



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20201405 T1



HR P20201405 T1

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

(51) MKP:

C07D 413/12 (2006.01)
A61K 31/4245 (2006.01)
A61P 25/00 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 27.11.2020.

(21) Broj predmeta: P20201405T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 03.09.2020.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2017055885
Datum podnošenja međunarodne prijave: 14.03.2017.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 17710286.0
Datum podnošenja europske prijave patenta: 14.03.2017.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2017157873
Datum međunarodne objave: 21.09.2017.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3430010 A1
Datum objave europske prijave patenta: 23.01.2019.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3430010 B1
Datum objave europskog patenta: 15.07.2020.

(31) Broj prve prijave: 16160790

(32) Datum podnošenja prve prijave: 17.03.2016.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: EP

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelji:

F. Hoffmann - La Roche AG, Grenzacherstrasse 124, 4070 Basel, CH
Guido Galley, c/o F. Hoffmann - La Roche AG, Grenzacherstrasse 124, 4070 Basel, CH
Marius Hoener, c/o F. Hoffmann - La Roche AG, Grenzacherstrasse 124, 4070 Basel, CH
Roger Norcross, c/o F. Hoffmann - La Roche AG, Grenzacherstrasse 124, 4070 Basel, CH
Philippe Pflieger, c/o F. Hoffmann - La Roche AG, Grenzacherstrasse 124, 4070 Basel, CH

(74) Zastupnik:

CPZ - CENTAR ZA PATENTE d.o.o., 10000 Zagreb, HR

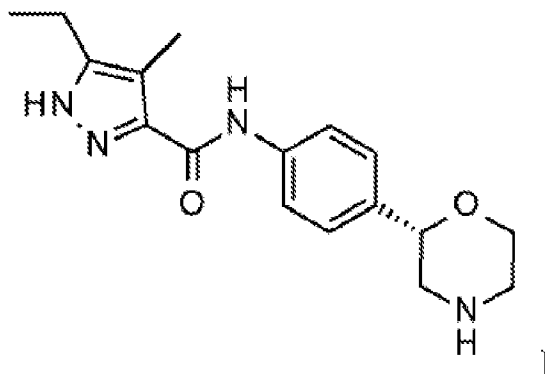
(54) Naziv izuma:

**DERIVAT 5-ETIL-4-METIL-PIRAZOL-3-KARBOKSAMIDA, KOJI DJELUJE KAO AGONIST
TAAR-A**

HR P20201405 T1

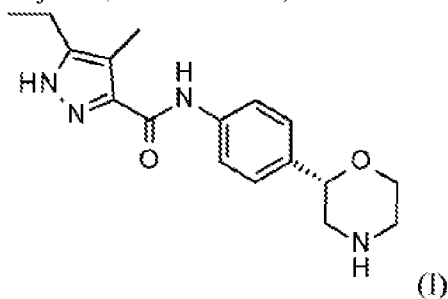
PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Spoj, **naznačen time, da** ima formulu I:



- 5 koji je 5-etil-4-metil-*N*-[4-[(2*S*)morfolin-2-il]fenil]-1H-pirazol-3-karboksamid, ili farmaceutski prihvatljiva sol kiselog ostatka istoga.

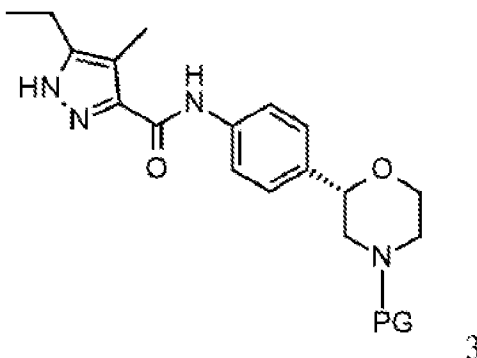
2. Spoj formule I prema patentnom zahtjevu 1, **naznačen time, da**



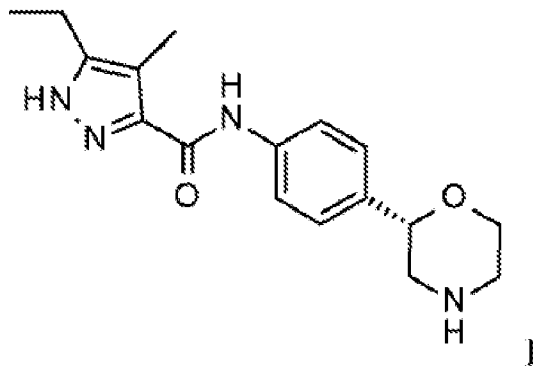
je to 5-etil-4-metil-*N*-[4-[(2*S*) morfolin-2-il]fenil]-1H-pirazol-3-karboksamid.

