



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20191298 T1



HR P20191298 T1

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

(51) MKP:

A61K 31/085 (2006.01)

C07C 255/54 (2006.01)

C07D 213/85 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 18.10.2019.

(21) Broj predmeta: P20191298T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 18.07.2019.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2014054375
Datum podnošenja međunarodne prijave: 05.09.2014.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 14842085.4
Datum podnošenja europske prijave patenta: 05.09.2014.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2015035223
Datum međunarodne objave: 12.03.2015.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3043784 A1
Datum objave europske prijave patenta: 20.07.2016.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3043784 B1
Datum objave europskog patenta: 15.05.2019.

(31) Broj prve prijave: 201361875674 P (32) Datum podnošenja prve prijave: 09.09.2013. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US
201461978421 P 11.04.2014. US

(73) Nositelj patenta:

Peloton Therapeutics, Inc., 2330 Inwood Road, Suite 226, Dallas, TX 75235-7323, US

(72) Izumitelji:

Darryl David Dixon, 2140 Medical District Drive, Apt. 4058, Dallas, TX 75235, US

Jonas Grina, 114 London Way, Coppell, TX 75019, US

John A. Josey, 1051 N. Windomere Ave., Dallas, TX 75208, US

James P. Rizzi, 7408 Sugar Maple Dr., Irving, TX 75063, US

Stephen T. Schlachter, 2017 Lauraette Drive, Dallas, TX 75208, US

Eli M. Wallace, 404 Arborcrest Drive, 7 Richardson, TX 75080, US

Bin Wang, 4115 Northaven Rd., Dallas, TX 75229, US

Paul Wehn, 4611 Travis St. Apt. 1406-B, Dallas, TX 75205, US

Rui Xu, 3433 Potomac Ave., Dallas, TX 75205, US

Hanbiao Yang, 417 Pecan Hollow Drive, Coppell, TX 75019, US

(74) Zastupnik:

CPZ - CENTAR ZA PATENTE d.o.o., 10000 Zagreb, HR

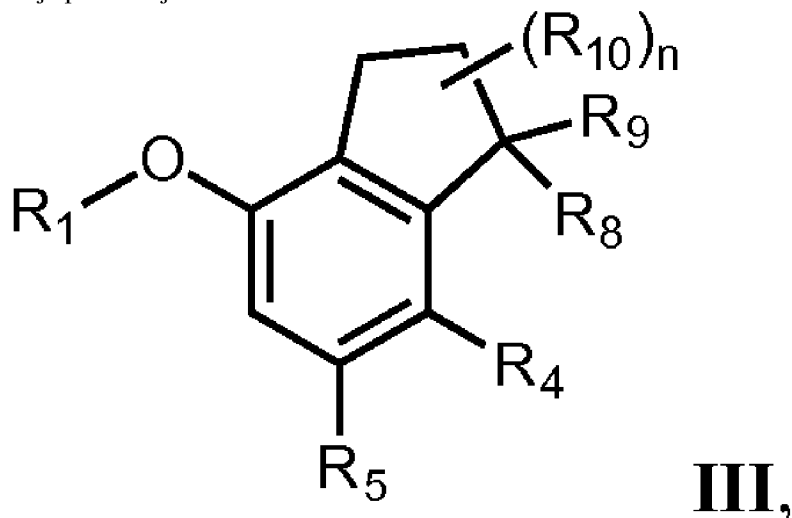
(54) Naziv izuma:

ARILETERI I NJIHOVE UPORABE

HR P20191298 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Spoj, **naznačen time, da** je predstavljen formulom III:



ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, gdje:

n je 1, 2, 3 ili 4;

R₁ je fenil ili piridil, pri čemu je navedeni fenil ili piridil supstituiran s najmanje jednim supstituentom odabranim iz skupine koja se sastoji od halogena, C₁-C₄-alkila, C₁-C₄-alkoksi i cijano;

R₄ je cijano, fluoroalkil, sulfonamid, sulfinil, sulfonil ili sulfoksiminil;

R₅ je vodik, halogen ili nesupstituirani alkil;

R₈ je vodik, hidroksi, nesupstituirani alkilamino, nesupstituirani alkoksi ili amino;

R₉ je vodik, nesupstituirani alkil, nesupstituirani alkenil ili nesupstituirani alkinil; ili R₈ i R₉ zajedno tvore okso ili oksim; i

svaki od R₁₀ je neovisno odabran iz skupine koja se sastoji od vodika, fluora, klora, hidroksi i nesupstituiranog alkila; ili

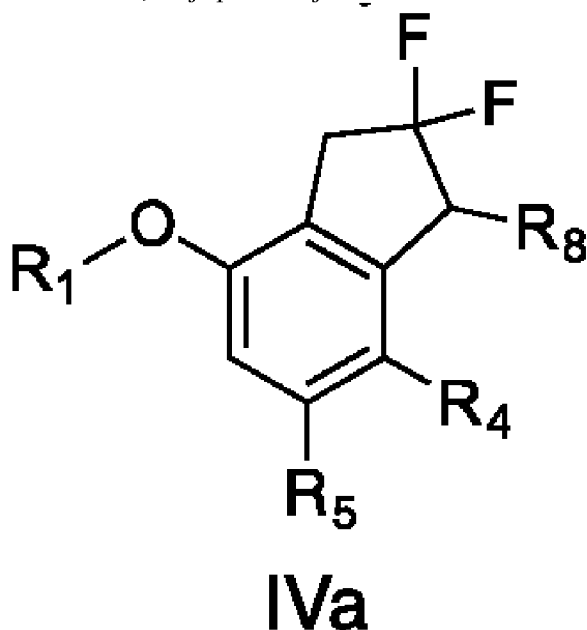
dva R₁₀ i ugljikov(i) atom(i) na koje su oni priključeni, tvore 3-člani do 8-člani nesupstituirani cikloalkila ili nesupstituirani heterocikloalkil.

2. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time, da** R₉ je vodik.

3. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time, da** R₁₀ je fluor i n je 1, 2 ili 3.

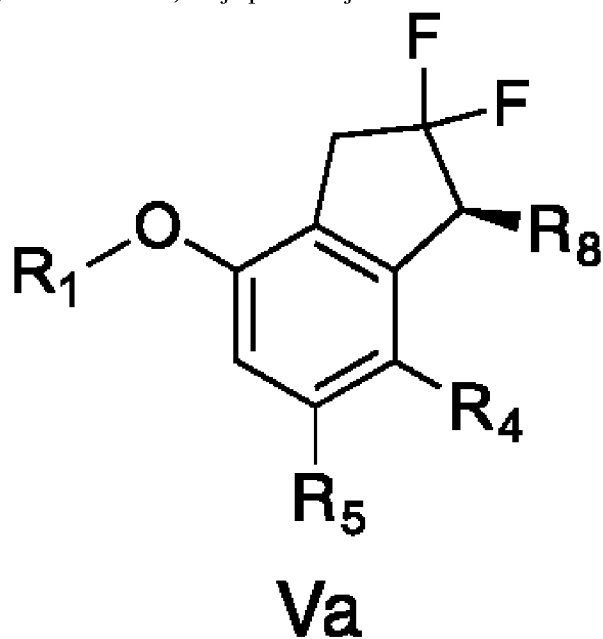
4. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time, da** R₄ je cijano, fluoroalkil, sulfinil, sulfonamid, sulfonil ili sulfoksiminil; R₅ je vodik; R₈ je hidroksi ili amino; i R₉ je vodik.

5. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time, da** je predstavljen formulom IVa:



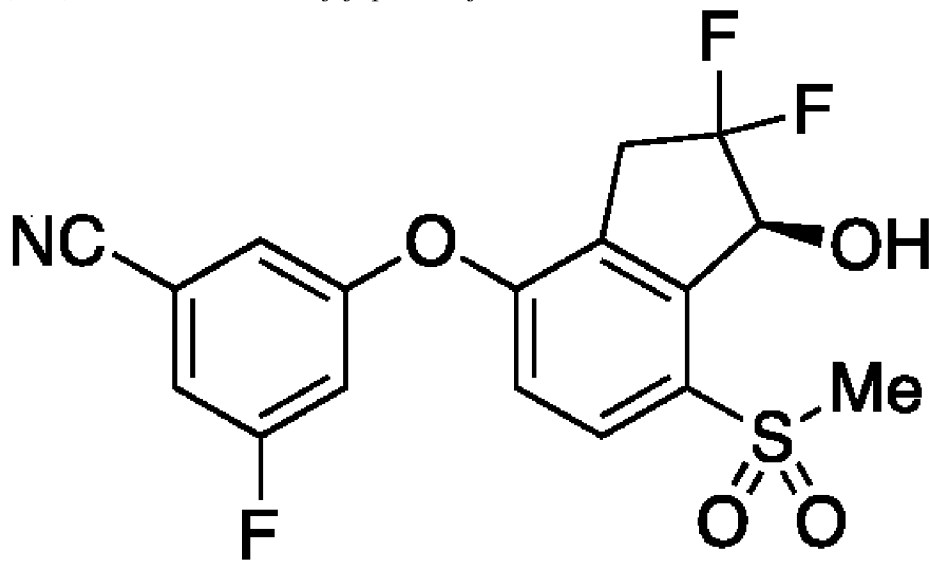
ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

6. Spoj prema zahtjevu 5, **naznačen time, da** je predstavljen formulom Va:



ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, gdje:

- 5 R_4 je cijano, fluoroalkil, sulfonamid, sulfinil, sulfonil ili sulfoksiminil; i
 R_8 je hidroksi, nesupstituirani alkilamino, nesupstituirani alkoksi ili amino.
7. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1, 5 ili 6, **naznačen time, da** R_8 je hidroksi ili amino.
8. Spoj prema zahtjevu 5 ili 6, **naznačen time, da** R_4 je cijano, fluoroalkil, sulfonamid, sulfinil, sulfonil ili sulfoksiminil; R_5 je vodik; i
- 10 R_8 je hidroksi ili amino.
9. Spoj prema zahtjevu 6, **naznačen time, da** enantiomerni višak navedenog spoja iznosi najmanje oko 80%.
10. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time, da** spoj je (S)-3-((2,2-difluoro-1-hidroksi-7-(me3tilsulfonil)-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)oksi)-5-fluorobenzonitril, koji je predstavljen formulom:



ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

- 15 11. Farmaceutski pripravak, **naznačen time, da** obuhvaća terapijski djelotvornu količinu spoja ili njegove farmaceutski prihvatljive soli u skladu s bilo kojim od zahtjeva 1 do 10 i farmaceutski prihvatljiv nosač.
12. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 10, **naznačen time, da** se upotrebljava kao lijek za liječenje bolesti von Hippel-Lindau (VHL-sindrom).
- 20 13. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 10, **naznačen time, da** se upotrebljava kao lijek za liječenje hemangioblastoma, feokromocitoma, neuroendokrinog tumora gušterače ili karcinoma bubrežnih stanica.

14. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 10, **naznačen time, da** se upotrebljava kao lijek za liječenje karcinoma bubrežnih stanica.
15. Spoj za uporabu prema zahtjevu 14, **naznačen time, da** se kod navedenog karcinoma bubrežnih stanica radi o karcinomu svijetlih stanica bubrežnih stanica.