



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20250517 T1

HR P20250517 T1

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

(51) MKP:

C07D 487/04 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)
A61K 31/519 (2006.01)
C07D 519/00 (2006.01)
A61K 31/5383 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 20.06.2025.

(21) Broj predmeta: P20250517T

(22) Datum podnošenja : 26.02.2019.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2019019557
Datum podnošenja međunarodne prijave: 26.02.2019.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 19764330.7
Datum podnošenja europske prijave patenta: 26.02.2019.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2019173082
Datum međunarodne objave: 12.09.2019.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3762385 A1
Datum objave europske prijave patenta: 13.01.2021.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3762385 B1
Datum objave europskog patenta: 12.02.2025.

(31) Broj prve prijave: 201862641149 P (32) Datum podnošenja prve prijave: 09.03.2018. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US
201862755163 P 02.11.2018. US

(73) Nositelj patenta:

Recurium IP Holdings, LLC, 10835 Road to the Cure, Suite 205, San Diego, CA 92121, US

(72) Izumitelji:

Peter Qinhuang Huang, 10835 Road to the Cure, Suite 205, San Diego, CA 92121, US

Kevin Duane Bunker, 10835 Road to the Cure, Suite 205, San Diego, CA 92121, US

Brant Clayton Boren, 10835 Road to the Cure, Suite 205, San Diego, CA 92121, US

Sayee Gajanan Hegde, 10835 Road to the Cure, Suite 205, San Diego, CA 92121, US

Hui Liu, 10835 Road to the Cure, Suite 205, San Diego, CA 92121, US

Aditya Krishnan Unni, 10835 Road to the Cure, Suite 205, San Diego, CA 92121, US

Sunny Abraham, 10835 Road to the Cure, Suite 205, San Diego, CA 92121, US

Chad Daniel Hopkins, 10835 Road to the Cure, Suite 205, San Diego, CA 92121, US

Sunil Paliwal, 10835 Road to the Cure, Suite 205, San Diego, CA 92121, US

(74) Zastupnik:

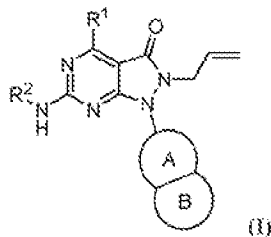
Vukmir i suradnici odvjetničko društvo d.o.o., 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma: SUPSTITUIRANI 1,2-DIHIDRO-3H-PIRAZOLO[3,4-D]PIRIMIDIN-3-ONI

HR P20250517 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

1. Spoj, **naznačen time, da** je predstavljen Formulom (I), ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, koji ima sljedeću strukturu:



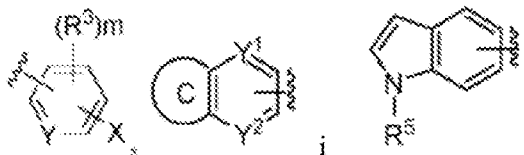
u kojoj:

R¹ se bira iz skupine koja se sastoji od vodika, halogena i supstituiranog ili nesupstituiranog C₁-C₆ alkila;

Prsten A se bira iz skupine koja se sastoji od supstituiranog ili nesupstituiranog fenila i supstituiranog ili nesupstituiranog 5-6-članog monocikličkog heteroarila;

Prsten B se bira iz skupine koja se sastoji od supstituiranog ili nesupstituiranog monocikličkog 5-7-članog karbociklila i supstituiranog ili nesupstituiranog 5-7-članog monocikličkog heterociklila;

R² se bira iz skupine koja se sastoji od



m je 0, 1, 2 ili 3;

R³ se bira iz skupine koja se sastoji od halogena i supstituiranog ili nesupstituiranog C₁-C₆ alkila;

X se bira iz skupine koja se sastoji od vodika, halogena, hidroksi, cijano, supstituiranog ili nesupstituiranog 4-6-članog monocikličkog heterociklila, supstituiranog ili nesupstituiranog amin(C₁-C₆ alkila), supstituiranog ili nesupstituiranog -NH-(CH₂)₁₋₆-amina, monosupstituiranog amina, disupstituiranog amina, amino, supstituiranog ili nesupstituiranog C₁-C₆ alkila, supstituiranog ili nesupstituiranog C₁-C₆ alkoksi, supstituiranog ili nesupstituiranog C₃-C₆ cikloalkoksi, supstituiranog ili nesupstituiranog (C₁-C₆ alkil)acila, supstituiranog ili nesupstituiranog C-amido, supstituiranog ili nesupstituiranog N-amido, supstituiranog ili nesupstituiranog C-karboksi, supstituiranog ili nesupstituiranog O-karboksi, supstituiranog ili nesupstituiranog O-karbamila, i supstituiranog ili nesupstituiranog N-karbamila;

Y je CH ili N;

