



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20210871 T1



HR P20210871 T1

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

(51) MKP:

C07D 471/04 (2006.01)

A61P 35/00 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 09.07.2021.

(21) Broj predmeta: P20210871T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 01.06.2021.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/IB2017054655
Datum podnošenja međunarodne prijave: 31.07.2017.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 17752493.1
Datum podnošenja europske prijave patenta: 31.07.2017.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2018033815
Datum međunarodne objave: 22.02.2018.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3497103 A1
Datum objave europske prijave patenta: 19.06.2019.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3497103 B1
Datum objave europskog patenta: 05.05.2021.

(31) Broj prve prijave: 201662371602 P (32) Datum podnošenja prve prijave: 15.08.2016. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US
201762533347 P 17.07.2017. US

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelji:

Pfizer Inc., 235 East 42nd Street, New York, NY 10017, US
Douglas Carl Behenna, 31302 Calle Del Campo, San Juan Capistrano, CA 92675, US
Ping Chen, 7666 Pipit Place, San Diego, CA 92129, US
Kevin Daniel Freeman-Cook, 7946 Sitio Nispero, Carlsbad, CA 92009, US
Robert Louis Hoffman, 10417 Avendida Magnifica, San Diego, CA 92131-1403, US
Mehran Jalaie, 11373 Saddle Cove Lane, San Diego, CA 92130, US
Asako Nagata, 7335 Rock Canyon Drive, San Diego, CA 92126, US
Sajiv Krishnan Nair, 1923 White Birch Drive, Vista, CA 92081, US
Sacha Ninkovic, 8902 Nottingham Place, La Jolla, CA 92037, US
Martha Alicia Ornelas, 15062 Avenida Montuouse, Apartment C, San Diego, CA 92129, US
Cynthia Louise Palmer, 9847 Ogram Drive, La Mesa, CA 91941, US
Eugene Yuanjin Rui, 11254 Caminito Corriente, San Diego, CA 92128, US

(74) Zastupnik:

Mraste & Partneri odvjetničko društvo, 10000 Zagreb, HR

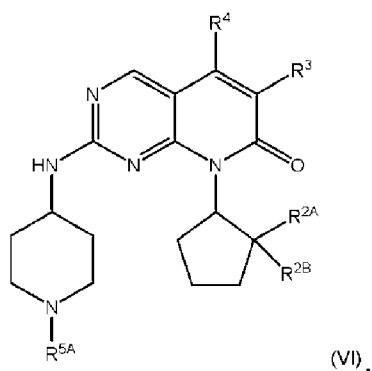
(54) Naziv izuma:

PIRIDOPIRIMDINONSKI INHIBITORI CDK2/4/6

HR P20210871 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Spoj Formule (VI):



(VI),

ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, **naznačen time** što:

R^{2A} i R^{2B} su neovisno H, OH ili C_1 - C_4 alkil, uz uvjet da najmanje jedan od R^{2A} i R^{2B} nije H;

R^3 je C_1 - C_4 fluoralkil;

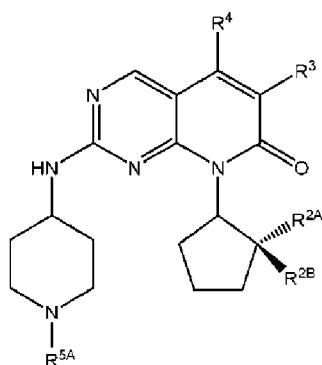
R^4 je H;

R^{5A} je SO_2R^7 ili $SO_2NR^8R^9$;

R^7 je C_1 - C_4 alkil; i

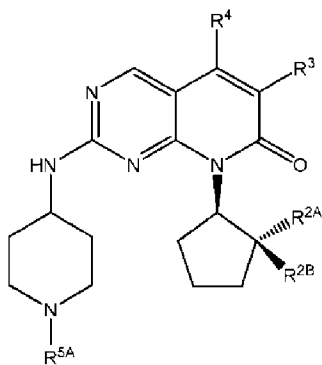
R^8 i R^9 su neovisno H ili C_1 - C_4 alkil.

2. Spoj, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što ima Formulu (VI-A):



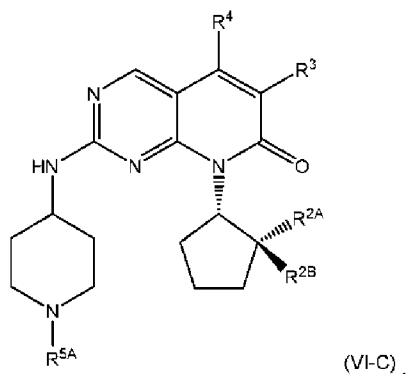
(VI-A),

3. Spoj, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, u skladu s patentnim zahtjevom 2, **naznačen time** što ima Formulu (VI-B):

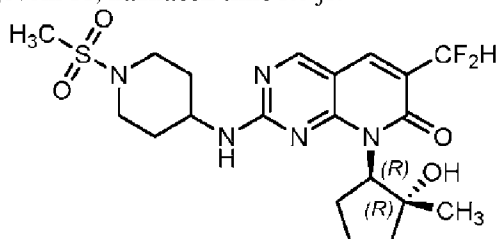


(VI-B),

4. Spoj, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, u skladu s patentnim zahtjevom 2, **naznačen time** što ima Formulu (VI-C):



