



(19) REPUBLIKA HRVATSKA  
DRŽAVNI ZAVOD ZA  
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO



(10) Identifikator  
dokumenta:

**HR P20110732 T1**

HR P20110732 T1

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

(51) MKP:

**C07F 9/141** (2006.01)  
**C07D 207/08** (2006.01)  
**A61K 31/662** (2006.01)  
**A61P 31/12** (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 30.11.2011.

(21) Broj predmeta: P20110732T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 11.10.2011.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2005025503  
Datum podnošenja međunarodne prijave: 18.07.2005.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 05791144.8  
Datum podnošenja europske prijave patenta: 18.07.2005.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2006020276  
Datum međunarodne objave: 23.02.2006.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 1778702 A2  
Datum objave europske prijave patenta: 02.05.2007.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 1778702 B1  
Datum objave europskog patenta: 13.07.2011.

(31) Broj prve prijave: 588633 P  
591635 P

(32) Datum podnošenja prve prijave: 16.07.2004.  
27.07.2004.

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

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelji:

**GILEAD SCIENCES, INC., 333 Lakeside Drive, Foster City, 94404 CA, US**  
**Kleem Chaudhary, 25410 Soutwick Drive No.109, Hayward, 94544 CA, US**  
**Melissa Fleury, 615 Port Drive, Apt. 202, San Mateo, 94404 CA, US**  
**Choung U. Kim, 1750 Elizabeth Street, San Carlos, 94070 CA, US**  
**Darren J. McMurtrie, 1600 3rd Avenue, Apt. 2508, San Mateo, 94401 CA, US**  
**Xiaoning C. Sheng, 736 Bounty Drive, 3611, Foster City, 94404 CA, US**

(74) Zastupnik:

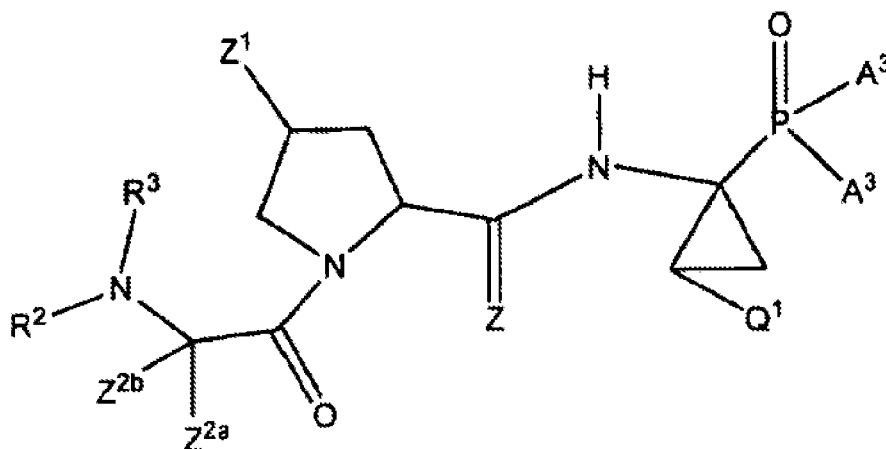
odvjetnik Damir Mijatović, 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma: **ANTIVIRUSNI SPOJEVI**

HR P20110732 T1

## PATENTNI ZAHTJEVI

## 5 1. Spoj formule I:



I

ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, enantiomer ili solvat, **naznačeni time** što

R<sup>1</sup> je nezavisno izabran iz grupe koju čine H, alkil, alkenil, alkinil, aril, cikloalkil, heterociklus, halogen, haloalkil, alkilsulfonamido, arilsulfonamido, -C(O)NHS(O)<sub>2</sub>- ili -S(O)<sub>2</sub>-, izborno supstituiran sa jednim ili više A<sup>3</sup>;

R<sup>2</sup> je -C(Y<sup>1</sup>)(A<sup>3</sup>),

R<sup>3</sup> je H ili (C1-6)alkil;

Y<sup>1</sup> je nezavisno O, S, N(A<sup>3</sup>);

Z je O;

Z<sup>1</sup> je -Y<sup>1</sup>-A<sup>3</sup>;

Z<sup>2a</sup> je H, (C1-10)alkil, (C2-10)alkenil ili (C2-10)alkinil ili Z<sup>2a</sup> izborno formira prsten sa Q<sup>1</sup>;

Z<sup>2b</sup> je H, (C1-6)alkil, (C2-8)alkenil ili (C2-8)alkinil;

