



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO



(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20220998 T1

HR P20220998 T1

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

(51) MKP:

C07D 231/14 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 11.11.2022.

(21) Broj predmeta: P20220998T

(22) Datum podnošenja : 28.01.2016.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/FI2016050054
Datum podnošenja međunarodne prijave: 28.01.2016.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 16704029.4
Datum podnošenja europske prijave patenta: 28.01.2016.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2016120530
Datum međunarodne objave: 04.08.2016.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3250554 A1
Datum objave europske prijave patenta: 06.12.2017.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3250554 B1
Datum objave europskog patenta: 18.05.2022.

(31) Broj prve prijave: 20150033

(32) Datum podnošenja prve prijave: 30.01.2015.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: FI

(73) Nositelj patenta:

Orion Corporation, Orionintie 1, 02200 Espoo, FI

(72) Izumitelji:

Olli Törmäkangas, Rossinpolku 2 D 4, 20380 Turku, FI

Terhi Heikkinen, Jalaskuja 7 B, 021420 Lieto, FI

(74) Zastupnik:

Odvjetnik Tomislav Hadžija, u suradnji sa DENNEMEYER & ASSOCIATES,
BCI- Business Center International - 1. kat, 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma:

**DERIVAT KARBOKSAMIDA I NJEGOVI DIJASTEREOIZOMERI U STABILNOM KRISTALNOM
OBLIKU**

HR P20220998 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

1. Kristalni oblik I' N-((S)-1-(3-(3-kloro-4-cijanofenil)-1H-pirazol-1-il)propan-2-il)-5-((S)-1-hidroksietil)-1H-pirazol-3-karboksamida (Ia) ima obrazac difrakcije X-zračenja na prahu koji sadrži karakteristične vrhunce na 9.3, 15.7, 17.0, 24.1 i 25.1 ± 0.15 stupnjeva 2-theta mjeren pomoću rendgenske cijevi ispunjene Cu-om.
2. Kristalni oblik I' N-((S)-1-(3-(3-kloro-4-cijanofenil)-1H-pirazol-1-il)propan-2-il)-5-((S)-1-hidroksietil)-1H-pirazol-3-karboksamida (Ia) prema zahtjevu 1, ima obrazac difrakcije X-zračenja na prahu koji sadrži karakteristične vrhunce na 9.3, 11.4, 11.5, 13.6, 14.7, 14.9, 15.7, 16.1, 17.0, 17.7, 18.5, 19.1, 20.5, 21.5, 22.1, 22.6, 23.2, 23.6, 24.1, 25.1, 26.2 i 27.2 ± 0.15 stupnjeva 2-theta mjeren pomoću rendgenske cijevi ispunjene Cu-om.
3. Kristalni oblik I'' N-((S)-1-(3-(3-kloro-4-cijanofenil)-1H-pirazol-1-il)propan-2-il)-5-((R)-1-hidroksietil)-1H-pirazol-3-karboksamida (Ib) ima obrazac difrakcije X-zračenja na prahu koji sadrži karakteristične vrhunce na 9.2, 10.9, 15.1, 15.8 i 22.1 ± 0.15 stupnjeva 2-theta mjeren pomoću rendgenske cijevi ispunjene Cu-om.
4. Kristalni oblik I'' N-((S)-1-(3-(3-kloro-4-cijanofenil)-1H-pirazol-1-il)propan-2-il)-5-((R)-1-hidroksietil)-1H-pirazol-3-karboksamida (Ib) prema zahtjevu 3, ima obrazac difrakcije X-zračenja na prahu koji sadrži karakteristične vrhunce na 7.9, 9.2, 10.9, 13.2, 14.8, 15.1, 15.5, 15.8, 16.9, 18.4, 20.2, 20.5, 21.8, 22.1 i 24.3 ± 0.15 stupnjeva 2-theta mjeren pomoću rendgenske cijevi ispunjene Cu-om.
5. Postupak za dobivanje kristalnog oblika I' ili I'' N-((S)-1-(3-(3-kloro-4-cijanofenil)-1H-pirazol-1-il)propan-2-il)-5-((S)-1-hidroksietil)-1H-pirazol-3-karboksamida (Ia) ili N-((S)-1-(3-(3-kloro-4-cijanofenil)-1H-pirazol-1-il)propan-2-il)-5-((R)-1-hidroksietil)-1H-pirazol-3-karboksamida (Ib), tim redom, koji obuhvaća
 - a) miješanje N-((S)-1-(3-(3-kloro-4-cijanofenil)-1H-pirazol-1-il)propan-2-il)-5-((S)-1-hidroksietil)-1H-pirazol-3-karboksamida (Ia) ili N-((S)-1-(3-(3-kloro-4-cijanofenil)-1H-pirazol-1-il)propan-2-il)-5-((R)-1-hidroksietil)-1H-pirazol-3-karboksamida (Ib) sa smjesom acetonitrila i vode;
 - b) zagrijavanje smjese iz koraka a) da se formira otopina;
 - c) hlađenje otopine iz koraka b) do oko 0-50 °C; i
 - d) izoliranje kristalnog oblika.
6. Postupak prema zahtjevu 5, gdje smjesa acetonitril:voda ima omjer volumena od 85:15 do 99:1.
7. Postupak prema zahtjevu 6, gdje smjesa acetonitril:voda ima omjer volumena od 90:10 do 98:2.
8. Postupak prema zahtjevu 7, gdje smjesa acetonitril:voda ima omjer volumena od 95:5.
9. Postupak prema bilo kojem od zahtjeva 5 do 8, gdje se korak hlađenja c) pojavljuje u toku 5 do 24 h.
10. Postupak prema zahtjevu 9, gdje se korak hlađenja c) pojavljuje u toku 6 do 12 h.
11. Postupak prema bilo kojem od zahtjeva 5 do 10, gdje je izolirani kristalni oblik osušen pod vakuumom na 40 °C do 60 °C.