



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20210896 T1

HR P20210896 T1

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

(51) MKP:

C07D 405/14 (2006.01)
C07D 413/14 (2006.01)
A61K 31/496 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01)
C07D 405/12 (2006.01)
C07D 413/12 (2006.01)
C07D 417/12 (2006.01)
C07D 417/14 (2006.01)
C07D 261/18 (2006.01)
C07D 263/48 (2006.01)
C07D 307/52 (2006.01)
C07D 307/68 (2006.01)
A61P 27/02 (2006.01)
A61P 25/28 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 20.08.2021.

(21) Broj predmeta: P20210896T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 07.06.2021.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/GB2016053199
Datum podnošenja međunarodne prijave: 14.10.2016.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 16784265.7
Datum podnošenja europske prijave patenta: 14.10.2016.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2017064512
Datum međunarodne objave: 20.04.2017.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3362444 A1
Datum objave europske prijave patenta: 22.08.2018.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3362444 B1
Datum objave europskog patenta: 10.03.2021.

(31) Broj prve prijave: 201518365

(32) Datum podnošenja prve prijave: 16.10.2015.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: GB

(73) Nositelj patenta:

Exonate Limited, WTL, Moorfield Road Duxford, CB22 4PS Cambridge, GB

(72) Izumitelji:

David Bates, Cancer Biology Division of Cancer and Stem Cells School of Medicine University of Nottingham, Queen's Medical Centre, NG7 2UH Nottingham Nottinghamshire, GB

Jonathan Morris, Department of Chemistry University of New South Wales, 2052 Sydney, New South Wales, AU

Hamish Toop, 50A Barnes Ave, SA 5033 Marlestone, AU

Jennifer Batson, c/o Exonate West Block C Floor Queen's Medical Centre University of Nottingham, NG7 2UH Nottingham Nottinghamshire, GB

Andrew David Morley, 2 Kensington Squar, SK10 3GE Macclesfield Cheshire, GB

(74) Zastupnik:

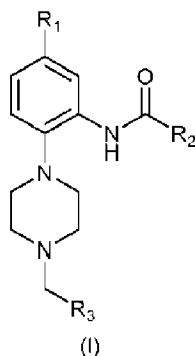
PRODUCTA d.o.o., 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma: **SPOJEVI**

HR P20210896 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

1. Spoj s formulom (I):



ili farmaceutski prihvatljiva sol, solvat ili hidrat naznačen time što:

R₁ je CF₃, metil, CHF₂, Cl, ili ciklopropil; i ili

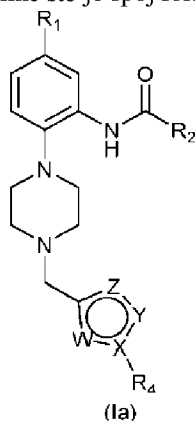
R₂ je metil, 5- ili 6-eročlani aromatski heterocikl, fenil, ili kondenzirani aromatski heterocikl, od kojih svaki može po izboru imati jedan ili više supstituenata; i

R₃ je 5-eročlani aromatski heterocikl koji po izboru može imati jedan ili više supstituenata; ili

R₂ je metil, 6-eročlani aromatski heterocikl, fenil ili kondenzirani aromatski heterocikl, od kojih svaki može po izboru imati jedan ili više supstituenata; i

R₃ je kondenzirani aromatski heterocikl, koji po izboru može imati jedan ili više supstituenata.

2. Spoj prema patentnom zahtjevu 1, naznačen time što je spoj formule (Ia):



ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, solvat ili hidrat; naznačen time što:

R₁ je CF₃, metil, CHF₂, Cl, ili ciklopropil;

R₂ je metil, 5- ili 6-eročlani aromatski heterocikl ili kondenzirani aromatski heterocikl, od kojih svaki može po izboru imati jedan ili više supstituenata;

R₄ je vodik, ili C₁₋₆ alkilna skupina koja može po izboru imati jedan ili više supstituenata;

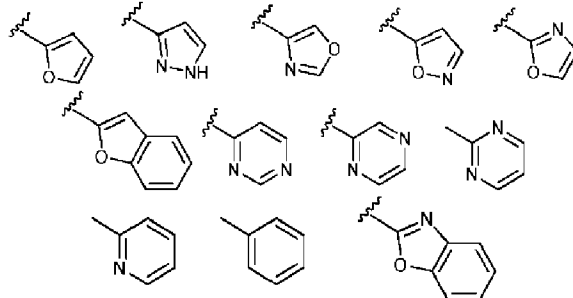
W je CH, O, N ili S;

X je C ili N;

Y je CH, O, N ili S; i

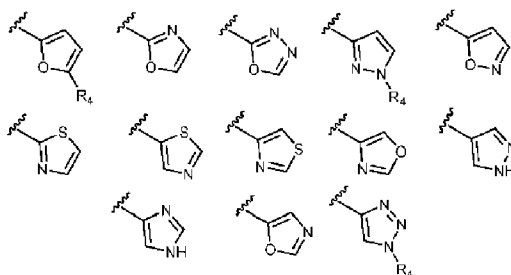
Z je CH, N ili S.

