



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO



(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20120440 T1

HR P20120440 T1

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

(51) MKP:

C07D 403/10 (2006.01)
C07D 403/14 (2006.01)
A61K 31/4164 (2006.01)
A61P 31/22 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 30.06.2012.

(21) Broj predmeta: P20120440T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 23.05.2012.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2008053638
Datum podnošenja međunarodne prijave: 12.02.2008.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 08780411.8
Datum podnošenja europske prijave patenta: 12.02.2008.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2009102318
Datum međunarodne objave: 20.08.2009.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2250163 A1
Datum objave europske prijave patenta: 17.11.2010.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2250163 B1
Datum objave europskog patenta: 28.03.2012.

(73) Nositelj patenta:

**Bristol-Myers Squibb Company, Route 206 and Province Line Road,
Princeton, NJ 08543-4000, US**

(72) Izumitelji:

Carol Bachand, 119 Place Mercure, Candiac, QC J5R 1B1, CA

**Makonen Belema, c/o Bristol-Myers Squibb Company, 5 Research
Parkway, Wallingford, CT 06492, US**

Daniel H. Deon, 2122 Clifton, Montreal, QC H4A 2N4, CA

**Andrew C. Good, c/o Bristol Myers Squibb Company, 5 Research
Parkway, Wallingford, CT 06492, US**

**Jason Goodrich, c/o Bristol Myers Squibb Company, 5 Research
Parkway, Wallingford, CT 06492, US**

Clint A. James, 500 Boulevard Quinn, Longueuil, QC J4H 2N4, CA

Rico Lavoie, 16 Avenue de Bercy, Candiac, QC J5R 4B7, CA

**Omar D. Lopez, c/o Bristol Myers Squibb Company, 5 Research Parkway,
Wallingford, CT 06492, US**

Alain Martel, 29 Rue Monette, Delson, QC J5B 1G8, CA

**Nicholas A. Meanwell, c/o Bristol Myers Squibb Company, 5 Research
Parkway, Wallingford, CT 06492, US**

**Van N. Nguyen, c/o Bristol Myers Squibb Company, 5 Research Parkway,
Wallingford, CT 06492, US**

**Jeffrey Lee Romine, c/o Bristol Myers Squibb Company, 5 Research
Parkway, Wallingford, CT 06492, US**

**Edward H. Ruediger, 133 rue St. Charles, Greenfield Park, QC J4V 2K3,
CA**

**Lawrence B. Snyder, c/o Bristol Myers Squibb Company, 5 Research
Parkway, Wallingford, CT 06492, US**

**Denis R. St. Laurent, c/o Bristol Myers Squibb Company, 5 Research
Parkway, Wallingford, CT 06492, US**

HR P20120440 T1



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO



(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20120440 T1

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

HR P20120440 T1

Fukang Yang, c/o Bristol Myers Squibb Company, 5 Research Parkway,
Wallingford, CT 06492, US
David R. Langley, c/o Bristol Myers Squibb Company, 5 Research
Parkway, Wallingford, CT 06492, US
Gan Wang, c/o Bristol Myers Squibb Company, 5 Research Parkway,
Wallingford, CT 06492, US
Lawrence G. Hamann, 7 Whitney Street, North Grafton, MA 01536, US
ZMP IP d.o.o., 10000 Zagreb, HR

(74) Zastupnik:

(54) Naziv izuma: **INHIBITORI VIRUSA HEPATITISA C**

HR P20120440 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

5

1. Spoj izabran između:

dimetil (4,4'-bifenildiilbis(1H-imidazol-4,2-diil((1S)-2-metil-1,1-propanediil)imino((2S)-1-okso-1,2-propanediil)))biskarbamat;

10

dimetil (4,4'-bifenildiilbis(1H-imidazol-4,2-diil((1S)-2-metil-1,1-propanediil)imino((2S,3R)-3-metoksi-1-okso-1,2-butanediil)))biskarbamat;

dimetil (4,4'-bifenildiilbis(1H-imidazol-4,2-diil((1S)-2-metil-1,1-propanediil)imino((2S)-3-metil-1-okso-1,2-butanediil)))biskarbamat;