Y¹ je CR^{4A} ili N;

Y² je CR^{4B} ili N;

Prsten C se bira iz skupine koja se sastoji od supstituiranog ili nesupstituiranog C₆-C₁₀ arila, supstituiranog ili nesupstituiranog monocikličkog 5-10-članog heteroarila, supstituiranog ili nesupstituiranog monocikličkog 5-7-članog karbociklila, supstituiranog ili nesupstituiranog 5-7-članog monocikličkog heterociklila, i supstituiranog ili nesupstituiranog 7-10-članog bicikličkog heterociklila;

R^{4A} i R^{4B} se neovisno biraju iz skupine koja se sastoji od vodika, halogena i nesupstituiranog i C₁₋₄ alkila; i

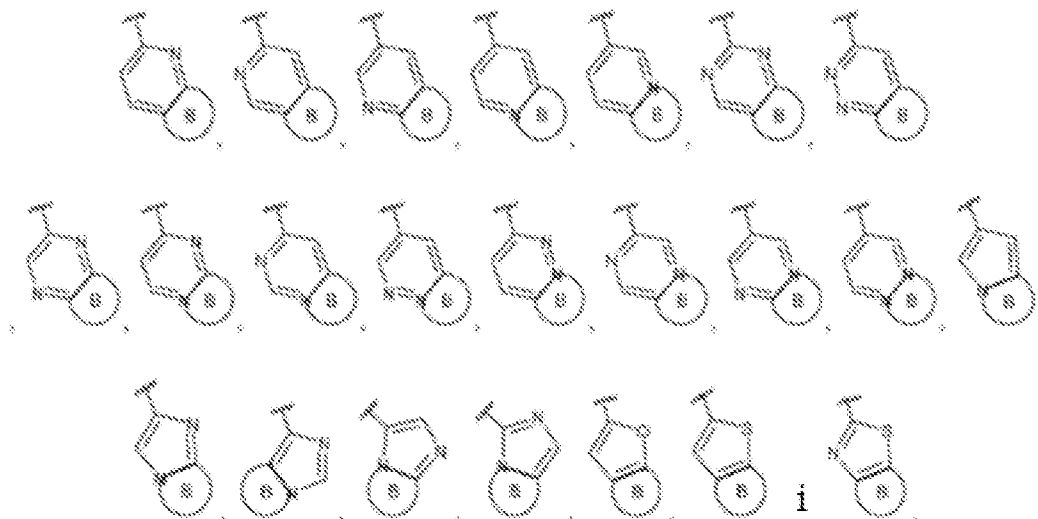
R⁵ je supstituirani ili nesupstituirani 5-7-člani monociklički heterociklil.

2. Spoj prema patentnom zahtjevu 1, **naznačen time, da** R¹ je vodik.

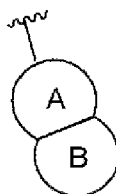
3. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1-2, **naznačen time, da** Prsten A je supstituirani ili nesupstituirani 5-6-člani monociklički heteroaril; ili time, da



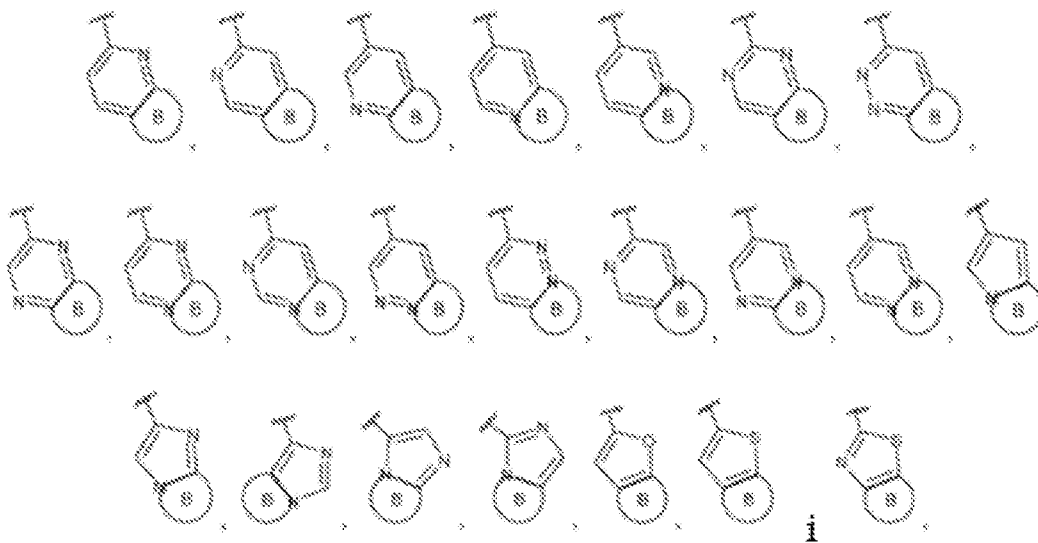
se bira iz skupine koja se sastoji od:



pri čemu je svaka od prethodno navedenih skupina supstituirana ili nesupstituirana; ili je pritom Prsten A nesupstituirani 5-6-člani monociklički heteroaril; ili time, da



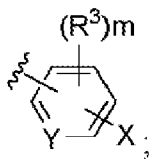
5 se bira iz skupine koja se sastoji od:



pri čemu je svaka od prethodno navedenih skupina nesupstituirana.