3. Spoj prema patentnom zahtjevu 2, naznačen time što je R₂ odabran iz skupine koja sadrži:



od kojih svaki može po izboru imati jedan ili više supstituenata, na primjer pri čemu R₂ je skupina furan-2-il sa tetrahidropiraniil supstituentom ili piridinil supstituentom.

4. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 2 ili 3, naznačen time što su W, X, Y i Z odabrani tako da je 5-eročlani aromatski heterocikl odabran iz skupine koja sadrži:



5. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 2 do 4, naznačen time što R_4 je vodik ili metilna skupina, koja može imati supstituent, na primjer gdje je R_4 je metilna skupina supstituirana s fenilom ili 5- ili 6-eročlanim aromatskim heterociklom.
6. Spoj prema patentnom zahtjevu 1, naznačen time što:
 R_1 je CF_3 , metil, CHF_2 , Cl, ili ciklopropil;
 R_2 je metil, 6-eročlani aromatski heterocikl, fenil, ili kondenzirani aromatski heterocikl, od kojih svaki može po izboru imati jedan ili više supstituenata; i
 R_3 je indolil skupina, izoindolil skupina, benzoksazolil skupina, benzimidazolil skupina, kumarinil skupina, kinolil skupina ili izokinolil skupina.
7. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1, 2, ili 4 to 6, naznačen time što R_2 je indolil skupina, izoindolil skupina, benzoksazolil skupina, benzimidazolil skupina, kumarinil skupina, kinolil skupina ili izokinolil skupina.
8. Farmaceutski pripravak naznačen time što sadrži spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 7, po izboru jedan ili više drugih aktivnih sastojaka i farmaceutski prihvatljiv nosač, po izboru u obliku pogodnom za intraokularnu injekciju ili u obliku pogodnom za topikalnu primjenu u oko.
9. Spoj s formulom (I) kako je definiran u bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 7, naznačen time što je za upotrebu kao lijek.
10. Spoj s formulom (I) kako je definiran u bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 7, naznačen time što je za upotrebu u liječenju ili prevenciji očne neovaskularizacije, na primjer pri čemu liječenje ili prevencija očne neovaskularizacije obuhvaća liječenje ili prevenciju starosne makularne degeneracije ili dijabetičke retinopatije.
11. Spoj s formulom (I) kako je definiran u bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 7, naznačen time što je za upotrebu u liječenju raka kod sisavaca.
12. Spoj s formulom (I) kako je definiran u bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 7, naznačen time što je za upotrebu u liječenju ili prevenciji poremećaja mikrovaskularne hiperpermeabilnosti, ili za regulaciju proangiogenih svojstava pro-propusnosti $VEGF_{xxx}$ izoformi, ili potporu preživljavanja epitelnih stanica bez povećane propusnosti, ili za smanjenje prirode (na primjer gustoće broja i/ili veličine) fenestracija membrana epitelne filtracije, pri čemu je upotreba odabrana iz liječenja ili prevencije jednog ili više od edema, sindroma respiratornih bolesti odraslih, proteinurije, uremije, mikroalbuminurije, hipoalbuminemije, hiperfiltracije bubrega, nefrotskog sindroma, zatajenja bubrega, bubrežnih bolesti povezanih s proliferacijom glomerularnih ili mezangijskih stanica, dijabetičke nefropatije, glomerulonefritisa, i policistične bolesti bubrega.
13. Spoj s formulom (I) kako je definiran u bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 7, naznačen time što je za upotrebu u liječenju ili prevenciji neuropatskih i neurodegenerativnih poremećaja ili za upotrebu kao neuroprotektivno ili neuroregenerativno sredstvo *in vivo*.
14. Spoj s formulom (I) kako je definiran u bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 7, naznačen time što je za upotrebu u liječenju ili prevenciji ne-upalne boli posredovane s VEGFR2.
15. Spoj s formulom (I) kako je definiran u bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 7, naznačen time što je za upotrebu za liječenje ili prevenciju fibroze kod subjekta sisavca, na primjer za sprečavanje idiopatske plućne fibroze, kod subjekta sisavaca.