15

dimetil (4,4'-bifenildiilbis(1H-imidazol-4,2-diil((1S)-2-metil-1,1-propanediil)imino((2S)-4-metoksi-1-okso-1,2-butanediil)))biskarbamat;

dimetil (4,4'-bifenildiilbis(1H-imidazol-4,2-diil((1R)-2-metil-1,1-propanediil)imino((2S)-3-metil-1-okso-1,2-butanediil)))biskarbamat;

20

dimetil (4,4'-bifenildiilbis(1H-imidazol-4,2-diil((1R)-2-metil-1,1-propanediil)imino((2S)-1-okso-1,2-propanediil)))biskarbamat;

dimetil (4,4'-bifenildiilbis(1H-imidazol-4,2-diil((1R)-2-metil-1,1-propanediil)imino((2S)-4-metoksi-1-okso-1,2-butanediil)))biskarbamat;

dimetil (4,4'-bifenildiilbis(1H-imidazol-4,2-diil((1R)-2-metil-1,1-propanediil)imino((2S,3R)-3-metoksi-1-okso-1,2-butanediil)))biskarbamat;

25

dimetil (4,4'-bifenildiilbis(1H-imidazol-4,2-diil((1R)-2-metil-1,1-propanediil)imino((2R)-3-metil-1-okso-1,2-butanediil)))biskarbamat;

dimetil (4,4'-bifenildiilbis(1H-imidazol-4,2-diil((1S)-2-metil-1,1-propanediil)imino((2R)-3-metil-1-okso-1,2-butanediil)))biskarbamat;

N²-(metoksikarbonil)-N-((1S)-1-(4-(4'-(2-((2S)-1-(N-(metoksikarbonil)-L-valil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-4-il)-4-bifenilil)-1H-imidazol-2-il)-2-metilpropil)-L-valinamid;

30

metil ((1S,2R)-2-metoksi-1-(((2S)-2-(4-(4'-(2-((1S)-1-(N-(metoksikarbonil)-O-metil-L-treonil)amino)-2-metilpropil)-1H-imidazol-4-il)-4-bifenilil)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)propil)karbamat;

metil ((1S)-3-metoksi-1-(((2S)-2-(4-(4'-(2-((1S)-1-(N-(metoksikarbonil)-O-metil-L-homoseril)amino)-2-metilpropil)-1H-imidazol-4-il)-4-bifenilil)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)propil)karbamat;

metil ((1S)-2-((2S)-2-(4-(4'-(2-((1S)-1-(N-(metoksikarbonil)-L-alanil)amino)-2-metilpropil)-1H-imidazol-4-il)-4-bifenilil)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)-1-metil-2-oksoetil)karbamat;

35

N²-(metoksikarbonil)-N-((1R)-1-(4-(4'-(2-((2S)-1-(N-(metoksikarbonil)-L-valil)-2-pirolidinil)-1H-imidazol-4-il)-4-bifenilil)-1H-imidazol-2-il)-2-metilpropil)-L-valinamid;

metil ((1S,2R)-2-metoksi-1-(((2S)-2-(4-(4'-(2-((1R)-1-(N-(metoksikarbonil)-O-metil-L-treonil)amino)-2-metilpropil)-1H-imidazol-4-il)-4-bifenilil)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)propil)karbamat;