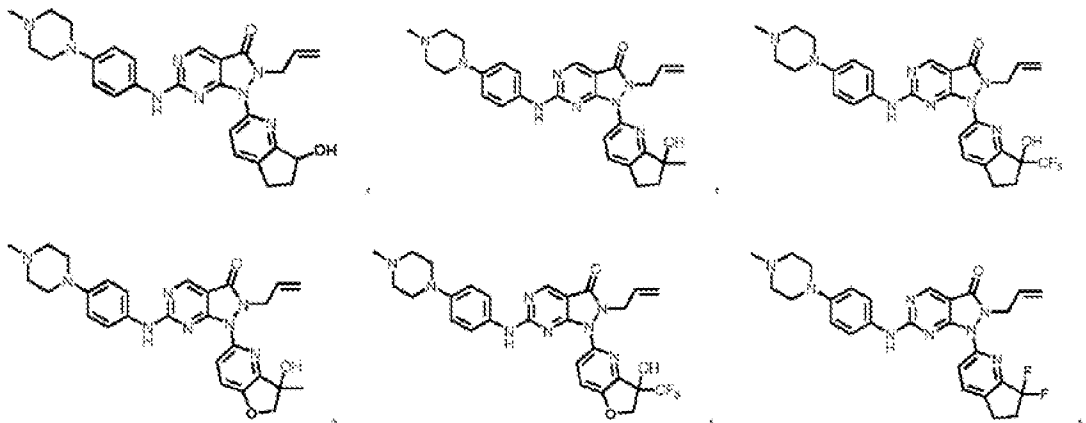
4. Spoj prema prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1-3, **naznačen time, da** Prsten B je supstituirani ili nesupstituirani monociklički 5-7-člani karbociklil;
 10 ili time, da Prsten B je supstituirani ili nesupstituirani monociklički 5-člani karbociklil;
 ili time, da Prsten B je supstituirani monociklički 5-7-člani karbociklil supstituiran s 1, 2 ili 3 supstituenta neovisno odabrana iz skupine koju čine fluoro, hidroksi, amino, nesupstituirani $-NHC(O)C_1.C_6$ alkil, nesupstituirani $C_1.C_6$ haloalkil, i nesupstituirani $C_1.C_6$ alkil;
 15 ili time, da Prsten B je supstituirani monociklički 5-člani karbociklil supstituiran s 1, 2 ili 3 supstituenta neovisno odabrana iz skupine koju čine fluoro, hidroksi, amino, nesupstituirani $-NHC(O)C_1.C_6$ alkil, nesupstituirani $C_1.C_6$ haloalkil, i nesupstituirani $C_1.C_6$ alkil.

