



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20160305 T1

HR P20160305 T1

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

(51) MKP:

C07F 5/02 (2006.01)

C07F 5/04 (2006.01)

A61K 31/69 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 01.07.2016.

(21) Broj predmeta: P20160305T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 24.03.2016.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2011056844
Datum podnošenja međunarodne prijave: 19.10.2011.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 11779904.9
Datum podnošenja europske prijave patenta: 19.10.2011.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2012058065
Datum međunarodne objave: 03.05.2012.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2632927 A1
Datum objave europske prijave patenta: 04.09.2013.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2632927 B1
Datum objave europskog patenta: 10.02.2016.

(31) Broj prve prijave: 406760 P

(32) Datum podnošenja prve prijave: 26.10.2010.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelji:

Mars, Incorporated, 6885 Elm Street, McLean, VA 22101, US
Michael Van Zandt, c/o Mars Incorporated, 6885 Elm Street, McLean, VA 22101, US
Gunnar Erik Jagdmann, c/o Mars Incorporated, 6885 Elm Street, McLean, VA 22101, US

(74) Zastupnik:

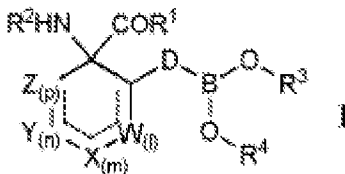
mr.sc. Gordana Turkalj, dipl. ing.kem.tehn. & Tatjana Sučić, dipl. ing., Callidea d.o.o., 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma: **BORATI KAO INHIBITORI ARGINAZE**

HR P20160305 T1

PATENTNI ZAHTEVI

1. Spoj formule I,



naznačen time da,

R¹ je odabran iz skupine koju čine -OH, OR^a, i NR^bR^c;

R^a je odabran iz skupine koju čine vodik, ravnolančani ili razgranati (C₁-C₆)alkil, (C₃-C₈)cikloalkil, (C₃-C₁₄)aril, (C₃-C₁₄)heterocikloalkil-(C₁-C₆)alkilen-, (C₃-C₁₄)heteroaril-(C₁-C₆)alkilen-, i (C₃-C₁₄)aril(C₁-C₆)alkilen-;

R^b i R^c su svaki neovisno odabrani iz skupine koju čine H, -OH, ravnolančani ili razgranati (C₁-C₆)alkil, -SO₂-(C₁-C₆)alkil, (C₃-C₁₄)aril-SO₂-, (C₃-C₁₄)heterocikloalkil-(C₁-C₆)alkilen-, i (C₃-C₁₄)heteroaril-(C₁-C₆)alkilen-;

R² je odabran iz skupine koju čine H, ravnolančani ili razgranati (C₁-C₆)alkil, i (C₁-C₆)alkil-C(O)-;

W, X, Y, i Z su svaki neovisno odabrani iz skupine koju čine veza, -C(R'')(R''')-, -C(R'')₂-, -CR''-, -NR''-, -N-, -O-, -C(O)-, i -S-, pri čemu ne više od tri od W, X, Y, i Z istovremeno predstavlja vezu;

i dva susjedna člana od W, X, Y, i Z nisu istovremeno -O-, -S-, -N-, ili -NR''-;

l, m, n i p su neovisno cijeli brojevi između 0 i 2 uključivo, pri čemu najmanje jedan od l, m, n, ili p nije 0;



po izboru predstavlja jednu ili više dvostrukih veza;

R³ i R⁴ su svaki neovisno odabrani između vodik, ravnolančani ili razgranati (C₁-C₆)alkil, i C(O)-R⁵,

ili R³ i R⁴ zajedno s atomom bora, na koji su vezani tvore 5- ili 6-člani prsten koji je potpuno zasićen ili djelomično zasićen;

