



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20211124 T1



HR P20211124 T1

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

(51) MKP:

C07D 471/04 (2006.01)
C07D 471/02 (2006.01)
A61K 31/437 (2006.01)
A61K 31/506 (2006.01)
A61K 31/4545 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 15.10.2021.

(21) Broj predmeta: P20211124T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 14.07.2021.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2016054549
Datum podnošenja međunarodne prijave: 29.09.2016.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 16852640.8
Datum podnošenja europske prijave patenta: 29.09.2016.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2017059139
Datum međunarodne objave: 06.04.2017.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3355884 A1
Datum objave europske prijave patenta: 08.08.2018.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3355884 B1
Datum objave europskog patenta: 28.04.2021.

(31) Broj prve prijave: 201562235900 P (32) Datum podnošenja prve prijave: 01.10.2015. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelj patenta: **Olema Pharmaceuticals, Inc., 512 2nd Street, 4th Floor, San Francisco, CA 94107, US**

(72) Izumitelji: **David C. Myles, 79 Roble Road, Berkeley, CA 94705, US**
Peter J. Kushner, 1362 6th Avenue, San Francisco, CA 94122, US
Cyrus L Harmon, PO Box 219, Bolinas, CA 94924, US

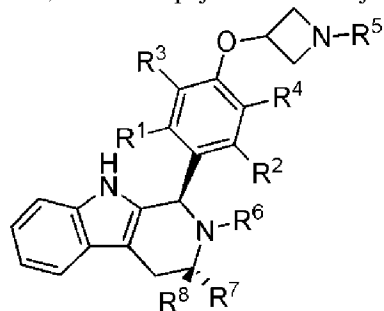
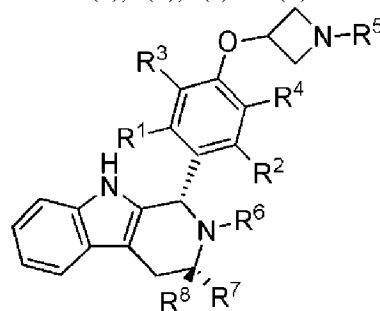
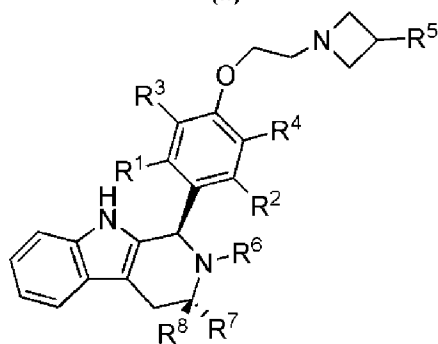
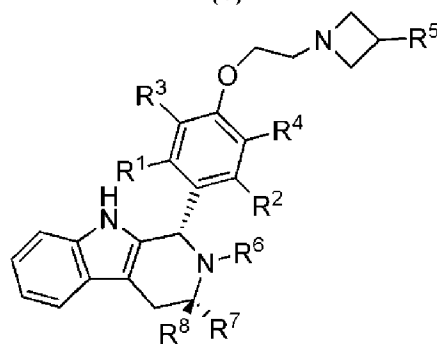
(74) Zastupnik: **PRODUCTA d.o.o., 10000 Zagreb, HR**

(54) Naziv izuma: **TETRAHIDRO-1H-PIRIDO[3,4-b]INDOL ANTI-ESTROGENI LIJEKOVI**

HR P20211124 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Spoj s formulom I, navedeni spoj s formulom I je spoj s formulom **I(a)**, **I(b)**, **I(c)** ili **I(d)**:

**I(a)****I(b)****I(c)****I(d)**

ili njihova farmaceutski prihvatljiva sol,
naznačen time što:

R^1 , R^2 , R^3 i R^4 su vodik;

R^5 je vodik, C_1 - C_6 alkil, C_1 - C_6 haloalkil, C_2 - C_6 alkenil, C_0 - C_4 (C_3 - C_6 cycloalkil) ili C_1 - C_6 heteroalkil;

R^6 je vodik, C_1 - C_6 alkil, C_1 - C_6 haloalkil ili C_0 - C_4 (C_3 - C_6 cycloalkil); i

R^7 i R^8 su svaki neovisno odabrani od vodika ili C_1 - C_6 alkila.

