



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20241237 T1

HR P20241237 T1

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

(51) MKP:

A61P 3/00 (2006.01)
A61P 29/00 (2006.01)
A61P 31/00 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01)
C07D 405/12 (2006.01)
C07D 413/12 (2006.01)
A61K 31/4427 (2006.01)
A61K 31/4433 (2006.01)
A61K 31/4439 (2006.01)
A61K 31/444 (2006.01)
A61K 31/4545 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 06.12.2024.

(21) Broj predmeta: P20241237T

(22) Datum podnošenja: 26.02.2020.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2020019786
Datum podnošenja međunarodne prijave: 26.02.2020.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 20714389.2
Datum podnošenja europske prijave patenta: 26.02.2020.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2020176558
Datum međunarodne objave: 03.09.2020.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3930838 A1
Datum objave europske prijave patenta: 05.01.2022.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3930838 B1
Datum objave europskog patenta: 10.07.2024.

(31) Broj prve prijave: 201962811143 P (32) Datum podnošenja prve prijave: 27.02.2019. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US
201962879852 P 29.07.2019. US

(73) Nositelj patenta: **Constellation Pharmaceuticals, Inc., 470 Atlantic Avenue, Suite 1401,
Boston, MA 02210, US**

(72) Izumitelj: **Jonathan E. Wilson, 6 Cottage Avenue, Arlington, MA 02474, US**

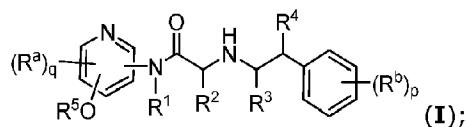
(74) Zastupnik: **PRODUCTA d.o.o., 10000 Zagreb, HR**

(54) Naziv izuma: **DERIVATI N-(PIRIDINIL)ACETAMIDA KAO INHIBITORI P300/CBP HAT I POSTUPCI ZA
NJIHOVU UPOTREBU**

HR P20241237 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

1. Spoj koji ima Formulu I:



ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, naznačen time što

R^1 , R^3 , i R^4 su svaki neovisno vodik ili C_{1-4} alkil;

R^2 je fenil ili pirazolil, od kojih je svaki izborno supstituiran s halo ili C_{1-4} alkilom;

R^5 je C_{1-6} alkil supstituiran s 4- do 6-članim heterociklilom ili 5- do 6-članim heteroarilm, pri čemu su svaki navedeni 4- do 6-člani heterociklil ili 5- do 6-člani heteroaril izborno supstituirani s 1 do 3 skupine odabrane od R^d ; ili R^5 je 4- do 6-člani heterociklil ili 5- do 6-člani heteroaril, pri čemu su svaki navedeni 4- do 6-člani heterociklil ili 5- do 6-člani heteroaril izborno supstituirani s 1 do 3 skupine odabrane od R^d ;

R^a , ako je prisutan, je C_{1-3} alkil, C_{1-3} alkoksi, halo(C_{1-3} alkil), halo C_{1-3} alkoksi, ili halo;

R^b je halo, cijano, ili $-SO_2NH_2$;

svaki R^d je neovisno halo, CN, okso, NO_2 , C_{1-6} alkil, C_{2-6} alkenil, C_{1-6} alkoksi, halo(C_{1-6} alkoksi), halo(C_{1-6} alkil), $-C_{1-6}$ alkilOR^e, $-C(O)R^f$, $-C(O)OR$, $-C_{1-6}$ alkilC(O)OR^e, $-C(O)N(R^e)_2$, $-C(O)NR^eC_{1-6}$ alkilOR^e, $-OC_{1-6}$ alkilN(R^e)₂, $-C_{1-6}$ alkilC(O)N(R^e)₂, $-C_{1-6}$ alkilN(R^e)₂, $-N(R^e)_2$, $-C(O)NR^eC_{1-6}$ alkilN(R^e)₂, $-NR^eC_{1-6}$ alkilN(R^e)₂, $-NR^eC_{1-6}$ alkilOR^e, $-SOR^e$, $-S(O)_2R^e$, $-SON(R^e)_2$, $-SO_2N(R^e)_2$, $-O(C_3-C_6)$ cikloalkil, $-O-C_{1-4}$ alkilaril, $-C_{1-6}$ alkil(C_3-C_6)cikloalkil, $-C_{1-6}$ alkilaril, $-C_{1-6}$ alkilheteroaril, $-C_{1-6}$ alkilheterociklil, (C_3-C_6)cikloalkil, heterociklil, heteroaril, ili aril, pri čemu su svaki navedeni (C_3-C_6)cikloalkil, heterociklil, aril, i heteroaril sami i u vezi sa $-O(C_3-C_6)$ cikloalkil, $-C_{1-6}$ alkil(C_3-C_6)cikloalkil, $-C_{1-6}$ alkilaril, $-C_{1-6}$ alkilheteroaril, i $-C_{1-6}$ alkilheterociklil izborno supstituirani s 1 do 3 skupine odabrane između halo, C_{1-6} alkil, C_{1-6} haloalkil, C_{1-6} alkoksi, C_{1-6} haloalkoksi, $-N(R^e)_2$, $-C(O)R^f$, i $-C_{1-6}$ alkilOR^e;

