



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20191979 T1



HR P20191979 T1

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

(51) MKP:

A61K 31/44 (2006.01)
A61K 31/506 (2006.01)
C07F 9/535 (2006.01)
A61K 31/505 (2006.01)
C07F 9/655 (2006.01)
C07D 405/06 (2006.01)
C07D 409/14 (2006.01)
C07D 487/04 (2006.01)
C07D 493/04 (2006.01)
C07D 498/04 (2006.01)
C07D 239/24 (2006.01)
A61K 31/34 (2006.01)
C07F 9/54 (2006.01)
C07F 9/6558 (2006.01)
C07D 409/06 (2006.01)
C07D 471/04 (2006.01)
C07D 491/052 (2006.01)
C07D 495/04 (2006.01)
C07D 513/04 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 07.02.2020.

(21) Broj predmeta: P20191979T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 31.10.2019.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2015038712
Datum podnošenja međunarodne prijave: 30.06.2015.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 15815330.4
Datum podnošenja europske prijave patenta: 30.06.2015.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2016004136
Datum međunarodne objave: 07.01.2016.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3164130 A1
Datum objave europske prijave patenta: 10.05.2017.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3164130 B1
Datum objave europskog patenta: 07.08.2019.

(31) Broj prve prijave: 201462019756 P (32) Datum podnošenja prve prijave: 01.07.2014. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US
201562185678 P 28.06.2015. US

(73) Nositelj patenta:

Millennium Pharmaceuticals, Inc., 40 Landsdowne Street, Cambridge, MA 02139, US

(72) Izumitelji:

Matthew O. Duffey, 5050 S. Lake Shore Dr. 2717, Chicago, IL 60615, US
Dylan England, 9 Wayne Road, Milford, MA 01757, US
Scott Freeze, 67 Gates St, Unit 1, Boston, MA 02127, US
Zhigen Hu, 64B Marshall Street, Somerville, MA 02145, US
Steven P. Langston, 164 Mill Road, Andover, MA 01845, US
Charles McIntyre, 230 Brookline Street, Apt. 1, Cambridge, MA 02139, US
Hirotake Mizutani, 264 Massachussets Ave., 209, Arlington, MA 02474, US
Koji Ono, c/o TAKEDA PHARMACEUTICALS COMPANY LIMITED, 26-1, Muraoka-Higashi 2-chome, Fujisawa, Kanagawa 251-0012, JP
He Xu, 12 Louart Drive, Needham HGTS, MA 02494-1449, US
ZMP IP d.o.o., 10000 Zagreb, HR

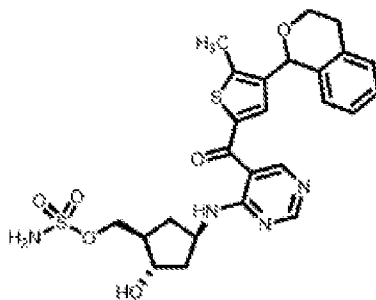
(74) Zastupnik:

(54) Naziv izuma: **HETEOARILNI SPOJEVI KOJI SU KORISNI KAO INHIBITORI SUMO-AKTIVIRAJUĆEG ENZIMA**

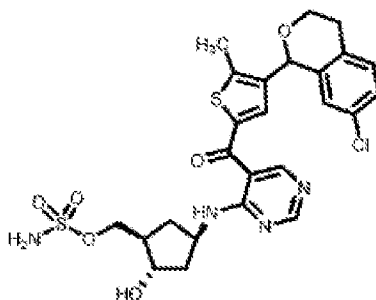
HR P20191979 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

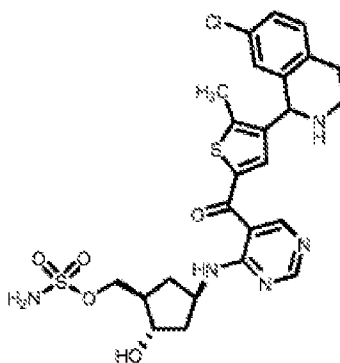
1. Kemijski entitet odabran od:



I-256;



I-257;



I-263;

i njihovih farmaceutski prihvatljivih soli.