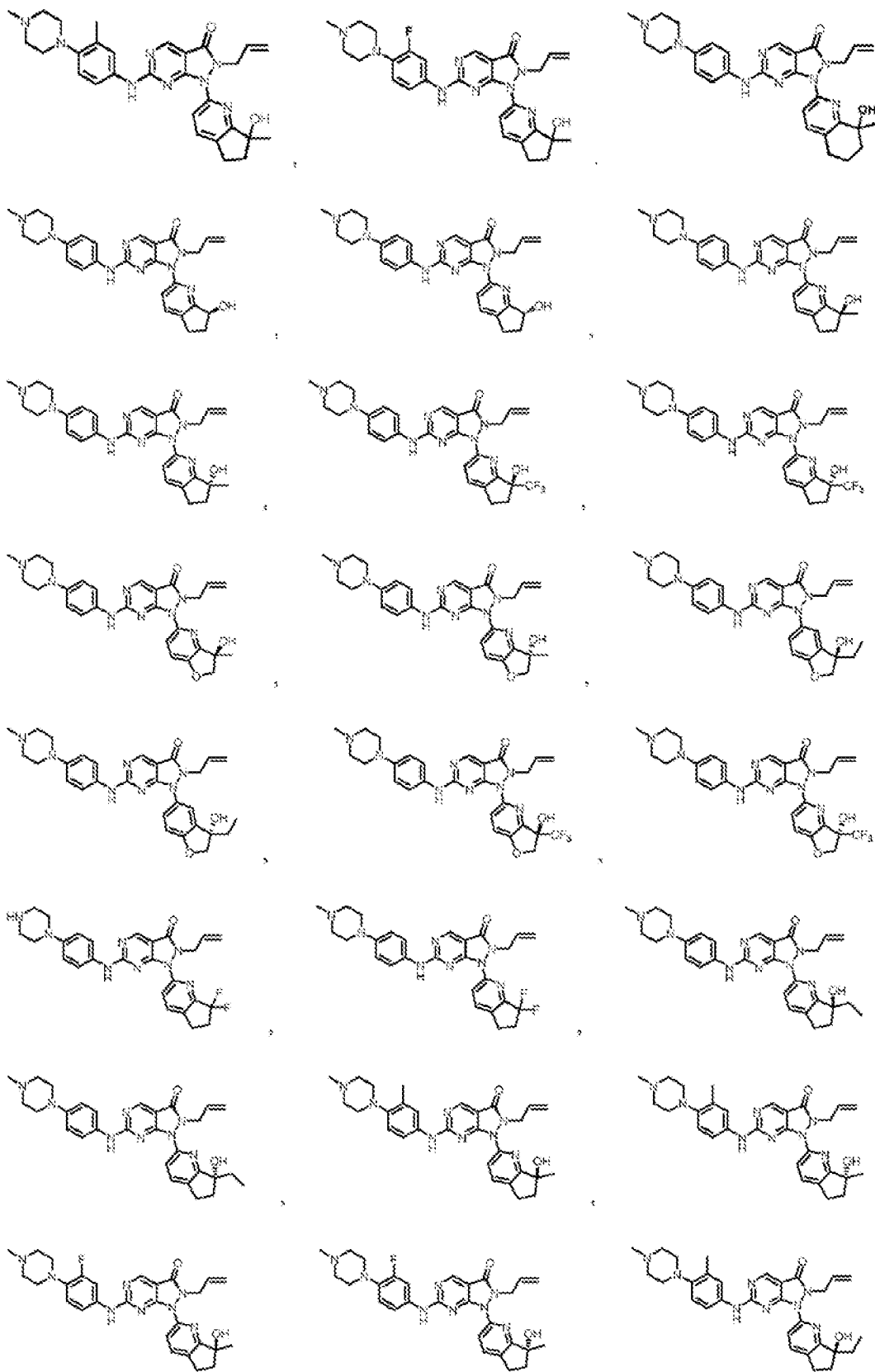
5. Spoj prema prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1-4, **naznačen time, da** R^2 je