svaki R^e je neovisno vodik, halo(C_{1-4} alkil), ili C_{1-4} alkil;

svaki R^f je neovisno vodik, halo(C_{1-4} alkil), C_{1-4} alkil, ili

(C_3-C_4)cikloalkil;

q je 0 ili 1; i

p je 1,

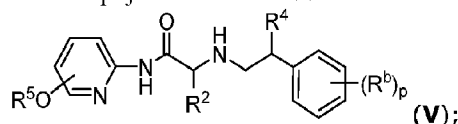
pri čemu:

pojam aril odnosi se na aromatski karbociklički sustav s jednim prstenom ili sustav s dva kondenzirana prstena koji sadrži 6 do 10 atoma ugljika;

pojam heteroaril korišten sam za sebe ili kao dio većeg ostatka odnosi se na 5 do 12-člani aromatski radikal koji sadrži 1 do 4 heteroatoma odabrana između N, O, i S; i

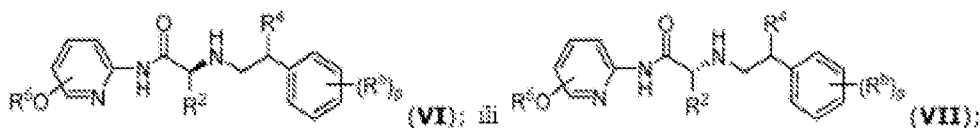
pojam heterociklil odnosi se na 4 do 12-člani zasićeni ili djelomično nezasićeni heterociklički prsten koji sadrži 1 do 4 heteroatoma neovisno odabrana između N, O, i S.

2. Spoj prema zahtjevu 1 naznačen time što spoj ima Formulu V:



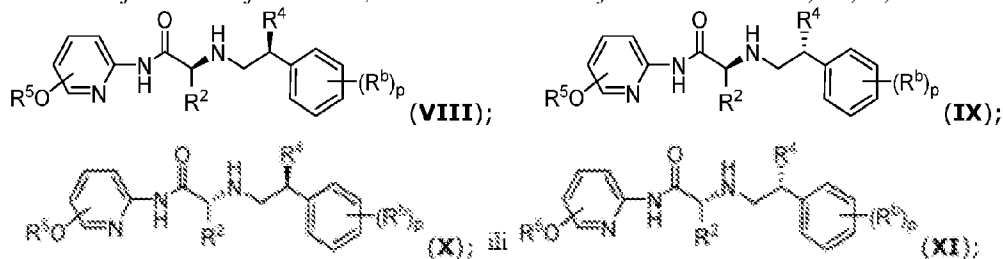
ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

3. Spoj prema zahtjevu 1 ili 2, naznačen time što spoj ima Formulu VI ili VII:



ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

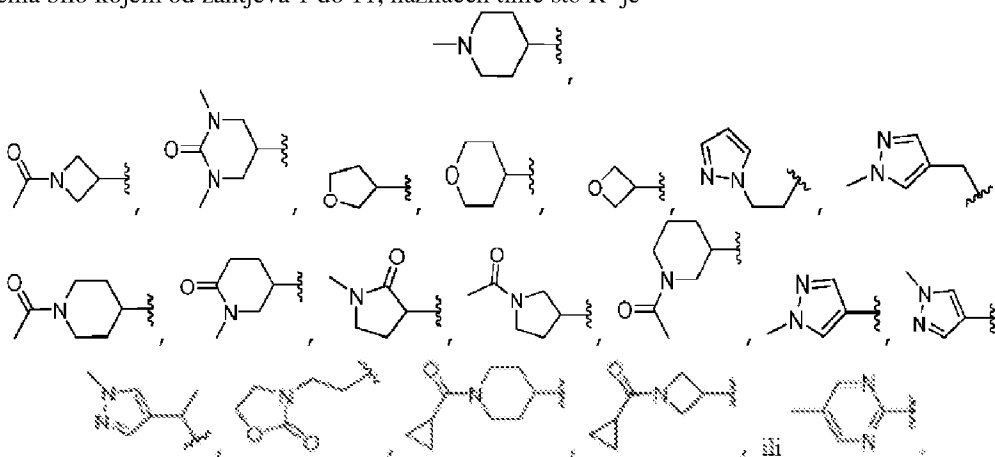
4. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 3, naznačen time što spoj ima Formulu VIII, IX, X, ili XI:



ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

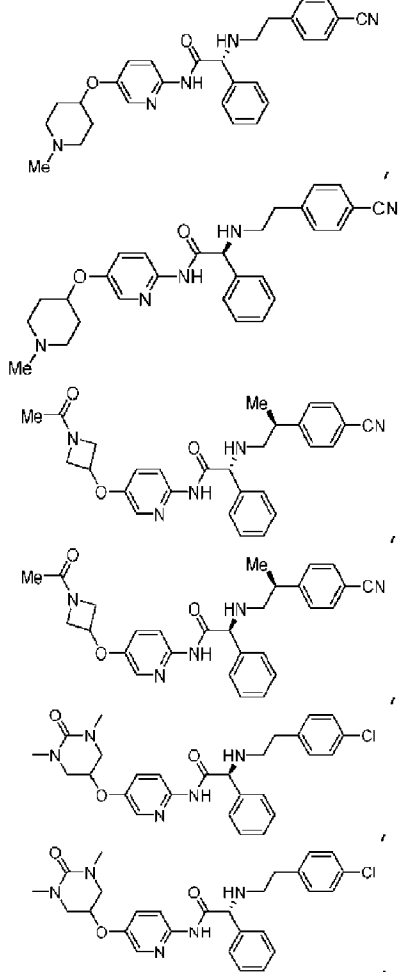
5. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 4, naznačen time što R^2 je fenil.

6. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 5, naznačen time što R^b je cijano.
7. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 6, naznačen time što R⁵ je C₁₋₄alkil supstituiran s pirazolilom ili oksazolidinilom, od kojih je svaki izorno supstituiran s 1 do 3 skupine odabrane od R^d; ili R⁵ je piperidinil, azetidini, heksahidropirimidinil, tetrahydrofuranil, tetrahidropiranil, oksetanil, pirazolil, pirodinil, ili pirimidinil, od kojih je svaki izorno supstituiran s 1 do 3 skupine odabrane od R^d.
8. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 7, naznačen time što je R^d odabran između halo, okso, C₁₋₄alkil, C₁₋₄alkoksi, halo(C₁₋₄alkil), -C₁₋₄alkilOR^e, -C(O)R^f, -C(O)N(R^e)₂, -C₁₋₆alkilC(O)N(R^e)₂, i -S(O)₂R^e.
9. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 8, naznačen time što je R^d odabran od C₁₋₆alkila, -C(O)R^f, i okso.
10. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 8, naznačen time što R^e je vodik ili C₁₋₃alkil.
11. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 10, naznačen time što R^f je ciklopropil ili C₁₋₄alkil.
12. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 11, naznačen time što R⁵ je