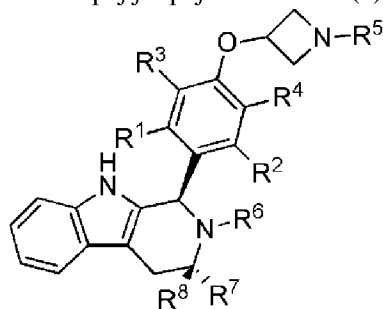
2. Spoj prema patentnom zahtjevu 1, naznačen time što

(a) u formuli **I(a)** ili **I(b)** R^5 je C_1 - C_6 alkil, poželjno pri čemu u formuli **I(a)** ili **I(b)** R^5 je odabran iz skupine koju čine metil, etil, propil i butil, poželjnije pri čemu u formuli **I(a)** ili **I(b)** R^5 je propil;

(b) u formuli **I(c)** ili Formula **I(d)** R^5 je C_1 - C_6 haloalkil, poželjno pri čemu u formuli **I(c)** ili Formula **I(d)** R^5 je odabran iz skupine koju čine $-CH_2F$, CRF_2 ili CF_3 , poželjnije pri čemu u formuli **I(c)** ili Formula **I(d)** R^5 je CH_2F ; ili

(c) R^7 je metil i R^8 je vodik.

3. Spoj prema patentnom zahtjevu 1, navedeni spoj je spoj s formulom **I(a)**:

**I(a)**

ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

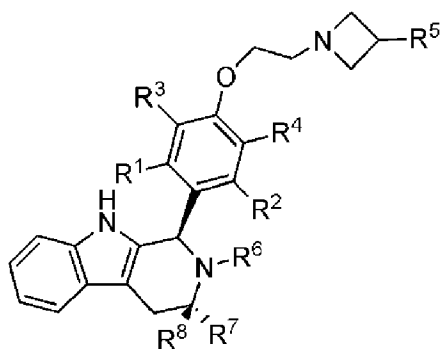
4. Spoj prema patentnom zahtjevu 3, naznačen time što

(a) R^5 je C_1 - C_6 alkil, poželjno pri čemu R^5 je odabran iz skupine koju čine metil, etil, propil i butil, poželjnije pri čemu R^5 je propil;

(b) R^6 je C_1 - C_6 haloalkil, poželjnije pri čemu R^6 je $-CH_2CF(CH_3)_2$; ili

(c) R^7 je metil i R^8 je vodik.

5. Spoj prema patentnom zahtjevu 1, navedeni spoj je spoj sa formulom **I(c)**:



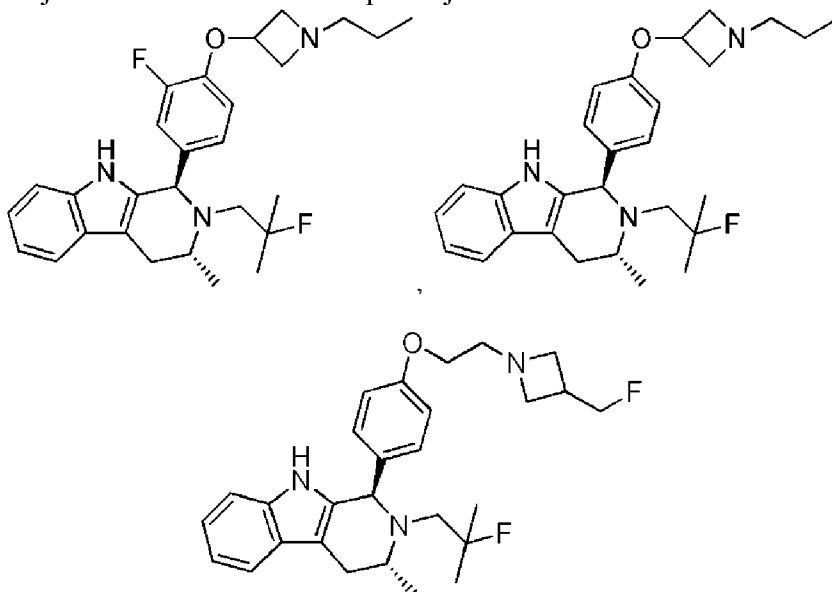
I(c)

ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

6. Spoj prema patentnom zahtjevu 5, naznačen time što

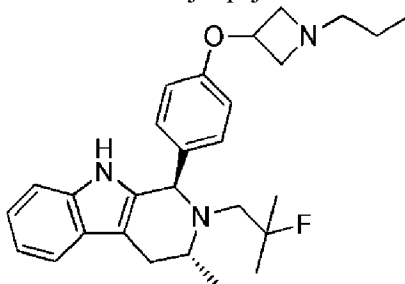
- (a) R^5 je C_1 - C_6 haloalkil, poželjno pri čemu R^5 je odabran iz skupine koju čine $-CH_2F$, CRF_2 ili CF_3 , poželjnije pri čemu R^5 je CH_2F ;
 (b) R^6 je C_1 - C_6 haloalkil, poželjno pri čemu R^6 je $-CH_2CF(CH_3)_2$; ili
 (c) R^7 je metil i R^8 je vodik.

7. Spoj koji ima kemijsku strukturu odabranu iz skupine koju čine:



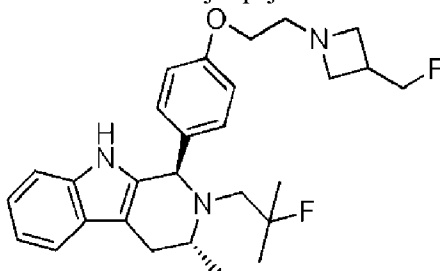
ili njihova farmaceutski prihvatljiva sol.

8. Spoj prema patentnom zahtjevu 7, naznačen time što je spoj:



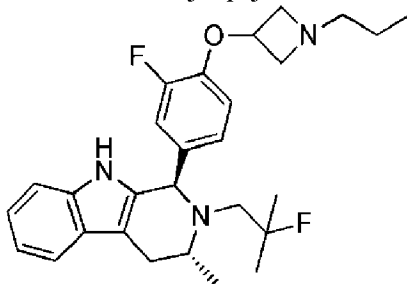
ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

9. Spoj prema patentnom zahtjevu 7, naznačen time što je spoj:



ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol.

10. Spoj prema patentnom zahtjevu 7, naznačen time što je spoj:



ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol.

- 5 11. Pripravak naznačen time što sadrži spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 10 i farmaceutske prihvatljiv nosač, poželjno pri čemu je nosač pogodan za oralnu isporuku.
12. Spoj prema patentnom zahtjevu 1-10 za uporabu ili pripravak prema patentnom zahtjevu 11 za uporabu u liječenju poremećaja kod pacijenta, naznačen time što navedena uporaba obuhvaća davanje pacijentu terapijski učinkovite količine spoja prema patentnom zahtjevu 1-10, proizvoljno u farmaceutske prihvatljivom nosaču, ili pripravku iz
- 10 patentnog zahtjeva 11.
13. Spoj za uporabu ili pripravak za uporabu prema patentnom zahtjevu 12
- (a) pri čemu je poremećaj rak dojke;
 - (b) pri čemu je poremećaj odabran iz skupine koju čine rak jajnika, rak endometrija, vaginalni rak, rak pluća, rak kostiju, rak maternice i endometriozu;
 - (c) pri čemu navedena uporaba nadalje obuhvaća primjenu spoja u kombinaciji ili naizmjenično s drugim antikancerogenim sredstvom za liječenje raka;
 - (d) pri čemu navedena uporaba nadalje obuhvaća primjenu spoja u kombinaciji ili naizmjenično s estrogenom ili djelomičnim antagonistom estrogenskog receptora za liječenje poremećaja u postmenopauzi; ili
 - (e) pri čemu je pacijent čovjek.
- 15