



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20180768 T1



HR P20180768 T1

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

(51) MKP:

C07D 491/14 (2006.01)
A61K 31/519 (2006.01)
A61P 35/02 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 10.08.2018.

(21) Broj predmeta: P20180768T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 16.05.2018.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/GB2015050396
Datum podnošenja međunarodne prijave: 12.02.2015.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 15707168.9
Datum podnošenja europske prijave patenta: 12.02.2015.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2015121657
Datum međunarodne objave: 20.08.2015.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3105233 A1
Datum objave europske prijave patenta: 21.12.2016.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3105233 B1
Datum objave europskog patenta: 28.03.2018.

(31) Broj prve prijave: 201402431

(32) Datum podnošenja prve prijave: 12.02.2014.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: GB

(73) Nositelj patenta:

**Karus Therapeutics Limited, Genesis Building, Library Avenue, Harwell
Campus, Oxfordshire OX11 0SG, GB**

(72) Izumitelji:

**Stephen Joseph Shuttleworth, Genesis Building, Library Avenue,
Harwell Campus, Oxfordshire OX11 0SG, GB**

**Alexander Richard Liam Cecil, Genesis Building, Library Avenue,
Harwell Campus, Oxfordshire OX11 0SG, GB**

**Franck Alexandre Silva, Genesis Building, Library Avenue, Harwell
Campus, Oxfordshire OX11 0SG, GB**

(74) Zastupnik:

ZMP IP d.o.o., 10000 Zagreb, HR

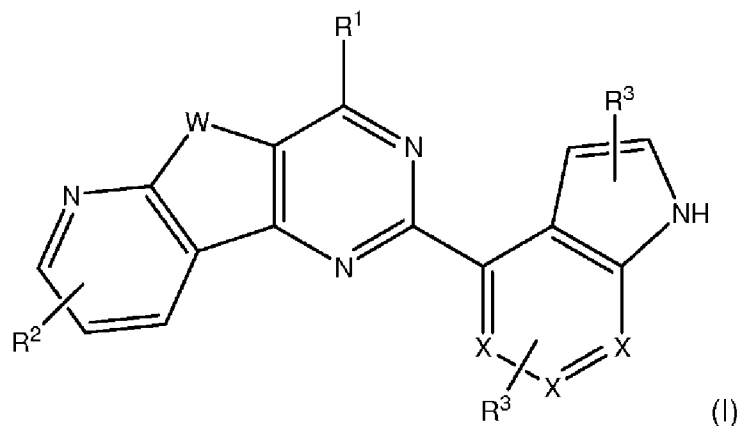
(54) Naziv izuma:

TRICIKLIČKI HETEROCIKLIČKI SPOJEVI KAO INHIBITORI FOSFOINOSITID-3-KINAZE

HR P20180768 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Spoj formule I:



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

W je O, N-H, N-(C₁-C₁₀alkil) ili S;

svaki X je neovisno CH ili N;

R¹ je 5- do 7-eročlani zasićeni ili nezasićeni, izborno supstituirani heterocikl, koji sadrži najmanje 1 heteroatom, kojeg se bira između N ili O;

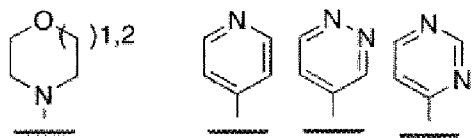
R² je LY;

svaki L je izravna veza, C₁-C₁₀ alkenil, C₂-C₁₀ alkenil ili C₂-C₁₀ alkinil;

Y je izborno supstituirani kondenzirani, premošteni ili spirociklički nearomatski 5-12-eročlani heterocikl koji sadrži do 4 heteroatoma, koje se bira između N ili O; i

svaki R³ je neovisno H, C₁-C₁₀ alkil, halogen, fluor C₁-C₁₀ alkil, O-C₁-C₁₀ alkil, NH-C₁-C₁₀ alkil, SC₁-C₁₀ alkil, O-fluor C₁-C₁₀ alkil, NH-acil, NH-C(O)-NH-C₁-C₁₀ alkil, C(O)-NH-C₁-C₁₀ alkil, aril ili heteroaril.

2. Spoj uz skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što R¹ prikazuje bilo koja od sljedećih struktura:



po mogućnosti gdje je R¹ morfolin.

3. Spoj uz skladu s bilo kojim od prethodnih patentnih zahtjeva, **naznačen time** što je W O ili S, po mogućnosti gdje je W O.

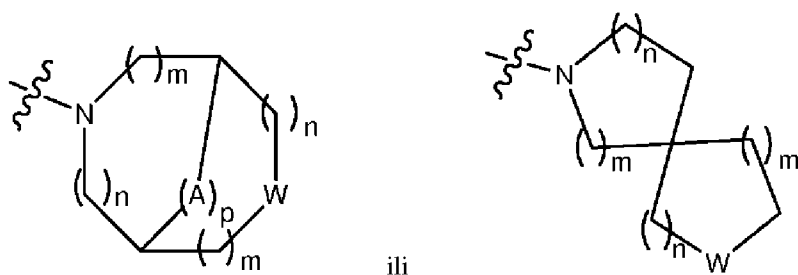
4. Spoj u skladu s bilo kojim od prethodnih patentnih zahtjeva, **naznačen time** što je X CH.