2. Kemijski entitet u skladu s patentnim zahtjevom 1, gdje je kemijski entitet odabran od:

I-256 [(1R,2S,4R)-4-{[5-({4-[(1S)-3,4-dihidro-1H-izokromen-1-il]-5-metil-2-tienil}karbonil)pirimidin-4-il]amino}-2-hidroksiciklopentil]metil sulfamata; i

I-256a [(1R,2S,4R)-4-{[5-({4-[(1R)-3,4-dihidro-1H-izokromen-1-il]-5-metil-2-tienil}karbonil)pirimidin-4-il]amino}-2-hidroksiciklopentil]metil sulfamata;

I-256b [(1R,2S,4R)-4-{[5-({4-[(1S)-3,4-dihidro-1H-izokromen-1-il]-5-metil-2-tienil}karbonil)pirimidin-4-il]amino}-2-hidroksiciklopentil]metil sulfamata;

i njihovih farmaceutski prihvatljivih soli.

3. Kemijski entitet u skladu s patentnim zahtjevom 2, gdje je kemijski entitet odabran od: [(1R,2S,4R)-4-{[5-({4-[(1R)-3,4-dihidro-1H-izokromen-1-il]-5-metil-2-tienil}karbonil)pirimidin-4-il]amino}-2-hidroksiciklopentil]metil sulfamata formule I-256b i njegovih farmaceutski prihvatljivih soli.

4. Kemijski entitet u skladu s patentnim zahtjevom 3, gdje je kemijski entitet kristalni oblik 1: [(1R,2S,4R)-4-{[5-({4-[(1R)-3,4-dihidro-1H-izokromen-1-il]-5-metil-2-tienil}karbonil)pirimidin-4-il]amino}-2-hidroksiciklopentil]metil sulfamata formule I-256b, pri čemu je oblik 1 **naznačen** vrhom rendgenskog difraktograma praha pod 2θ kutem od 21.1°.