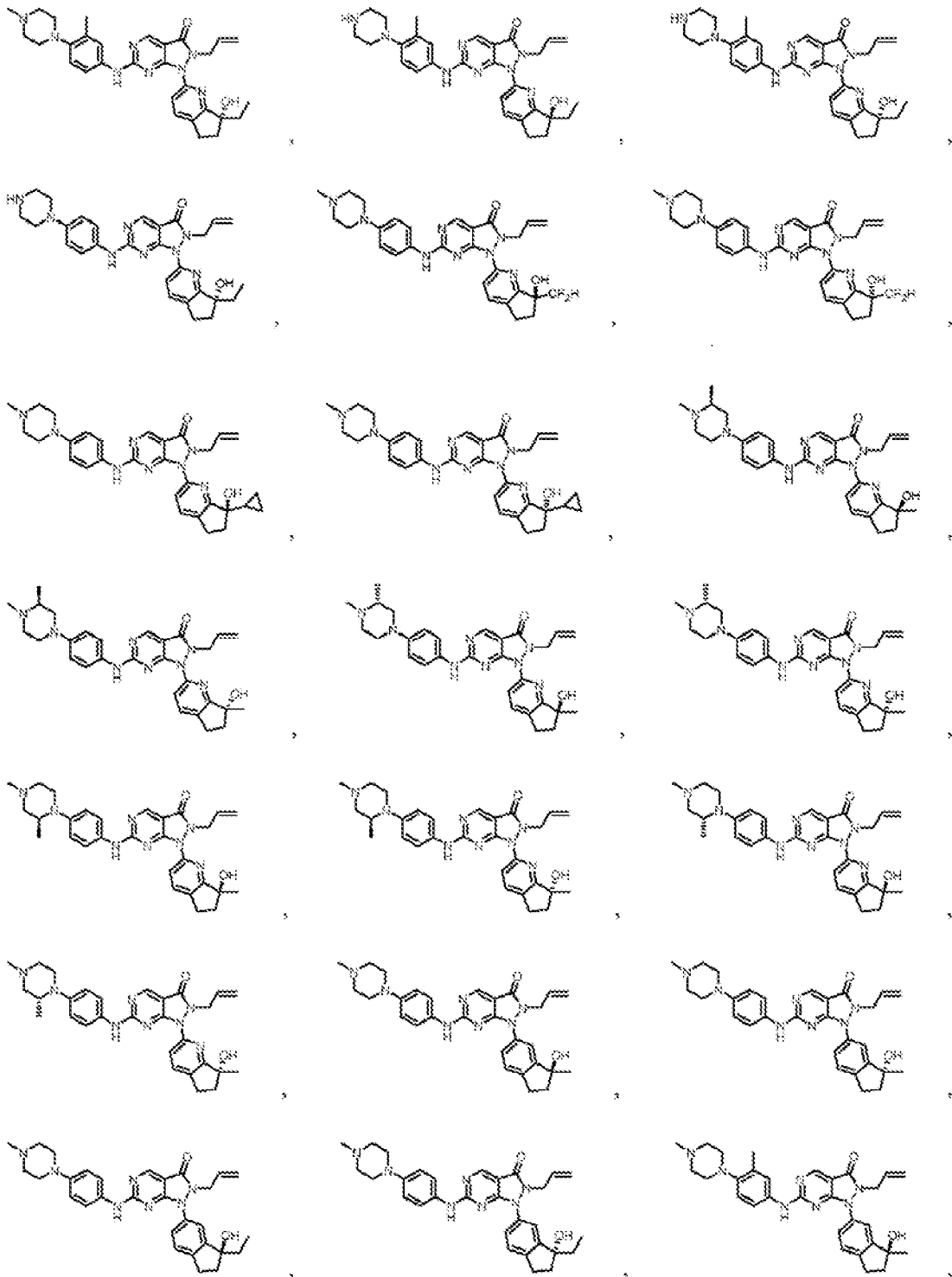


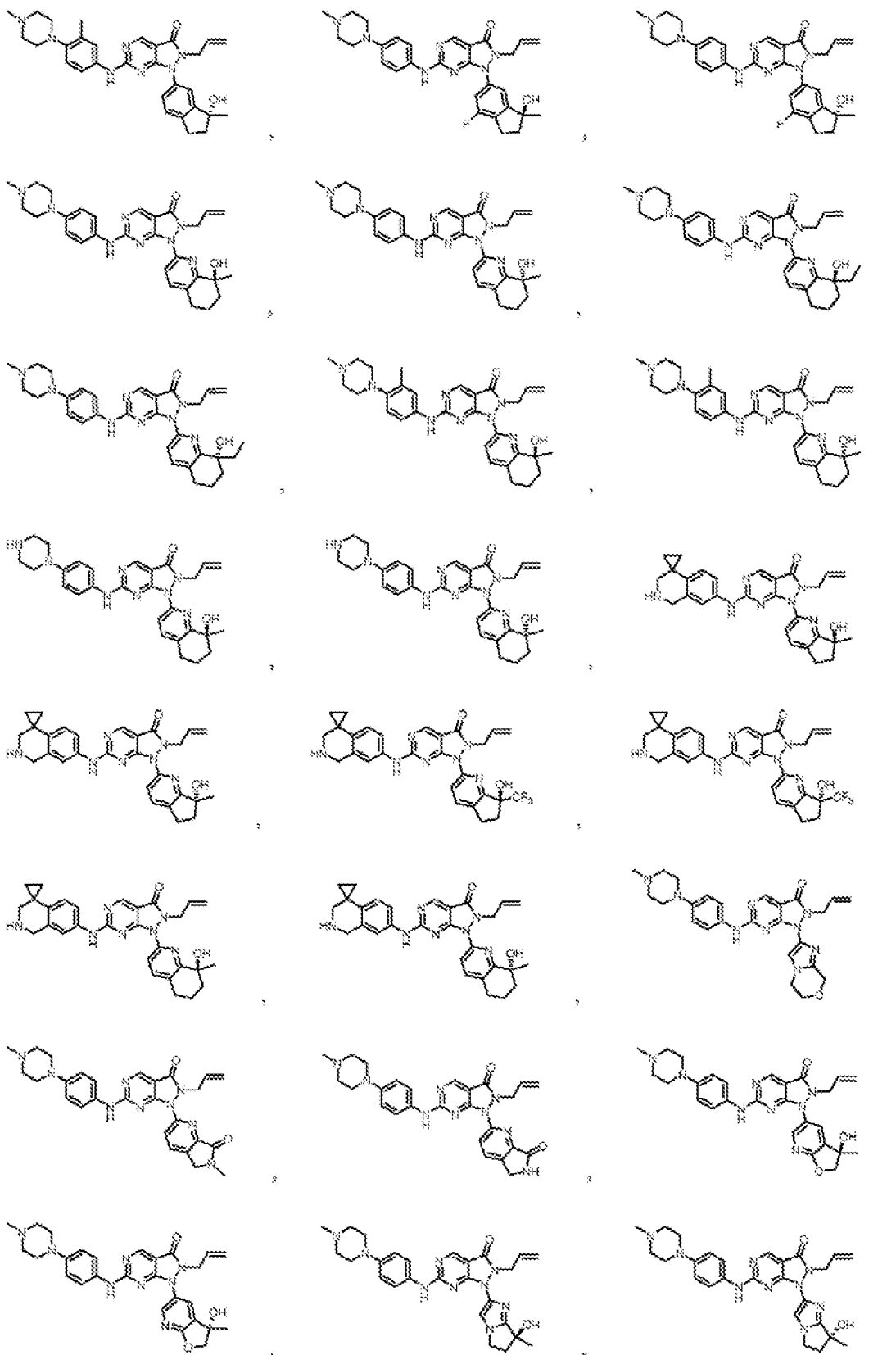
gdje poželjno m je 0.