5. Spoj uz skladu s bilo kojim od prethodnih patentnih zahtjeva, **naznačen time** što je R³ H.

6. Spoj uz skladu s bilo kojim od prethodnih patentnih zahtjeva, **naznačen time** što je L C₁-C₁₀ alkenil, po mogućnosti metilen.

7. Spoj uz skladu s bilo kojim od prethodnih patentnih zahtjeva, **naznačen time** što Y sadrži jedan ili dva heteroatoma, po mogućnosti dva heteroatoma.

8. Spoj uz skladu s bilo kojim od prethodnih patentnih zahtjeva, **naznačen time** što se Y bira između:



gdje:

A se bira između O, S, NR⁴ ili izborno supstituiranog C₁-C₃ alkenila, C₂-C₃ alkenila ili C₂-C₃ alkinila; W je NR⁴, O ili CH₂;

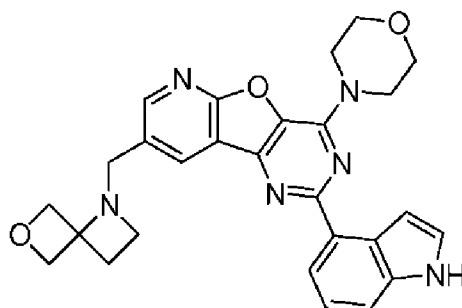
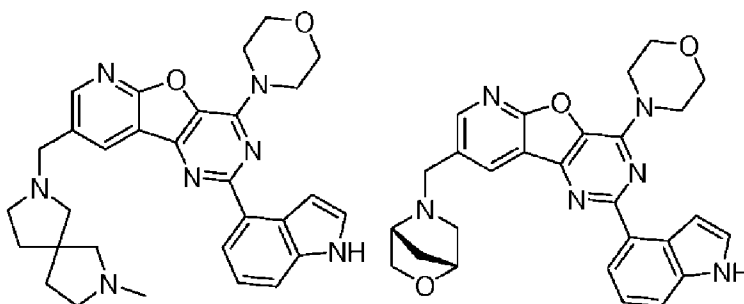
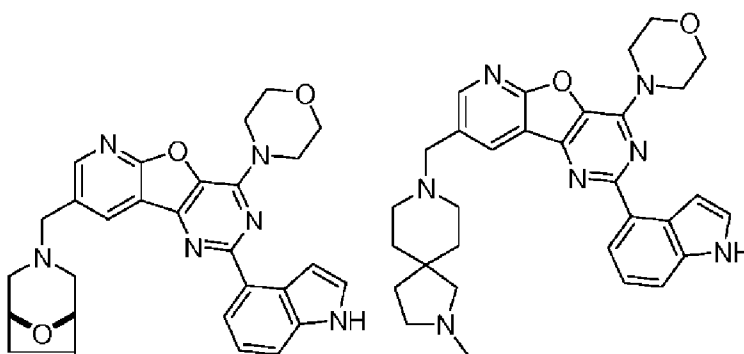
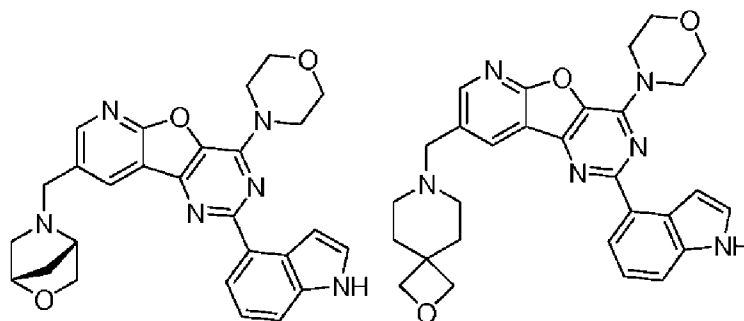
gdje je R⁴ H ili izborno supstituirani C₁-C₁₀ alkil, C₂-C₁₀ alkenil ili C₂-C₁₀ alkinil;

p se bira između 0 ili 1;

svaki m se neovisno bira između 0, 1 ili 2; i

svaki n se neovisno bira između 1, 2 ili 3.

- 5 9. Spoj uz skladu s patentnim zahtjevom 8, **naznačen time** što je A O ili C₁-C₃ alkilen, po mogućnosti metilen, i/ili gdje je W O ili CH₂, po mogućnosti O.
10. Spoj uz skladu s bilo kojim od prethodnih patentnih zahtjeva, **naznačen time** što ga prikazuje bilo kojim od sljedećih struktura:



11. Farmaceutski pripravak, **naznačen time** što sadrži spoj uz skladu s bilo kojim od prethodnih patentnih zahtjeva, kao i farmaceutski prihvatljivu pomoćnu tvar.
- 20 12. Spoj ili pripravak uz skladu s bilo kojim od prethodnih patentnih zahtjeva, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi u terapiji, po mogućnosti gdje se provodi terapija raka, imunosnog poremećaja ili upalnog poremećaja.
13. Spoj ili pripravak namijenjen upotrebi uz skladu s patentnim zahtjevom 12, **naznačen time** što je rak leukemija ili čvrsti tumor negativan na PTEN.

14. Spoj namijenjen upotrebi uz skladu s patentnim zahtjevom 12, **naznačen time** što se provodi terapija reumatoidnog artritisa.
15. Spoj ili pripravak namijenjen upotrebi uz skladu s patentnim zahtjevom 12, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi u terapiji protiv odbacivanja nakon presađivanja organa.