Q<sup>1</sup> je (C1-8)alkil, (C2-8)alkenil ili (C2-8)alkinil;

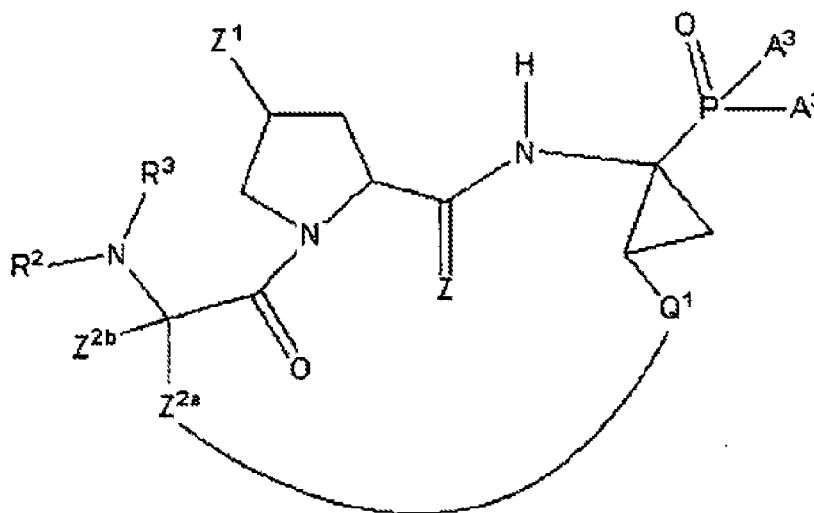
A<sup>3</sup> je nezavisno izabran iz grupe koju čine -OH, -C(O)OH, alkil, alkenil, alkinil, amino, amido, imido, imino, halogen, CF<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, cikloalkil, nitro, aril, aralkil, alkoksi, ariloksi, heterociklus, heteroaril, -C(A<sup>2</sup>)<sub>3</sub>, -C(A<sup>2</sup>)<sub>2</sub>-C(O)A<sup>2</sup>, -C(O)A<sup>2</sup>, -C(O)OA<sup>2</sup>, -O(A<sup>2</sup>), -N(A<sup>2</sup>)<sub>2</sub>, -S(A<sup>2</sup>), -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-heterociklus, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>C(O)Oalkil, -O-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-O-C(O)-Oalkil, -O-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-O-C(O)-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-alkil, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>O-C(O)-O-alkil, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>O-C(O)-O-cikloalkil, -N(H)C(Me)C(O)O-alkil ili alkoksi arilsulfonamid, pri čemu svako A<sup>3</sup> može biti izborno supstituiran sa 1 do 4 -R<sup>1</sup>, halogen, alkil, alkenil, alkinil, aril, carbocycle, heterociklus, aralkil, aril sulfonamid, aril alkilsulfonamid, ariloksi sulfonamid, ariloksi alkilsulfonamid, ariloksi arilsulfonamid, alkil sulfonamid, alkiloksi sulfonamid, alkiloksi alkilsulfonamid, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>heterociklus, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-C(O)O-alkil, -O(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>OC(O)Oalkil, -O-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-O-C(O)-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-alkil, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-O-C(O)-O-alkil, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-O-C(O)-O-cikloalkil, -N(H)C(CH<sub>3</sub>)C(O)O-alkil ili alkoksi arilsulfonamid grupe, izborno supstituirane sa R<sup>1</sup>;

A<sup>2</sup> je nezavisno izabran iz grupe koju čine H, alkil, alkenil, alkinil, amino, aminokiselina, alkoksi, ariloksi, cijano, haloalkil, cikloalkil, aril, heteroaril, alkilsulfonamid ili arilsulfonamid; i

m je 0 do 6,

pri čemu, ako nije drugačije naznačeno, alkil je (C<sub>1-18</sub>)alkil; alkenil je (C<sub>2-18</sub>)alkenil; alkinil je (C<sub>2-18</sub>)alkinil; cikloalkil je (C<sub>3-7</sub>)cikloalkil; aril je (C<sub>6-20</sub>)aril; aralkil je (C<sub>6-20</sub>)aralkil; alkoksi je (C<sub>1-18</sub>)alkoksi; karbociklus je zasićeni, nezasićeni ili aromatični (C<sub>3-7</sub>)monociklus, (C<sub>7-12</sub>)biciklus ili policiklus sa do 20 atoma ugljika; heterociklus je karbociklus kao što je prethodno definirano, u kojem su 1, 2, 3 ili 4 atoma ugljika zamijenjeni sa O, N ili S.

