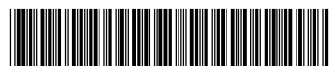




(19) REPUBLIKA HRVATSKA  
DRŽAVNI ZAVOD ZA  
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator  
dokumenta:



HR P20130252 T1

HR P20130252 T1

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

(51) MKP:

**C07D 401/14** (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 30.04.2013.

(21) Broj predmeta: P20130252T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 21.03.2013.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2008063819  
Datum podnošenja međunarodne prijave: 16.05.2008.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 08755632.0  
Datum podnošenja europske prijave patenta: 16.05.2008.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2008144463  
Datum međunarodne objave: 27.11.2008.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2162131 A1  
Datum objave europske prijave patenta: 17.03.2010.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2162131 B1  
Datum objave europskog patenta: 06.03.2013.

(31) Broj prve prijave: 938761 P

(32) Datum podnošenja prve prijave: 18.05.2007.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelj patenta:

**GlaxoSmithKline LLC, One Franklin Plaza, 200 North 16th Street,  
Philadelphia, 19102 PA, US**

(72) Izumitelji:

**Nicholas D. Adams, 1250 South Collegeville Road, Collegeville, 19426  
PA, US**

**Joelle Lorraine Burgess, 1250 South Collegeville Road, Collegeville,  
19426 PA, US**

**Michael Gerard Darcy, 1250 South Collegeville Road, Collegeville, 19426  
PA, US**

**Carla A. Donatelli, 1250 South Collegeville Road, Collegeville, 19426 PA,  
US**

**Steven David Knight, 1250 South Collegeville Road, Collegeville, 19426  
PA, US**

**Kenneth Allen Newlander, 1250 South Collegeville Road, Collegeville,  
19426 PA, US**

**Lance Ridgers, 1250 South Collegeville Road, Collegeville, 19426 PA, US**

**Martha Sarpong, 1250 South Collegeville Road, Collegeville, 19426 PA,  
US**

**Stanley J. Schmidt, 1250 South Collegeville Road, Collegeville, 19426  
PA, US**

(74) Zastupnik:

**Graste & Partneri odvjetničko društvo, 10000 Zagreb, HR**

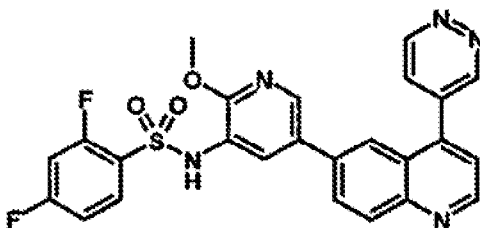
(54) Naziv izuma:

**DERIVATI KINOLINA KAO INHIBITORI KINAZE PI3**

HR P20130252 T1

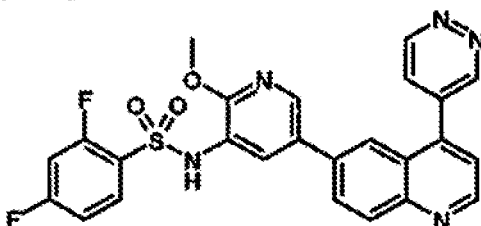
## PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Spoj, **naznačen time** što je 2,4-difluor-*N*-{2-(metiloksi)-5-[4-(4-piridazinil)-6-kinolinil]-3-piridinil} benzensulfonamid



ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

2. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što je 2,4-difluor-*N*-{2-(metiloksi)-5-[4-(4-piridazinil)-6-kinolinil]-3-piridinil} benzensulfonamid



3. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi u medicinskoj terapiji.
4. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi u inhibiranju jedne ili više fosfatoinozitid-3-kinaza (PI3K) kod ljudi.
5. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi u liječenju jednog ili više bolesnih stanja, koja se bira iz skupine koju čine: autoimuni poremećaji, upalne bolesti, kardiovaskularne bolesti, neurodegenerativne bolesti, alergija, astma, pankreatitis, insuficijencija više organa, bolesti bubrega, agregacija trombocita, rak, pokretljivost sperme, odbacivanje transplantacije, odbacivanje presatka i ozljede pluća, kod ljudi.
6. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1 i/ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol i najmanje jedno antineoplastično sredstvo, poput onog koje se bira iz skupine koju čine antimikrotubulska sredstva, koordinacijski kompleksi platine, alkilirajuća sredstva, antibiotska sredstva, inhibitori topoizomeraze II, antimetaboliti, inhibitori topoizomeraze I, hormoni i hormonski analozi, inhibitori puta prijenosa signala, inhibitori nereguliranih tirozinskih kinaza kao inhibitori angiogeneze, imunoterapijska sredstva, proapoptotska sredstva, i inhibitori signala staničnog ciklusa, **naznačeni time** što su namijenjeni zajedničkoj primjeni u liječenju raka.
7. Spoj namijenjen upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 5, **naznačen time** što se bolesno stanje bira iz skupine koju čine: multipla skleroza, psorijaza, reumatoidni artritis, sistemni eritematozni lupus, upalna bolest crijeva, upala pluća, tromboza, infekcija/upala mozga, meningitis i encefalitis.
8. Spoj namijenjen upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 5, **naznačen time** što se bolesno stanje bira iz skupine koju čine: Alzheimerova bolest, Huntingtonova bolest, ozljeda CNS-a, inzult i ishemična stanja.
9. Spoj namijenjen upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 5, **naznačen time** što se bolesno stanje bira iz skupine koju čine: ateroskleroza, hipertrofija srca, disfunkcija kardiomiocita, povišeni krvni tlak i vazokonstrikcija.
10. Spoj namijenjen upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 5, **naznačen time** što se bolesno stanje bira iz skupine koju čine: kronična opstruktivna plućna bolest, anafilaktički šok, fibroza, psorijaza, alergijske bolesti, astma, inzult, ishemija-reperfuzija, agregacija/aktivacija trombocita, atrofija/hipertrofija skeletnih mišića, novačenje leukocita u tkivu raka, angiogeneza, invazivna metastaza, melanom, Kaposijev sarkom, akutne i kronične bakterijske i virusne infekcije, sepsa, odbacivanje transplantacije, odbacivanje presatka, glomeruloskleroza, glomerulonefritis, progresivna fibroza bubrega, ozljede endotela i epitela u plućima, te upala dišnih putova pluća.
11. Spoj namijenjen upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 5, **naznačen time** što bolest je rak.
12. Spoj namijenjen upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 11, **naznačen time** što se rak bira iz skupine koju čine: rak mozga (gliomi), glioblastomi, leukemije, Bannayan-Zonarin sindrom, Cowdenova bolest, Lhermitte-Duclosova bolest, rak dojke, upalni rak dojke, Wilmsov tumor, Ewingov sarkom, rabdomiosarkom, ependimom, meduloblastom, tumor debelog crijeva, rak glave i vrata, rak bubrega, rak pluća, rak jetre, melanom, rak jajnika, rak gušterače, rak prostate, sarkom, osteosarkom, tumor gigantskih stanica kosti i rak štitnjače.
13. Spoj namijenjen upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 11, **naznačen time** što se rak bira iz skupine koju čine: rak jajnika, rak gušterače, rak dojke, rak prostate i leukemija.

14. Upotreba spoja u skladu s patentnim zahtjevom 1, ili njegove farmaceutske prihvatljive soli, **naznačena time** što je spoj namijenjen proizvodnji medikamenta namijenjenog upotrebi u liječenju jednog ili više bolesnih stanja, koja se bira iz skupine koju čine: autoimuni poremećaji, upalne bolesti, kardiovaskularne bolesti, neurodegenerativne bolesti, alergija, astma, pankreatitis, insuficijencija više organa, bolesti bubrega, agregacija trombocita, rak, pokretljivost sperme, odbacivanje transplantacije, odbacivanje presatka i ozljede pluća, kod ljudi.
15. Spoj namijenjen upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 4, **naznačen time** što je navedena PI3 kinaza PI3K $\alpha$ .
16. Spoj namijenjen upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 4, **naznačen time** što je navedena PI3 kinaza PI3K $\gamma$ .
17. Spoj namijenjen upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 4, **naznačen time** što je navedena PI3 kinaza PI3K $\delta$ .
18. Spoj namijenjen upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 5, **naznačen time** što se spoj, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, primjenjuje u farmaceutskom pripravku.
19. Farmaceutski pripravak, **naznačen time** što sadrži spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, ili njegovu farmaceutske prihvatljivu sol, i farmaceutske prihvatljivu podlogu.