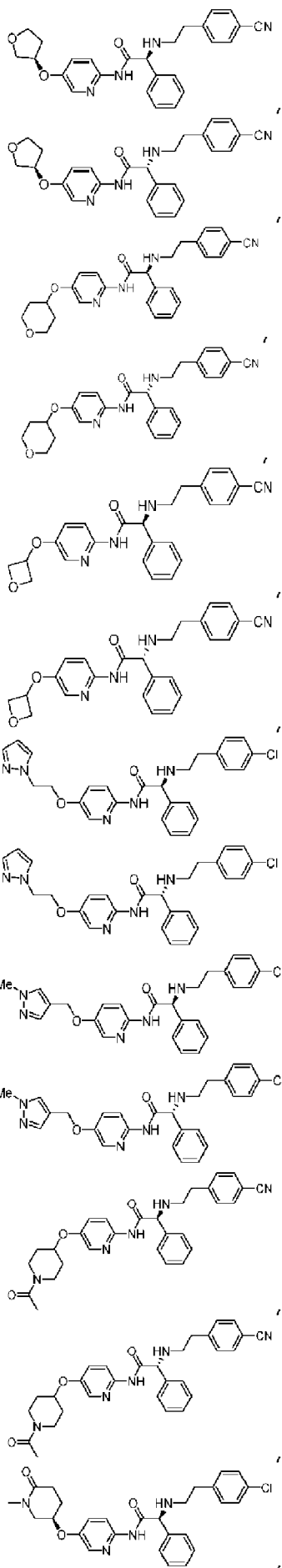


15

13. Spoj prema zahtjevu 1, naznačen time što je spoj odabran između

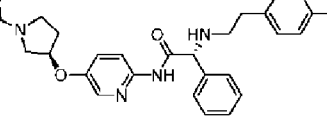
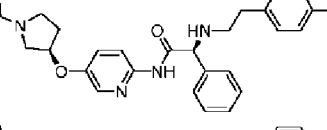
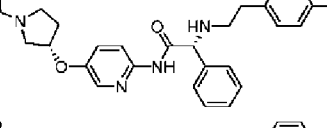
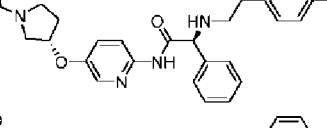
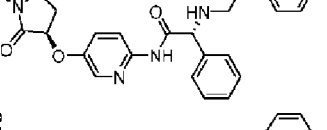
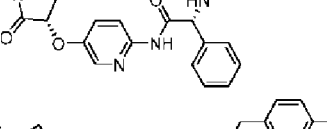
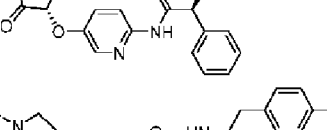
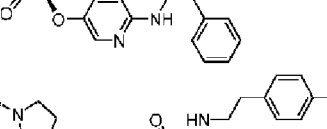
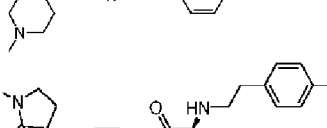
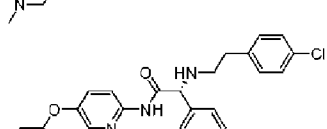
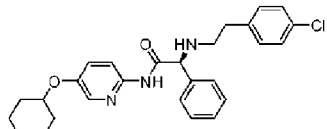
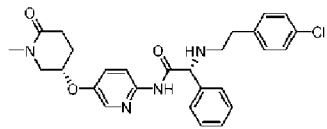
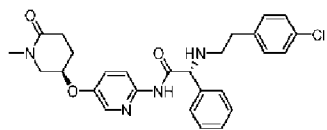
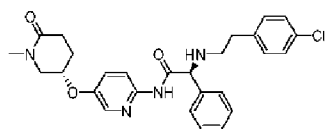


20



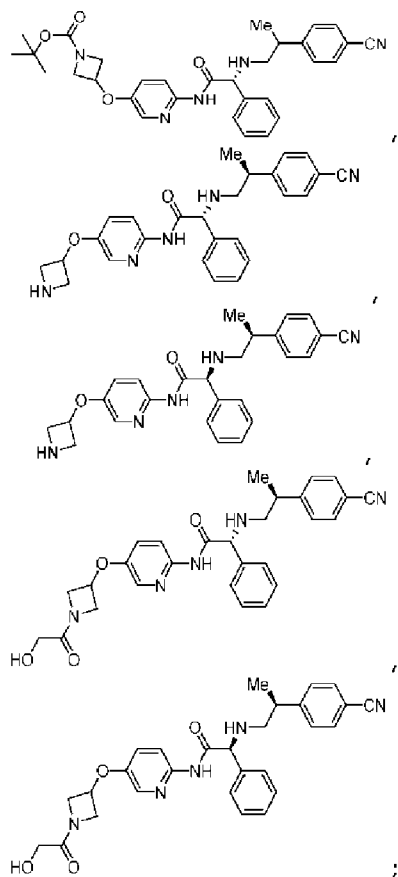
5

10



5

10



5

ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

14. Farmaceutski pripravak, naznačen time što sadrži spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 13, ili njegovu farmaceutski prihvatljivu sol; i farmaceutski prihvatljiv nosač.
15. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 13, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, ili pripravak prema zahtjevu 14, za upotrebu u liječenju poremećaja posredovanog sa CBP i/ili EP300 odabranog od raka, srčane bolesti, metaboličke bolesti, fibrozne bolesti, upalne bolesti i virusne infekcije.

10