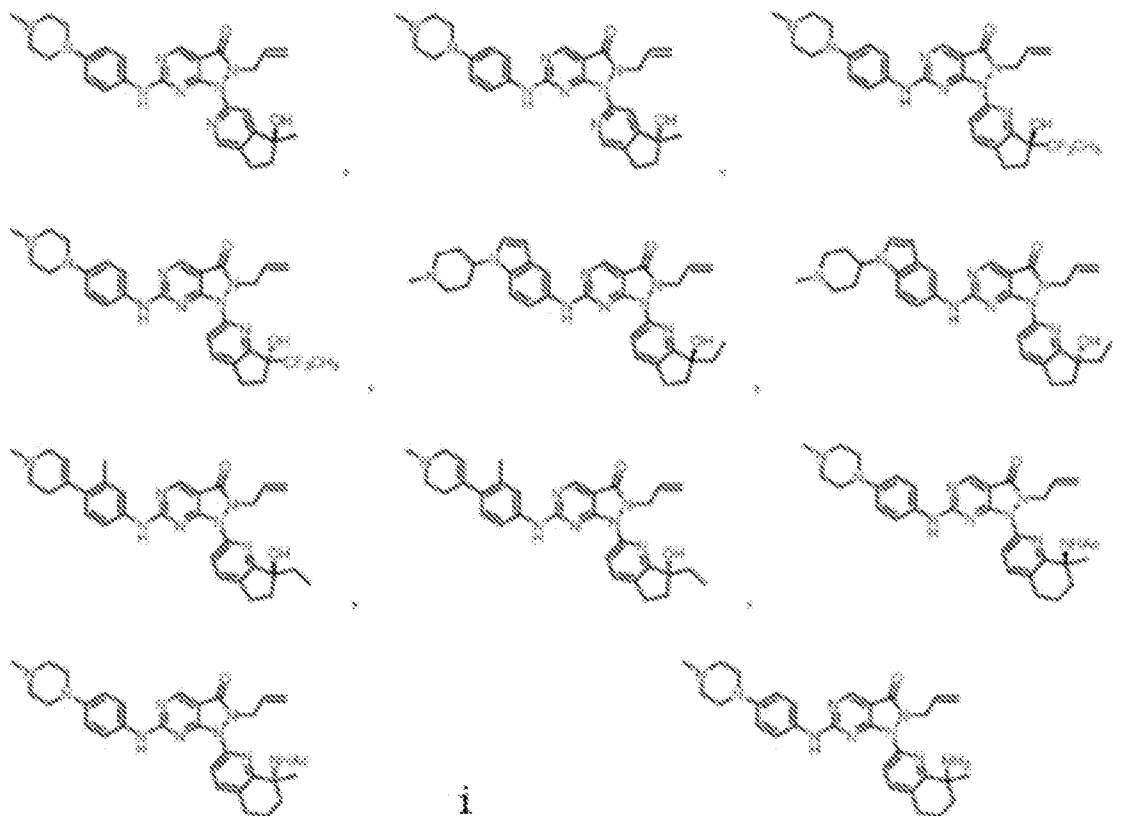
6. Spoj prema patentnom zahtjevu 5, **naznačen time, da** Y je CH ; i X je supstituirani ili nesupstituirani 4-6-člani monociklički heterociklil;
- 5 ili time, da Y je CH ; i X se bira iz skupine koju čine supstituirani ili nesupstituirani azetidin, supstituirani ili nesupstituirani oksetan, supstituirani ili nesupstituirani diazetidin, supstituirani ili nesupstituirani azaoksetan, supstituirani ili nesupstituirani pirolidin, supstituirani ili nesupstituirani tetrahidrofur, supstituirani ili nesupstituirani imidazolin, supstituirani ili nesupstituirani pirazolidin, supstituirani ili nesupstituirani piperidin, supstituirani ili nesupstituirani tetrahidropiran, supstituirani ili nesupstituirani piperazin, supstituirani ili nesupstituirani morfolin, i supstituirani ili nesupstituirani dioksan;
- 10 ili time, da Y je CH ; i X je supstituirani 4-6-člani monociklički heterociklil; ili time, da Y je CH ; i X se bira iz skupine koju čine supstituirani azetidin, supstituirani oksetan, supstituirani diazetidin, supstituirani azaoksetan, supstituirani pirolidin, supstituirani tetrahidrofur, supstituirani imidazolin, supstituirani pirazolidin, supstituirani piperidin, supstituirani tetrahidropiran, supstituirani piperazin, supstituirani morfolin, i supstituirani dioksan;
- 15 ili time, da Y je CH ; i X je supstituirani 4-6-člani monociklički heterociklil supstituiran s 1 ili 2 supstituenta neovisno odabrana iz skupine koju čine fluor, nesupstituirani C_1-C_6 alkil, nesupstituirani C_1-C_6 hidroksialkil, nesupstituirani amin(C_1-C_6 alkil), i nesupstituirani (C_1-C_6 alkil)acil;
- 20 ili time, da Y je CH ; i X je se bira iz skupine koju čine supstituirani azetidin, supstituirani oksetan, supstituirani diazetidin, supstituirani azaoksetan, supstituirani pirolidin, supstituirani tetrahidrofur, supstituirani imidazolin, supstituirani pirazolidin, supstituirani piperidin, supstituirani tetrahidropiran, supstituirani piperazin, supstituirani morfolin, i supstituirani dioksan, gdje je azetidin, oksetan, diazetidin, azaoksetan, pirolidin, tetrahidrofur, imidazolin, pirazolidin, piperidin, tetrahidropiran, piperazin, morfolin, i dioksan, supstituiran s 1 ili 2 supstituenta
- 25 neovisno odabrana iz skupine koju čine fluor, nesupstituirani C_1-C_6 alkil, nesupstituirani C_1-C_6 hidroksialkil, nesupstituirani amin(C_1-C_6 alkil), i nesupstituirani (C_1-C_6 alkil)acil.
7. Spoj prema patentnom zahtjevu 1, **naznačen time, da** se bira iz skupine koja se sastoji od:





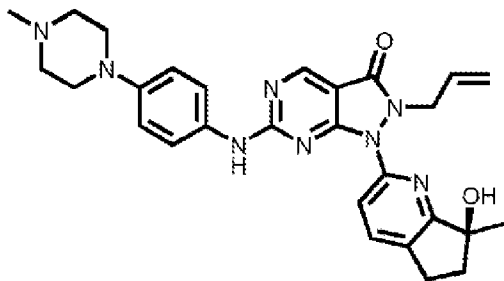






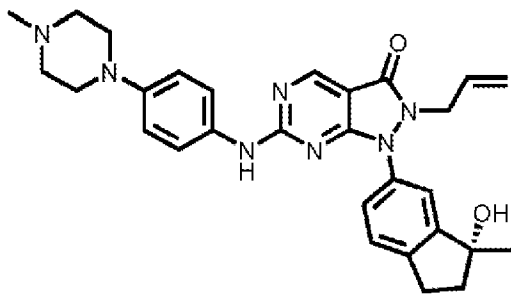
ili farmaceutske prihvatljive soli od bilo kojega od prethodno navedenih.

8. Spoj prema patentnom zahtjevu 7, **naznačen time, da** spoj je



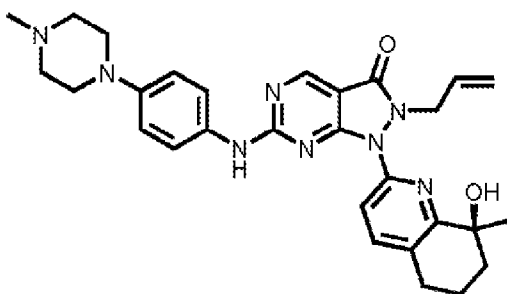
- 5 ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol.

9. Spoj prema patentnom zahtjevu 7, **naznačen time, da** spoj je



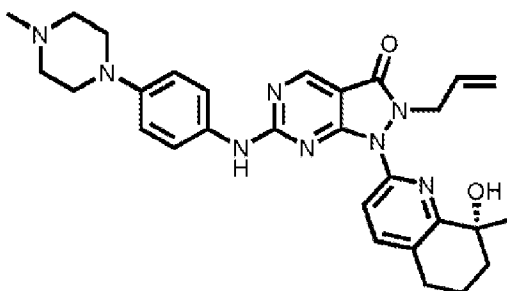
ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol.

