



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20230854 T1

HR P20230854 T1

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

(51) MKP:

A61K 47/54 (2017.01)
A61K 47/64 (2017.01)
A61K 31/337 (2006.01)
A61K 31/4155 (2006.01)
A61K 31/4375 (2006.01)
A61K 31/4545 (2006.01)
A61K 31/517 (2006.01)
A61K 31/519 (2006.01)
A61K 31/69 (2006.01)
A61K 31/704 (2006.01)
A61K 31/7068 (2006.01)
A61P 29/00 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 10.11.2023.

(21) Broj predmeta: P20230854T

(22) Datum podnošenja : 15.06.2015.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2015035798
Datum podnošenja međunarodne prijave: 15.06.2015.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 15807049.0
Datum podnošenja europske prijave patenta: 15.06.2015.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2015192123
Datum međunarodne objave: 17.12.2015.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3154594 A1
Datum objave europske prijave patenta: 19.04.2017.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3154594 B1
Datum objave europskog patenta: 19.07.2023.

(31) Broj prve prijave: 201462011989 P (32) Datum podnošenja prve prijave: 13.06.2014. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US
201462051033 P 16.09.2014. US

(73) Nositelj patenta: **Bach Biosciences, LLC, 31 Echo Landing, Moultonborough, NH 03254, US**

(72) Izumitelji: **William W. Bachovchin, 75 Cambridge Parkway, Apt. E609, Cambridge, MA 02142, US**
Hung-Sen Lai, 11 Seten Circle, Andover, MA 01810, US
David G. Sanford, 52 Hopkins Street, Reading, MA 01867, US
Sarah E. Poplawski, 107 Beech Street, Unit 3, Belmont, MA 02478, US
Wengen Wu, 28 Ninth Street 508, Medford, MA 02155, US

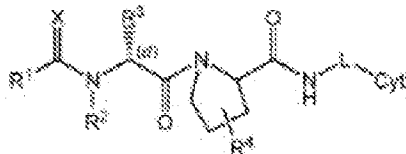
(74) Zastupnik: **ZMP IP d.o.o., 10000 Zagreb, HR**

(54) Naziv izuma: **FAP-AKTIVIRANA TERAPEUTSKA SREDSTVA I S NJIMA POVEZANE UPORABE**

HR P20230854 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Predlijeak predstavljen općom formulom



ili njegova farmaceutska prihvatljiva sol, pri čemu:

R¹ predstavlja (C₁-C₁₀)alkil, (C₁-C₁₀)alkoksi, (C₁-C₁₀)alkil-C(O)-(C₁-C₁₀)alkil, (C₃-C₈)cikloalkil, (C₃-C₈)cikloalkil(C₁-C₁₀)alkil, aril, aril(C₁-C₁₀)alkil, heteroaril ili heteroaril(C₁-C₁₀)alkil, pri čemu je bilo koji R¹ izbornu supstituiran s jednim ili više supstituenata neovisno odabranih iz skupine koju čine halo, hidroksi, karboksilat, cijano, amino, nitro i tio (-SH);

R² predstavlja H ili (C₁-C₆)alkil;

R³ predstavlja (C₁-C₆)alkil;

R⁴ je odsutan ili predstavlja (C₁-C₆)alkil, -OH, -NH₂ ili jedan ili dva halogena;

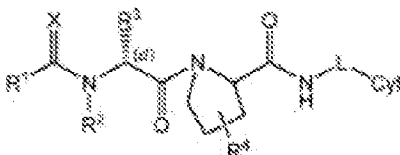
X predstavlja O ili S;

Cyt' predstavlja antraciklinski dio; i

L predstavlja vezu ili -N(H)-L predstavlja samospaljivi linker koji se metabolizira nakon cijepanja FAP-a kako bi se oslobodio antraciklinski dio,

pri čemu se prolijeak selektivno pretvara u aktivni antraciklin pomoću FAP⁺ stromalnih stanica.