## 2. Spoj prema patentnom zahtjevu 1 koji ima formulu XI:



XI

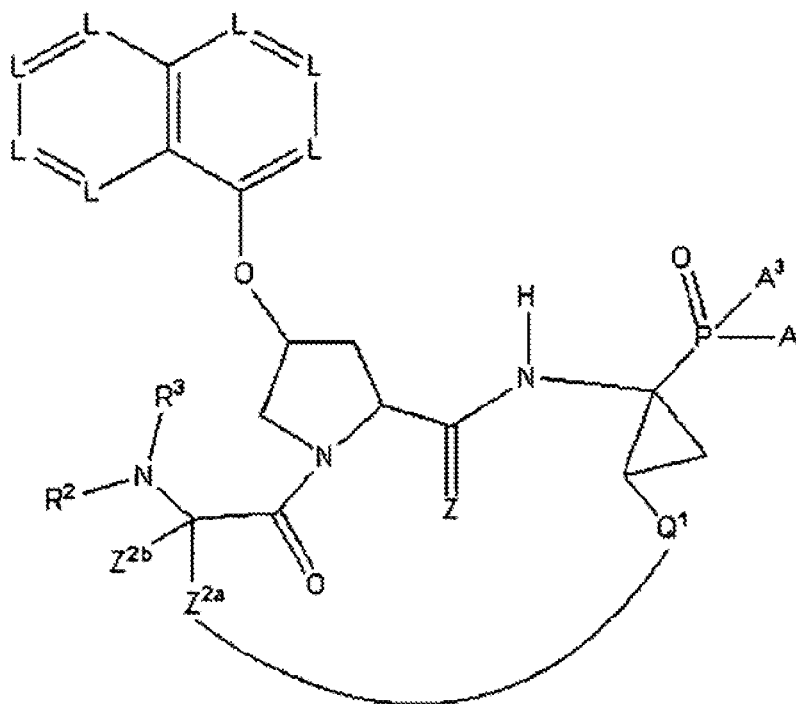
ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, enantiomer ili solvat,

**naznačeni time** što:

svako  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $Z$ ,  $Z^1$ ,  $Z^{2b}$ ,  $m$ ,  $A^3$ , i  $A^2$  su kao što su definirani u patentnom zahtjevu 1; i  $Z^{2a}$  formira prsten sa  $Q^1$ .

5

3. Spoj prema patentnom zahtjevu 2, **naznačen time** što je  $Z^1$  jednako  $O-A^3$ .
4. Spoj patentnom zahtjevu 2 koji ima formulu XXVI:



XXVI

ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, enantiomer ili solvat,

**naznačeni time** što:

svako  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $Z$ ,  $Z^{2a}$ ,  $Z^{2b}$ ,  $Q^1$ ,  $m$ ,  $A^3$ , i  $A^2$  su kao što su definirani u patentnom zahtjevu 2; i

$L$  je nezavisno izabran iz grupe koju čine C ili N, uz uvjet da nema više od tri uzastopna N, pri čemu je svaki izborno supstituiran sa jednim ili više  $A^3$ .

10

5. Farmaceutska kompozicija koja sadrži spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 4, **naznačena time** što sadrži i najmanje jedan farmaceutski prihvatljiv nosač.

15

6. Farmaceutska kompozicija prema patentnom zahtjevu 5, **naznačena time** što se koristi za primjenu u liječenju poremećaja povezanih sa HCV-om.
7. Farmaceutska kompozicija prema patentnom zahtjevu 5 ili 6, **naznačena time** što dodatno sadrži nukleozidni analog.
- 5 8. Farmaceutska kompozicija prema patentnom zahtjevu 5 ili 6, **naznačena time** što dodatno sadrži interferon ili pegilirani interferon.
9. Farmaceutska kompozicija prema patentnom zahtjevu 7, **naznačena time** što je navedeni nukleozidni analog izabran iz grupe koju čine ribavirin, viremudin, levovirin, L-nukleozid i izatoribin i navedeni interferon je  $\alpha$ -interferon ili pegilirani interferon.
- 10 10. Uporaba spoja prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 4, **naznačena time** što se koristi za pripremu lijeka za liječenje hepatitisa C ili poremećaja povezanog sa hepatitisom C.
11. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 4, **naznačena time** što se koristi za primjenu u postupku za liječenje hepatitisa C ili poremećaja povezanog sa hepatitisom C.