D je odabran iz skupine koju čine ravnolančani ili razgranati (C₃-C₅)alkilen, ravnolančani ili razgranati (C₂-C₈)alkenilen, ravnolančani ili razgranati (C₂-C₈)alkinilen, (C₃-C₁₄)arilen, i (C₃-C₁₄)cikloalkilen, pri čemu se jedna ili više -CH₂- skupina u D po izboru i neovisno zamjenjuje sa skupinom izabranom iz grupe koja se sastoji od O, NR⁶, S, SO, SO₂, i CR⁶R⁷; ili

pri čemu bilo koje dvije susjedne -CH₂- skupine po izboru predstavljaju dva člana (C₃-C₁₄)-cikloalkilenil skupine; i pri čemu dvije susjedne -CH₂- skupine istovremeno ne predstavljaju O, NR⁶, S, SO, ili SO₂;

R⁶, R⁷ i R⁸ su svaki neovisno odabrani iz skupine koju čine H, OH, S(O)R^d, S(O)₂R^d, (C₁-C₈)alkil, (C₃-C₆)aril, -NH₂, -NH(C₁-C₆)alkil, -N[(C₁-C₆)alkil]₂, -C(O)NR^dR^e, -C(O)(C₁-C₆)alkil, -C(O)(C₃-C₁₄)aril, -C(O)O(C₁-C₆)alkil, -C(O)O(C₃-C₁₄)aril, (C₃-C₆)cikloalkil, (C₃-C₁₄)heterocikloalkil, -C(O)(C₃-C₁₄)heterocikloalkil, (C₃-C₁₄)heteroaril, (C₃-C₁₄)aril-(C₁-C₆)alkilen-, -C(O)(C₃-C₁₄)aril-(C₁-C₆)alkilen-, -C(O)(C₃-C₁₄)aril, (C₃-C₆)cikloalkil-(C₁-C₆)alkilen-, (C₃-C₁₄)heteroaril-(C₁-C₆)alkilen-, (C₃-C₁₄)heterociklil-(C₁-C₆)alkilen-;

i

pri čemu je svaki alkil, alkilen, aril, heteroaril, cikloalkil ili heterocikloalkil po izboru supstituiran s jednim ili više članova odabranih iz skupine koju čine halogen, okso, -COOH, -CN, -NO₂, -OH, -NR^dR^e, -NR^eS(O)₂R^h, (C₁-C₆)alkoksi, (C₃-C₁₄)aril, (C₁-C₆)haloalkil i (C₃-C₁₄)ariloksi;

pri čemu su R^d, R^e, R^f, i R^h svaki neovisno izabrani iz skupine koju čine H, ravnolančani ili razgranati (C₁-C₆)alkil, po izboru supstituiran (C₃-C₁₄)aril(C₁-C₆)alkilen-, po izboru supstituiran (C₃-C₁₄)aril, (C₁-C₆)hidroksialkil, (C₁-C₆)aminoalkil, H₂N(C₁-C₆)alkilen-, po izboru supstituiran (C₃-C₆)cikloalkil, po izboru supstituiran (C₃-C₁₄)heterocikloalkil, po izboru supstituiran (C₃-C₁₄)heteroaril, po izboru supstituiran (C₃-C₁₄)aril-(C₁-C₆)alkilen-, NR⁶R⁷C(O)-, i (C₃-C₆)aril-(C₃-C₁₄)-cikloalkilen-,

ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, stereoizomer ili tautomer;

uz uvjet da spoj prema Formuli I nije 1-amino-2-(3-borpropil)cikloheksan karboksilna kiselina.

2. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time** da D je ravnolančani ili razgranati (C₃-C₅)alkilen.