2. Predlijeak predstavljen općom formulom



ili njegova farmaceutska prihvatljiva sol, gdje:

R¹ predstavlja heteroaril, izbornu supstituiran s jednim ili više supstituenata neovisno odabranih između skupina koju čine halo, hidroksi, karboksilat, cijano, amino, nitro i tio (-SH);

R² predstavlja H ili (C₁-C₆)alkil;

R³ je metil;

R⁴ je odsutan;

X je O;

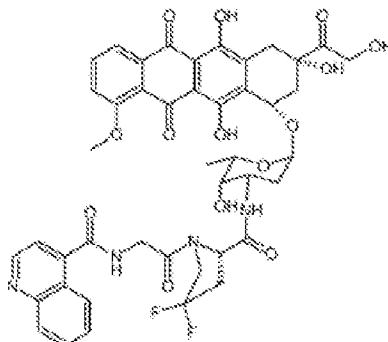
Cyt' predstavlja antraciklinski dio; i

L predstavlja vezu ili -N(H)-L predstavlja samospaljivi linker koji se metabolizira nakon cijepanja FAP-a u oslobađanju antraciklinskog dijela,

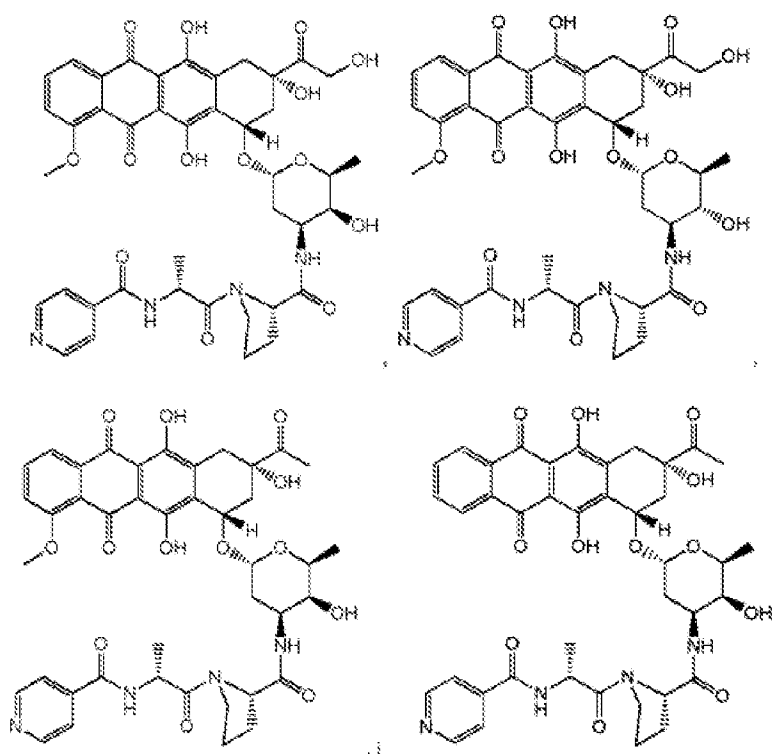
pri čemu se prolijeak selektivno pretvara u aktivni antraciklin pomoću FAP⁺ stromalnih stanica.

3. Predlijeak prema bilo kojem od zahtjeva 1 ili 2, naznačen time, da je L samospaljivi linker koji sadrži heterocikl, po izboru gdje je samospaljivi linker odabran iz grupe koju čine His-Ala, *p*-aminobenziloksikarbonil (PA-BC), i 2,4-bis(hidroksimetil)anilin.

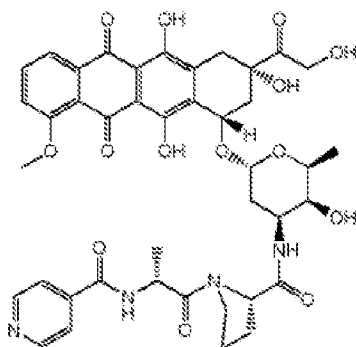
4. Predlijeak predstavljen formulom:



5. Predlijeak odabran iz skupine koju čine:



6. Predlijek prema zahtjevu 5 koji ima sljedeću strukturu:



7. Farmaceutski pripravak, sadrži predlijek prema bilo kojem od prethodnih zahtjeva, ili njegovu farmaceutski prihvatljivu sol; i farmaceutski prihvatljiv nosač.
8. Spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 6, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, koji se koristi u postupku liječenja poremećaja **naznačenog** porastom fibroblastnog aktivacijskog proteina (FAP).
9. Spoj za upotrebu prema zahtjevu 8, poremećaj **naznačen** porastom FAP odabranog iz skupine koju čine rak, fibroza i upala.