5. Kemijski entitet u skladu s patentnim zahtjevom 1, gdje je kemijski entitet odabran od:

- [(1R,2S,4R)-4-{[5-({4-[(1S)-7-kloro-3,4-dihidro-1H-izokromen-1-il]-5-metil-2-tienil}karbonil)pirimidin-4-il]amino}-2-hidroksiciklopentil]metil sulfamata; i
 I-257 [(1R,2S,4R)-4-{[5-({4-[(1R)-7-kloro-3,4-dihidro-1H-izokromen-1-il]-5-metil-2-tienil}karbonil)pirimidin-4-il]amino}-2-hidroksiciklopentil]metil sulfamata;
- 5 I-257a [(1R,2S,4R)-4-{[5-({4-[(1S)-7-kloro-3,4-dihidro-1H-izokromen-1-il]-5-metil-2-tienil}karbonil)pirimidin-4-il]amino}-2-hidroksiciklopentil]metil sulfamata;
- I-257b [(1R,2S,4R)-4-{[5-({4-[(1R)-7-kloro-3,4-dihidro-1H-izokromen-1-il]-5-metil-2-tienil}karbonil)pirimidin-4-il]amino}-2-hidroksiciklopentil]metil sulfamata;
- i njihovih farmaceutski prihvatljivih soli.
- 10 6. Kemijski entitet u skladu s patentnim zahtjevom 5, gdje je kemijski entitet odabran od: [(1R,2S,4R)-4-{[5-({4-[(1R)-7-kloro-3,4-dihidro-1H-izokromen-1-il]-5-metil-2-tienil}karbonil)pirimidin-4-il]amino}-2-hidroksiciklopentil]metil sulfamata formule I-257b i njegovih farmaceutski prihvatljivih soli.
7. Kemijski entitet u skladu s patentnim zahtjevom 6, gdje je kemijski entitet kristalni oblik 1: [(1R,2S,4R)-4-{[5-({4-[(1R)-7-kloro-3,4-dihidro-1H-izokromen-1-il]-5-metil-2-tienil}karbonil)pirimidin-4-il]amino}-2-
- 15 hidroksiciklopentil]metil sulfamata formule I-257b; pri čemu je oblik 1 **naznačen** vrhom rendgenskog difraktograma praha pod 2θ kutem od 25.2°.
8. Kemijski entitet u skladu s patentnim zahtjevom 1, gdje je kemijski entitet odabran od:
- I-263a [(1R,2S,4R)-4-{[5-({4-[(1R)-7-kloro-1,2,3,4-tetrahidroizohinolin-1-il]-5-metil-2-tienil}karbonil)pirimidin-4-il]amino}-2-hidroksiciklopentil]metil sulfamata;
- 20 I-263b [(1R,2S,4R)-4-{[5-({4-[(1S)-7-kloro-1,2,3,4-tetrahidroizohinolin-1-il]-5-metil-2-tienil}karbonil)pirimidin-4-il]amino}-2-hidroksiciklopentil]metil sulfamata;
- i njihovih farmaceutski prihvatljivih soli.
9. Kemijski entitet u skladu s patentnim zahtjevom 8, gdje je kemijski entitet odabran od: [(1R,2S,4R)-4-{[5-({4-[(1R)-7-kloro-1,2,3,4-tetrahidroizohinolin-1-il]-5-metil-2-tienil}karbonil)pirimidin-4-il]amino}-2-
- 25 hidroksiciklopentil]metil sulfamata formule I-263a i njegovih farmaceutski prihvatljivih soli.
10. Kemijski entitet u skladu s patentnim zahtjevom 9, gdje je kemijski entitet kristalni oblik 1: [(1R,2S,4R)-4-{[5-({4-[(1R)-7-kloro-1,2,3,4-tetrahidroizohinolin-1-il]-5-metil-2-tienil}karbonil)pirimidin-4-il]amino}-2-
- hidroksiciklopentil]metil sulfamata formule I-263a; pri čemu je oblik 1 **naznačen** vrhom rendgenskog difraktograma praha pod 2θ kutem od 21.6°.
- 30 11. Kemijski entitet u skladu s patentnim zahtjevom 9, gdje je kemijski entitet kristalni oblik 2: [(1R,2S,4R)-4-{[5-({4-[(1R)-7-kloro-1,2,3,4-tetrahidroizohinolin-1-il]-5-metil-2-tienil}karbonil)pirimidin-4-il]amino}-2-
- hidroksiciklopentil]metil sulfamata formule I-263a; pri čemu je oblik 2 **naznačen** vrhom rendgenskog difraktograma praha pod 2θ kutem od 19.0°.
12. Kemijski entitet u skladu s patentnim zahtjevom 9, gdje je kemijski entitet kristalni oblik 3: [(1R,2S,4R)-4-{[5-({4-[(1R)-7-kloro-1,2,3,4-tetrahidroizohinolin-1-il]-5-metil-2-tienil}karbonil)pirimidin-4-il]amino}-2-
- 35 hidroksiciklopentil]metil sulfamata formule I-263a; pri čemu je oblik 3 **naznačen** vrhom rendgenskog difraktograma praha pod 2θ kutem od 15.6°.
13. Kemijski entitet u skladu s patentnim zahtjevom 8, gdje je kemijski entitet odabran od: [(1R,2S,4R)-4-{[5-({4-[(1S)-7-kloro-1,2,3,4-tetrahidroizohinolin-1-il]-5-metil-2-tienil}karbonil)pirimidin-4-il]amino}-2-
- 40 hidroksiciklopentil]metil sulfamata formule I-263b i njegovih farmaceutski prihvatljivih soli.
14. Farmaceutski pripravak koja sadrži kemijski entitet u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 13 i farmaceutski prihvatljiv nosač.
15. Kemijski entitet u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 13 ili farmaceutski pripravak u skladu s patentnim zahtjevom 14, za uporabu u liječenju raka.