



(19) REPUBLIKA HRVATSKA  
DRŽAVNI ZAVOD ZA  
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO



(10) Identifikator  
dokumenta:

**HR P20120202 T1**

HR P20120202 T1

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

(51) MKP:

**C07D 401/12** (2006.01)  
**C07D 401/14** (2006.01)  
**C07D 403/12** (2006.01)  
**C07D 403/14** (2006.01)  
**C07D 405/14** (2006.01)  
**A61K 31/4412** (2006.01)  
**A61P 35/00** (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 31.03.2012.

(21) Broj predmeta: P20120202T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 01.03.2012.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2009050640  
Datum podnošenja međunarodne prijave: 15.07.2009.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 09790440.3  
Datum podnošenja europske prijave patenta: 15.07.2009.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2010011538  
Datum međunarodne objave: 28.01.2010.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2310382 A1  
Datum objave europske prijave patenta: 20.04.2011.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2310382 B1  
Datum objave europskog patenta: 22.02.2012.

(31) Broj prve prijave: 83294 P  
85082 P  
108659 P

(32) Datum podnošenja prve prijave: 24.07.2008.  
31.07.2008.  
27.10.2008.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US  
US  
US

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelj:

**Eli Lilly & Company, Lilly Corporate Center, Indianapolis, IN 46285, US**  
**Tiechao Li, Eli Lilly and Company Lilly Corporate Center, Indianapolis, IN**  
**46285, US**

**Mark Andrew Pobanz, 4293 Sedge Court, Zionsville, IN 46077, US**

**Chuan Shih, 12532 Pebblepointe Pass, Carmel, IN 46033, US**

**Zhipei Wu, Eli Lilly and Company Lilly Corporate Center, Indianapolis, IN**  
**46285, US**

**Wei Jennifer Yang, Eli Lilly and Company Lilly Corporate Center,**  
**Indianapolis, IN 46285, US**

**Boyu Zhong, 11261 Williams Court, Carmel, IN 46033, US**

(74) Zastupnik:

Harste & Partneri odvjetničko društvo, 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma:

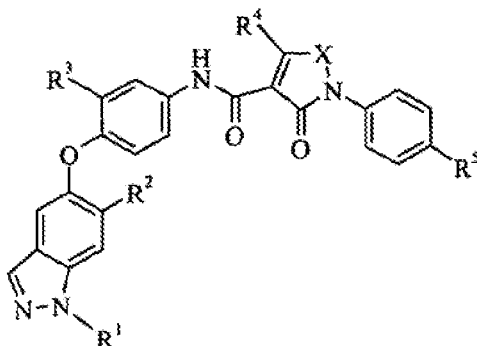
**AMIDOFENOKSIINDAZOLI, KORISNI KAO INHIBITORI c-MET**

HR P20120202 T1

## PATENTNI ZAHTJEVI

5

1. Spoj formule:

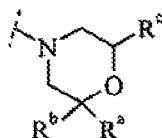


naznačen time što:

R<sup>1</sup> je H ili metil;

10

R<sup>2</sup> je amino, dimetilamino, fluor, ciklopropilni, piridilni, izborno supstituiran s amino supstituentom ili 1-2 metilna supstituenta, pirazolilni, izborno supstituiran s dva metilna supstituenta, 2-metoksipirimidin-5-ilni, 4-metilsulfonilfenilni, tetrahidro-2*H*-piran-4-ilamino, (tetrahidro-2*H*-piran-4-il)aminokarbonilni ili morfolin-4-ilni supstituent:



15

gdje se R<sup>a</sup>, R<sup>b</sup> i R<sup>c</sup> neovisno bira između H ili metila;R<sup>3</sup> je H ili F;

20

R<sup>4</sup> je H, metil, piperidin-1-ilmetil, morfolin-4-ilmetil ili pirazol-1-ilmetil;R<sup>5</sup> je H ili F; i

25

X je CH=N, CH=CH, CH=C(CH<sub>3</sub>), C(CH<sub>3</sub>)=CH, C(CH<sub>3</sub>)=N, N(CH<sub>3</sub>) ili C(morfolin-4-ilmetil)=CH;

ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

30

2. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, naznačen time što R<sup>2</sup> je amino, dimetilamino, ciklopropil, piridil, izborno supstituiran s amino supstituentom ili 1-2 metilna supstituenta, pirazol-4-il ili morfolin-4-il.3. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, naznačen time što R<sup>2</sup> je amino, dimetilamino, pirazol-4-il ili morfolin-4-il.4. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, naznačen time što R<sup>2</sup> je pirazol-4-il.

35

5. Spoj u skladu s patentnim zahtjevima 1-4, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, naznačen time što R<sup>4</sup> je H, metil ili morfolin-4-ilmetil.6. Spoj u skladu s patentnim zahtjevima 1-4, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, naznačen time što R<sup>4</sup> je H.7. Spoj u skladu s patentnim zahtjevima 1-6, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, naznačen time što X je CH=CH ili CH=C(CH<sub>3</sub>).

40

8. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, naznačen time što je *N*-(3-fluor-4-(1-metil-6-(1*H*-pirazol-4-il)-1*H*-indazol-5-iloksi)fenil)-1-(4-fluorfenil)-6-metil-2-okso-1,2-dihidropiridin-3-karboksamid, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.9. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, naznačen time što je *N*-(3-fluor-4-(1-metil-6-(1*H*-pirazol-4-il)-1*H*-indazol-5-iloksi)fenil)-1-(4-fluorfenil)-6-metil-2-okso-1-fenil-1,2-dihidropiridin-3-karboksamid, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

45

10. Spoj u skladu s patentnim zahtjevima 1-9, naznačen time što farmaceutski prihvatljiva sol je metansulfonatna sol.

11. Spoj u skladu s patentnim zahtjevima 1-10, naznačen time što veličina čestica je manja od 10 μm.

12. Farmaceutski pripravak, **naznačen time** što sadrži spoj u skladu s patentnim zahtjevima 1-11, ili njegovu farmaceutski prihvatljivu sol, i farmaceutski prihvatljivu podlogu, razrjeđivač ili pomoćnu tvar.
13. Spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1-11, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi kao medikament.
- 5 14. Spoj, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1-11, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi u liječenju raka.
15. Spoj, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, namijenjen upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 14, **naznačen time** što rak se bira iz skupine koju čine rak pluća, rak dojke, kolorektalni rak, rak bubrega, rak gušterače, rak glave, rak vrata, nasljedni karcinom papilarnih stanica bubrega, hepatocelularni karcinom u dječjoj dobi, te rak želuca.