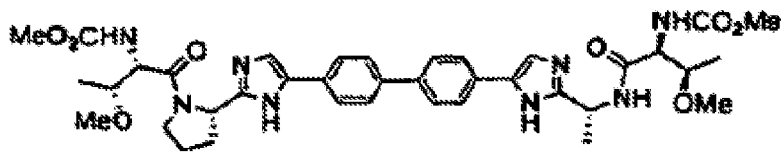
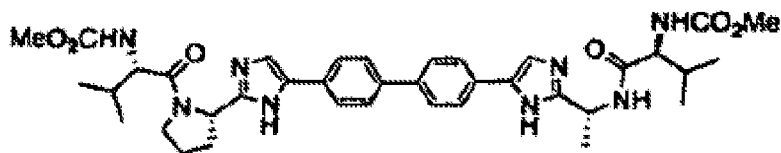
40

metil ((1S)-3-metoksi-1-(((2S)-2-(4-(4'-(2-((1R)-1-(N-(metoksikarbonil)-O-metil-L-homoseril)amino)-2-metilpropil)-1H-imidazol-4-il)-4-bifenilil)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)karbonil)propil)karbamat; i

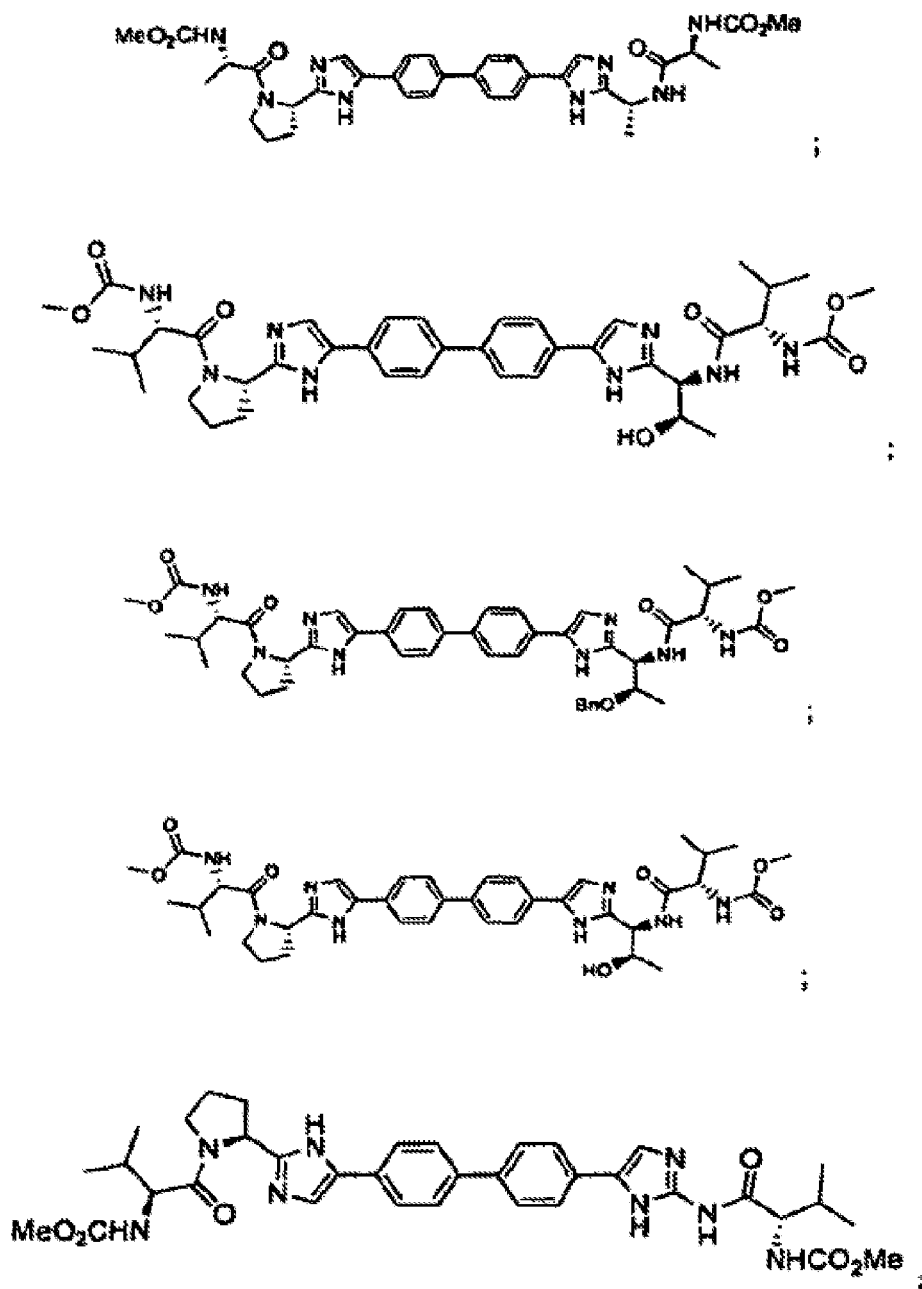
metil ((1S)-2-((2S)-2-(4-(4'-(2-((1R)-1-(N-(metoksikarbonil)-L-alanil)amino)-2-metilpropil)-1H-imidazol-4-il)-4-bifenilil)-1H-imidazol-2-il)-1-pirolidinil)-1-metil-2-oksoetil)karbamat;

ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

2. Spoj izabran između



45



ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

3. Smjesa koja sadrži spoj prema zahtjevima 1 ili 2, ili njegovu farmaceutski prihvatljivu sol, i farmaceutski prihvatljiv nosač.
- 5 4. Smjesa prema zahtjevu 3 koja dalje sadrži jedan ili dva dodatna spoja aktivna protiv HCV.
5. Smjesa prema zahtjevu 4 gdje je barem jedan od dodatnih spojeva interferon ili ribavirin.
6. Smjesa prema zahtjevu 5 gdje se interferon izabire između interferon alfa 2B, pegilirani interferon alfa, konsenzus interferon, interferon alfa 2A, i limfoblastoid interferon tau.
7. Smjesa prema zahtjevu 4 gdje se barem jedan od dodatnih spojeva izabire između interleukina 2, interleukina 6, 10 interleukina 12, i spoja koji pojačava nastanak odgovora pomoćnih T stanica tipa 1, interferirajuće RNA, anti-sense RNA, Imikvimoda, ribavirina, inhibitora inozin 5'-monofosfat dehidrogenaze, amantadina i rimantadina.
8. Smjesa prema zahtjevu 4 gdje je barem jedan od dodatnih spojeva učinkovit u inhibiciji funkcije cilja izabranog između HCV metaloproteaze, HCV serin proteaze, HCV polimeraze, HCV helikaze, HCV NS4B proteina, ulaska HCV, HCV slaganja, HCV izlaza, HCV NS5A proteina i IMPDH za liječenje zaraze HCV-om.
- 15 9. Spoj prema zahtjevima 1 ili 2, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol za uporabu u liječenju HCV infekcije kod bolesnika.
10. Spoj za uporabu prema zahtjevu 9 koja dalje obuhvaća jedan ili dva dodatna spoja aktivna protiv HCV-a prije, nakon ili istodobno sa spojem iz zahtjeva 1 ili 2, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

11. Spoj za uporabu prema zahtjevu 10 gdje je barem jedan od dodatnih spojeva interferon ili ribavirin.
12. Spoj za uporabu prema zahtjevu 11 gdje se interferon izabire između interferon alfa 2B, pegilirani interferon alfa, konsenzus interferon, interferon alfa 2A, i limfoblastoid interferon tau.
- 5 13. Spoj za uporabu prema zahtjevu 10 gdje se barem jedan od dodatnih spojeva izabire između interleukina 2, interleukina 6, interleukina 12, i spoja koji pojačava nastanak odgovora pomoćnih T stanica tipa 1, interferirajuće RNA, anti-sense RNA, Imikvimoda, ribavirina, inhibitora inozin 5'-monofosfat dehidrogenaze, amantadina i rimantadina.
- 10 14. Spoj za uporabu prema zahtjevu 10 gdje je barem jedan od dodatnih spojeva učinkovit u inhibiciji funkcije cilja izabranog između HCV metaloproteaze, HCV serin proteaze, HCV polimeraze, HCV helikaze, HCV NS4B proteina, ulaska HCV, HCV slaganja, HCV izlaza, HCV NS5A proteina i IMPDH za liječenje zaraze HCV-om.