3. Spoj prema zahtjevu 2, **naznačen time** da D je propilen.

4. Spoj prema zahtjevu 3, **naznačen time** da R¹ je -OH.

5. Spoj prema zahtjevu 4, **naznačen time** da svaki od R², R³ i R⁴ je vodik.

6. Spoj prema zahtjevu 5, **naznačen time** da svaki od W, X, Y i Z je -C(R'')₂-.

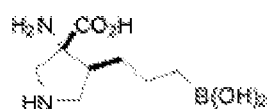
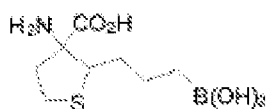
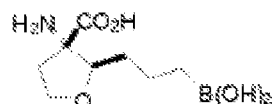
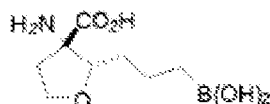
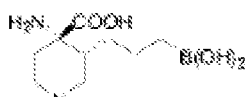
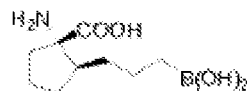
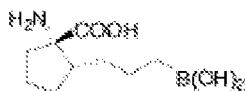
7. Spoj prema zahtjevu 6, **naznačen time** da R''' je H.

8. Spoj prema zahtjevu 7, **naznačen time** da $l + m + n + p = 3$ ili 4.
9. Spoj prema zahtjevu 5, **naznačen time** da svaki od W, X, Y i Z je -NH- a svaki od preostalih troje je $-C(R''')_2$.
10. Spoj prema zahtjevu 5, **naznačen time** da svaki od W, X, Y i Z je -N- a svaki od preostalih troje je $-CR'''$ -,



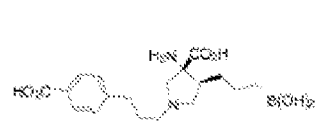
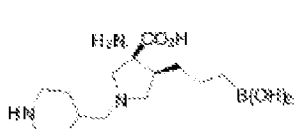
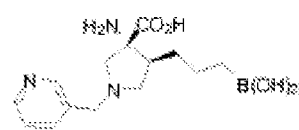
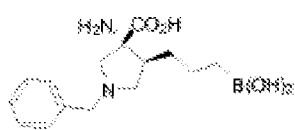
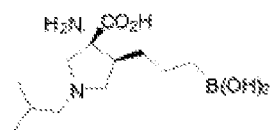
je prisutan i predstavlja jednu ili više dvostrukih veza.

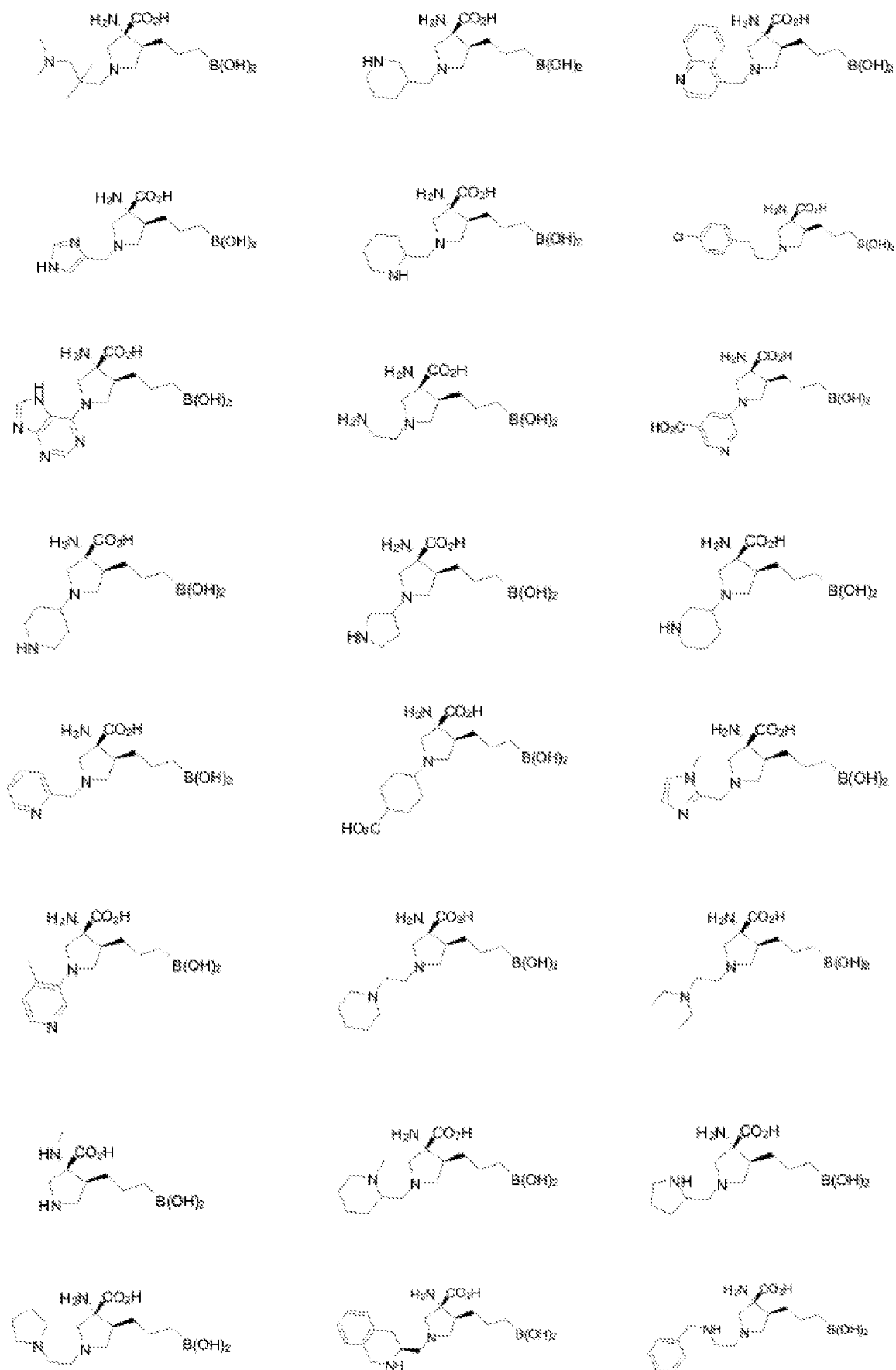
11. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time** da je izabran iz sljedeće tablice:

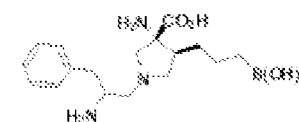
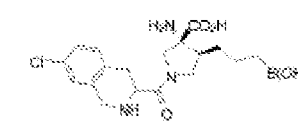
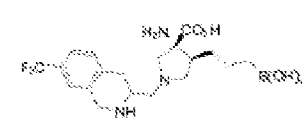
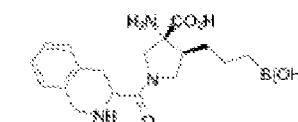
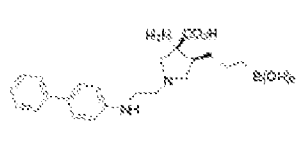
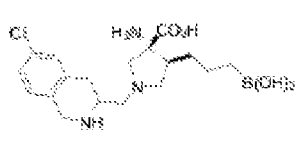
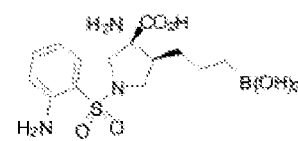
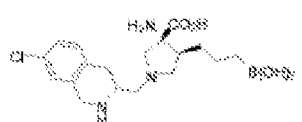
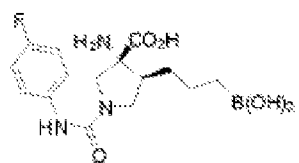
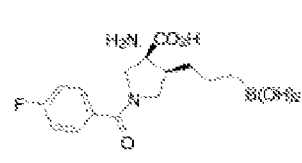
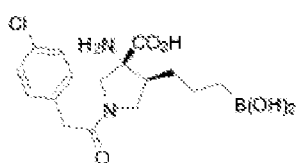
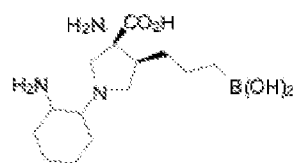
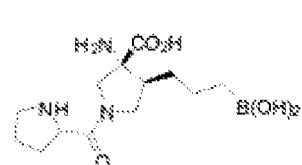
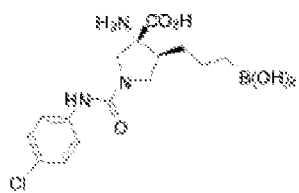
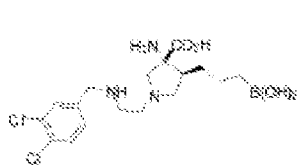


