izabran od spojeva 9-16 iz Tabele 2:

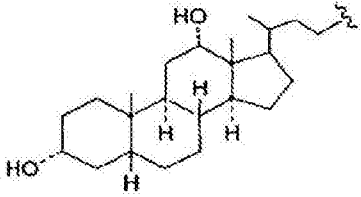
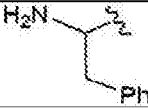
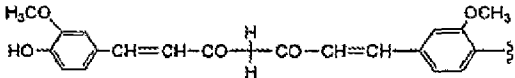
**B₁**

5

u kojima R, X₁, R₃ i R₄ su označeni za svaki primjer u Tabeli 2.

TABELA 2

Spoj br.	R	X ₁	R ₃	R ₄
9		odsutan	H	H
10		O	H	H

Spoj br.	R	X ₁	R ₃	R ₄
11		odsutan	H	H
12		O	H	H
13		O	C(O)PH	H
14		O	H	C(O)PH
15		odsutan	H	H
16		O	H	H

6. Farmaceutska kompozicija koja sadrži terapijski efikasnu količinu spoja prema patentnim zahtjevima 1 do 5 u kombinaciji sa farmaceutski prihvatljivim nosačem ili ekscipijensom.
7. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 5 za uporabu u liječenju HBV.
- 5 8. Spoj za uporabu prema patentnom zahtjevu 7 **naznačen time** što se spoj primjenjuje u kombinaciji sa drugim agensima.
9. Spoj za uporabu prema patentnom zahtjevu 7 ili patentnom zahtjevu 8 **naznačen time** što je za uporabu u liječenju rezistentnih vrsta HBV.