- 10 3. Postupak proizvodnje spoja formule I prema patentnim zahtjevima 1 i 2, **naznačen time, da** se taj postupak sastoji od:

- a) cijepanja N-zaštitne grupe (PG) od spoja formule 3



u spoj formule I



15

pri čemu PG predstavlja -C(O)O-*tert*-butil (BOC) i, ukoliko je to poželjno, pretvaranja dobivenog spoja formule I u farmaceutski prihvatljive soli kiselog ostatka istoga.

4. Spoj formule prema patentnim zahtjevima 1 i 2, **naznačen time, da** je za uporabu kao terapijski aktivna tvar.

5. Spoj formule I prema patentnom zahtjevu 1, **naznačen time, da** je za uporabu u liječenju depresije, anksioznih poremećaja, bipolarnog poremećaja, poremećaja pažnje s hiperaktivnošću (ADHD), poremećaja uzrokovanih stresom, shizofrenije, Parkinsonove bolesti, Alzheimerove bolesti, epilepsije, migrene, hipertenzije, zlouporabe droga, ovisnosti, poremećaja hranjenja, dijabetesa, komplikacija uzrokovanih dijabetesom, gojaznosti, 5 dislipidemije, poremećaja potrošnje i asimilacije energije, poremećaja i oštećenja homeostaze tjelesne temperature, poremećaja spavanja i cirkadijalnog ritma te kardiovaskularnih poremećaja.
6. Spoj formule I prema patentnom zahtjevu 2, **naznačen time, da** je za uporabu u liječenju depresije, anksioznih poremećaja, bipolarnog poremećaja, poremećaja pažnje s hiperaktivnošću (ADHD), poremećaja uzrokovanih stresom, shizofrenije, Parkinsonove bolesti, Alzheimerove bolesti, epilepsije, migrene, hipertenzije, zlouporabe 10 droga, ovisnosti, poremećaja hranjenja, dijabetesa, komplikacija uzrokovanih dijabetesom, gojaznosti, dislipidemije, poremećaja potrošnje i asimilacije energije, poremećaja i oštećenja homeostaze tjelesne temperature, poremećaja spavanja i cirkadijalnog ritma te kardiovaskularnih poremećaja.
7. Spoj formule I prema patentnom zahtjevu 1, **naznačen time, da** je za uporabu u liječenju depresije.
8. Spoj formule I prema patentnom zahtjevu 2, **naznačen time, da** je za uporabu u liječenju depresije.
- 15 9. Spoj formule I prema patentnom zahtjevu 1, **naznačen time, da** je za uporabu u liječenju bipolarnog poremećaja.
10. Spoj formule I prema patentnom zahtjevu 2, **naznačen time, da** je za uporabu u liječenju bipolarnog poremećaja.
11. Spoj formule I prema patentnom zahtjevu 1, **naznačen time, da** je za uporabu u liječenju shizofrenije.
12. Spoj formule I prema patentnom zahtjevu 2, **naznačen time, da** je za uporabu u liječenju shizofrenije.
13. Spoj formule I prema patentnom zahtjevu 1, **naznačen time, da** je za uporabu u liječenju zlouporabe droga.
- 20 14. Spoj formule I prema patentnom zahtjevu 2, **naznačen time, da** je za uporabu u liječenju zlouporabe droga.
15. Spoj formule I prema patentnom zahtjevu 1, **naznačen time, da** je za uporabu u liječenju ovisnosti.
16. Spoj formule I prema patentnom zahtjevu 2, **naznačen time, da** je za uporabu u liječenju ovisnosti.
17. Spoj formule I prema patentnom zahtjevu 1, **naznačen time, da** je za uporabu u liječenju poremećaja hranjenja.
18. Spoj formule I prema patentnom zahtjevu 2, **naznačen time, da** je za uporabu u liječenju poremećaja hranjenja.
- 25 19. Spoj formule I prema patentnom zahtjevu 1, **naznačen time, da** je za uporabu u liječenju dijabetesa.
20. Spoj formule I prema patentnom zahtjevu 2, **naznačen time, da** je za uporabu u liječenju dijabetesa.
21. Oralni farmaceutski pripravak, **naznačen time, da** sadrži spoj formule I prema patentnom zahtjevu 1, pri čemu je oralni farmaceutski pripravak u obliku odabranom iz skupine koja se sastoji od tableta, obloženih tableta, dražeja, 30 tvrdih i mekih želatinskih kapsula, otopina, emulzija i suspenzija.
22. Oralni farmaceutski pripravak, **naznačen time, da** sadrži spoj formule I prema patentnom zahtjevu 2, pri čemu je oralni farmaceutski pripravak u obliku odabranom iz skupine koja se sastoji od tableta, obloženih tableta, dražeja, tvrdih i mekih želatinskih kapsula, otopina, emulzija i suspenzija.