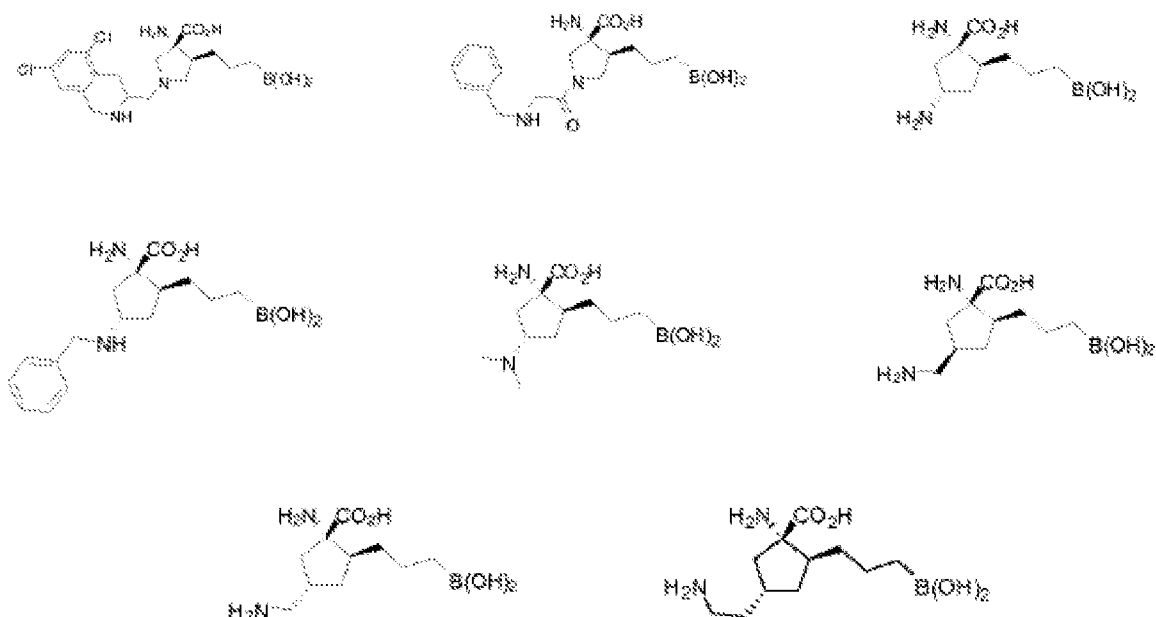
10

12. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time** da je izabran iz sljedeće tablice:









13. Farmaceutski pripravak koji sadrži terapijski djelotvornu količinu barem jednog spoja prema bilo kojem od zahtjeva 1 – 12, ili njegovu farmaceutski prihvatljivu sol, stereoizomer ili tautomer; i farmaceutski prihvatljiv nosač.
- 5 14. Spoj kako je definirano u bilo kojem od zahtjeva 1 - 12 ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, stereoizomer ili tautomer za uporabu u liječenju ili prevenciji bolesti ili stanja povezanih s ekspresijom ili aktivnošću arginaze I, arginaze II, ili njihove kombinacije u subjeka.
- 10 15. Spoj za uporabu prema zahtjevu 14, **naznačen time** da je bolest ili stanje izabrano iz plućne hipertenzije, erektilne disfunkcije, hipertenzije, ateroskleroze, bubrežnih bolesti, astma, disfunkcije T-stanica, ishemično-reperfuzijskih ozljeda, neuro-degenerativnih bolesti, zacjeljivanja rana i fibroznih oboljenja.