10. Spoj prema patentnom zahtjevu 7, **naznačen time, da** spoj je



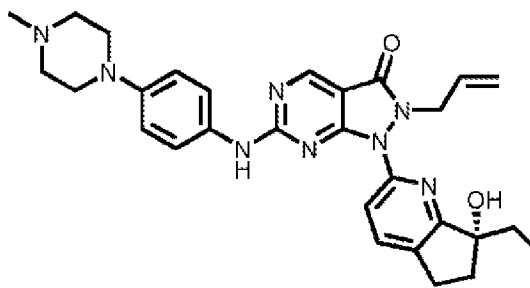
ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

11. Spoj prema patentnom zahtjevu 7, **naznačen time, da** spoj je



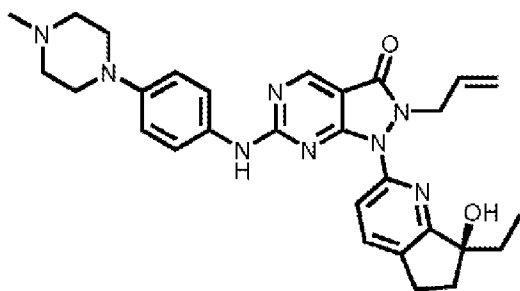
ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

12. Spoj prema patentnom zahtjevu 7, **naznačen time, da** spoj je



ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

- 10 13. Spoj prema patentnom zahtjevu 7, **naznačen time, da** spoj je



ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

14. Farmaceutski pripravak, **naznačen time, da** sadrži učinkovitu količinu spoja prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1-13, ili njegove farmaceutski prihvatljive soli, i farmaceutski prihvatljiv nosač, razrjeđivač, pomoćno sredstvo ili njihovu kombinaciju.
15. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1-13, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, ili farmaceutski pripravak prema patentnom zahtjevu 14, **naznačen time, da** je za uporabu u ublažavanju ili liječenju raka, pri čemu se rak bira od sljedećih: rak mozga, cervikocerebralni rak, rak jednjaka, rak štitnjače, rak malih stanica, rak ne-malih stanica, rak dojke, rak pluća, rak abdomena, rak žučnjaka/žučnog kanala, rak jetre, rak gušterače, rak debelog crijeva, rektalni rak, rak jajnika, horiokarcinom, rak tijela maternice, uterocervikalni rak, rak bubrežne zdjelice/uretera, rak mokraćnog mjehura, rak prostate, rak penisa, rak testisa, rak fetusa, Wilmsov rak, rak kože, maligni melanom, neuroblastom, osteosarkom, Ewingov tumor, sarkom mekih dijelova, akutna leukemija, kronična limfna leukemija,

kronična mijelocitna leukemija, policitemija vera, maligni limfom, multipli mijelom, Hodgkinov limfom, i ne-Hodgkinov limfom.

- 5 16. Spoj prema prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1-13, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, ili farmaceutske pripravak prema patentnom zahtjevu 14, **naznačen time, da** je za uporabu u inhibiranju replikacije malignog rasta ili tumora, pri čemu maligni rast ili tumor nastaje zbog raka koji se bira od sljedećih: rak mozga, cervikocerebralni rak, rak jednjaka, rak štitnjače, rak malih stanica, rak ne-malih stanica, rak dojke, rak pluća, rak abdomena, rak žučnjaka/žučnog kanala, rak jetre, rak gušterače, rak debelog crijeva, rektalni rak, rak jajnika, horiokarcinom, rak tijela maternice, uterocervikalni rak, rak bubrežne zdjelice/uretera, rak mokraćnog mjehura, rak prostate, rak penisa, rak testisa, rak fetusa, Wilmsov rak, rak kože, maligni melanom, neuroblastom, osteosarkom, Ewingov tumor, sarkom mekih dijelova, akutna leukemija, kronična limfna leukemija, kronična mijelocitna leukemija, policitemija vera, maligni limfom, multipli mijelom, Hodgkinov limfom, i ne-Hodgkinov limfom.
- 10
- 15 17. Spoj prema prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1-13, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, ili farmaceutske pripravak prema patentnom zahtjevu 14, **naznačen time, da** je za uporabu u ublažavanju ili liječenju malignog rasta ili tumora, pri čemu maligni rast ili tumor nastaje zbog raka koji se bira od sljedećih: rak mozga, cervikocerebralni rak, rak jednjaka, rak štitnjače, rak malih stanica, rak ne-malih stanica, rak dojke, rak pluća, rak abdomena, rak žučnjaka/žučnog kanala, rak jetre, rak gušterače, rak debelog crijeva, rektalni rak, rak jajnika, horiokarcinom, rak tijela maternice, uterocervikalni rak, rak bubrežne zdjelice/uretera, rak mokraćnog mjehura, rak prostate, rak penisa, rak testisa, rak fetusa, Wilmsov rak, rak kože, maligni melanom, neuroblastom, osteosarkom, Ewingov tumor, sarkom mekih dijelova, akutna leukemija, kronična limfna leukemija, kronična mijelocitna leukemija, policitemija vera, maligni limfom, multipli mijelom, Hodgkinov limfom, i ne-Hodgkinov limfom.
- 20