5. Spoj, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 4, **naznačen time** što je R^3 C_1 - C_2 fluoralkil.
6. Spoj, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, u skladu s patentnim zahtjevom 5, **naznačen time** što je R^3 CF_2H ili CH_2CF_2H .
7. Spoj, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 6, **naznačen time** što je R^7 CH_3 .
8. Spoj, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 7, **naznačen time** što su R^8 i R^9 neovisno H ili CH_3 .
9. Spoj, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, u skladu s patentnim zahtjevom 3, **naznačen time** što:
 - jedan od R^{2A} i R^{2B} je OH, a drugi je CH_3 ; ili
 - jedan od R^{2A} i R^{2B} je OH, a drugi je H; ili
 - jedan od R^{2A} i R^{2B} je H, a drugi je CH_3 ;
 - R^3 je CF_2H ili CH_2CF_2H ;
 - R^4 je H;
 - R^{5A} je SO_2R^7 ; i
 - R^7 je CH_3 .
10. Spoj, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što je:
 - (+)-6-(2,2-difluoretil)-8-[(1*R**,2*R**)-2-hidroksi-2-metilciklopentil]-2-[[1-(metilsulfonyl)piperidin-4-il]amino]pirido[2,3-*d*]pirimidin-7(8*H*)-on;
 - (-)-6-(2,2-difluoretil)-8-[(1*R**,2*R**)-2-hidroksi-2-metilciklopentil]-2-[[1-(metilsulfonyl)piperidin-4-il]amino]pirido[2,3-*d*]pirimidin-7(8*H*)-on;
 - 6-(difluormetil)-8-[(1*R*,2*R*)-2-hidroksi-2-metilciklopentil]-2-[[1-(metilsulfonyl)piperidin-4-il]amino]pirido[2,3-*d*]pirimidin-7(8*H*)-on;
 - (-)-4-((6-(difluormetil)-8-[(1*R**,2*R**)-2-hidroksi-2-metilciklopentil]-7-okso-7,8-dihidropirido[2,3-*d*]pirimidin-2-il)amino)-*N*-metilpiperidin-1-sulfonamid;
 - (+)-4-((6-(difluormetil)-8-[(1*R**,2*R**)-2-hidroksi-2-metilciklopentil]-7-okso-7,8-dihidropirido[2,3-*d*]pirimidin-2-il)amino)-*N*-metilpiperidin-1-sulfonamid;
 - 8-[(1*R*,2*R*)-2-hidroksi-2-metilciklopentil]-2-[[1-(metilsulfonyl)piperidin-4-il]amino]-6-(trifluormetil)pirido[2,3-*d*]pirimidin-7(8*H*)-on;
 - 6-(difluormetil)-8-[(1*S*,2*S*)-2-hidroksi-2-metilciklopentil]-2-[[1-(metilsulfonyl)piperidin-4-il]amino]pirido[2,3-*d*]pirimidin-7(8*H*)-on;
 - (-)-4-((6-(difluormetil)-8-[(1*R**,2*R**)-2-hidroksi-2-metilciklopentil]-7-okso-7,8-dihidropirido[2,3-*d*]pirimidin-2-il)amino)piperidin-1-sulfonamid; ili
 - (+)-4-((6-(difluormetil)-8-[(1*R**,2*R**)-2-hidroksi-2-metilciklopentil]-7-okso-7,8-dihidropirido[2,3-*d*]pirimidin-2-il)amino)piperidin-1-sulfonamid.
11. Spoj, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 3, **naznačen time** što je 6-(difluormetil)-8-[(1*R*,2*R*)-2-hidroksi-2-metilciklopentil]-2-[[1-(metilsulfonyl)piperidin-4-il]amino]pirido[2,3-*d*]pirimidin-7(8*H*)-on.
12. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 11, **naznačen time** što je:



13. Farmaceutski pripravak, **naznačen time** što sadrži spoj, ili njegovu farmaceutski prihvatljivu sol, u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 12, kao i farmaceutski prihvatljivi nosač ili pomoćno sredstvo.

14. Spoj, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 12, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi kao medikament.
15. Spoj, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 12, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi u liječenju abnormalnog staničnog rasta.
- 5 16. Spoj namijenjen upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 15, **naznačen time** što je navedeni abnormalni stanični rast rak.
17. Spoj namijenjen upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 16, gdje je rak (a) rak dojke ili rak jajnika; (b) **naznačen time** što je amplificiran ili hiperekprimiran ciklin E1 (CCNE1) i ciklin E2 (CCNE2); ili (c) i (a) i (b).
- 10 18. Spoj namijenjen upotrebi u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 15 do 17, **naznačen time** što se navedeni spoj primjenjuje uzastopno ili istodobno s najmanje jednim dodatnim farmaceutske ili medicinske sredstvom.
19. Spoj namijenjen upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 18, **naznačen time** što je navedeno dodatno farmaceutske ili medicinske sredstvo sredstvo protiv raka.
- 15 20. Spoj namijenjen upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 18, **naznačen time** što je navedeno dodatno farmaceutske ili medicinske sredstvo tamoksifen, docetaksel, paklitaksel, cisplatin, kapecitabin, gemcitabin, vinorelbin, eksemestan, letrozol, fulvestrant, anastrozol ili trastuzumab.