



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20110539 T1

HR P20110539 T1

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

(51) MKP:
C07D 471/04 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 31.08.2011.

(21) Broj predmeta: P20110539T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 20.07.2011.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/IB2007001001
Datum podnošenja međunarodne prijave: 10.04.2007.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 07734320.0
Datum podnošenja europske prijave patenta: 10.04.2007.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2007122466
Datum međunarodne objave: 01.11.2007.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2013208 A1
Datum objave europske prijave patenta: 14.01.2009.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2013208 B1
Datum objave europskog patenta: 22.06.2011.

(31) Broj prve prijave: 793971 P

(32) Datum podnošenja prve prijave: 21.04.2006.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelji:

Pfizer Products Inc., Eastern Point Road, Groton, 06340 CT, US
Robert O. Hughes, Pfizer Global Research and Development 700
Chesterfield Parkway West, 63017 Chesterfield, MO, US
Andrew Simon Bell, Pfizer Global Research and Development Ramsgate
Road Sandwich, Kent CT13 9NJ, GB
David Graham Brown, Pfizer Global Research and Development
Ramsgate Road Sandwich, Kent CT13 9NJ, GB
Dafydd Rhys Owen, Pfizer Global Research and Development Ramsgate
Road Sandwich, Kent CT13 9NJ, GB
Michael John Palmer, Pfizer Global Research and Development
Ramsgate Road Sandwich, Kent CT13 9NJ, GB
Christopher Phillips, Pfizer Global Research and Development Ramsgate
Road Sandwich, Kent CT13 9NJ, GB
David Louis Brown, Pfizer Global Research and Development 700
Chesterfield Parkway West, 63017 Chesterfield, MO, US
Yvette Marlene Fobian, Pfizer Global Research and Development 700
Chesterfield Parkway West, 63017 Chesterfield, MO, US
John Nicholas Freskos, Pfizer Global Research and Development 700
Chesterfield Parkway West, 63017 Chesterfield, MO, US
Steven Edward Heasley, Pfizer Global Research and Development 700
Chesterfield Parkway West, 63017 Chesterfield, MO, US
Eric Jon Jacobsen, Pfizer Global Research and Development 700
Chesterfield Parkway West, 63017 Chesterfield, MO, US
Todd Michael Maddux, Pfizer Global Research and Development 700
Chesterfield Parkway West, 63017 Chesterfield, MO, US
Brent Virgil Mischke, Pfizer Global Research and Development 700
Chesterfield Parkway West, 63017 Chesterfield, MO, US

HR P20110539 T1



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO



(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20110539 T1

HR P20110539 T1

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

John Major Molyneaux, Pfizer Global Research and Development 700
Chesterfield Parkway West, 63017 Chesterfield, MO, US
Joseph Blair Moon, Pfizer Global Research and Development 700
Chesterfield Parkway West, 63017 Chesterfield, MO, US
Donald Joseph Jr. Rogier, Pfizer Global Research and Development 700
Chesterfield Parkway West, 63017 Chesterfield, MO, US
Michael Brent Tollefson, Pfizer Global Research and Development 700
Chesterfield Parkway West, 63017 Chesterfield, MO, US
John Keith Walker, Pfizer Global Research and Development 700
Chesterfield Parkway West, 63017 Chesterfield, MO, US
Hraste & Partneri odvjetničko društvo, 10000 Zagreb, HR

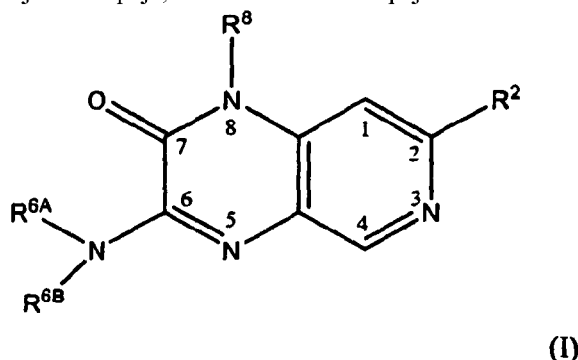
(74) Zastupnik:

(54) Naziv izuma: **PIRIDINO[3,4-b]PIRAZINONI**

HR P20110539 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

1. Spoj, ili farmaceutski prihvatljiva sol spoja, **naznačen time** što spoj ima strukturu Formule I:



te time što:

R^2 se bira iz skupine koju čine aril i 3- do 10-eročlani heterociklični prsten, gdje navedeni R^2 arilni i heterociklični supstituenti mogu izborno biti supstituirani s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine halogen, cijano, nitro, okso, alkil, alkenil, alkinil, cikloalkil, OR^{201} , $-C(O)R^{201}$, $-OC(O)R^{201}$, $-C(O)OR^{201}$, $-NR^{201}R^{202}$, $-N(R^{202})C(O)R^{202}$, $-C(O)NR^{201}R^{202}$, $-C(O)NR^{201}C(O)R^{202}$, $-SR^{201}$, $-S(O)R^{201}$ i $-S(O)_2R^{201}$, gdje navedeni alkinilni, alkenilni, alkinilni i cikloalkilni supstituenti mogu izborno biti supstituirani s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine halogen, okso, $-OR^{203}$ i $-C(O)OR^{203}$,

R^{201} , R^{202} i R^{203} se neovisno bira iz skupine koju čine vodik i alkil, gdje navedeni alkil može izborno biti supstituiran s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine halogen, hidroksi, alkoksi, karboksi i $-C(O)NH_2$;

R^{6A} i R^{6B} , zajedno s dušikom na koji su vezani, tvore djelomično ili posve zasićeni 3- do 14-eročlani heterociklični prsten, gdje heterociklični može izborno biti supstituiran s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine vodik, halogen, okso, alkil, alkenil, alkinil, cijano, cikloalkil, aril, heterociklični, $-OR^{601}$, $-C(O)R^{601}$, $OC(O)R^{601}$, $-C(O)OR^{601}$, $-NR^{601}R^{602}$, $-N(R^{601})C(O)R^{602}$, $-C(O)NR^{601}R^{602}$ i $-C(O)NR^{601}C(O)R^{602}$, gdje (a) navedeni alkinilni, alkenilni, alkinilni i cikloalkilni supstituenti mogu izborno biti supstituirani s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine halogen, cijano, okso, $-OR^{603}$, $-C(O)R^{603}$, $-C(O)OR^{603}$, $-OC(O)R^{603}$, $-NR^{603}R^{604}$, $-N(R^{603})C(O)R^{604}$, $-C(O)NR^{603}R^{604}$, $-C(O)NR^{603}C(O)R^{604}$, $-SR^{603}$, $-S(O)R^{603}$, $-S(O)_2R^{603}$, $-N(R^{603})S(O)_2R^{604}$, $-S(O)_2NR^{603}R^{604}$, $C(O)NR^{603}C(O)R^{604}$, $-SR^{603}$, $-S(O)R^{603}$, $-S(O)_2R^{603}$, $-N(R^{603})S(O)_2R^{604}$ i $-S(O)_2NR^{603}R^{604}$, i (b) navedeni arilni i heterociklični supstituenti mogu izborno biti supstituirani s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine halogen, alkil, alkenil, alkinil, cijano, okso, $-OR^{601}$, $-C(O)R^{601}$, $-C(O)OR^{601}$, $-OC(O)R^{601}$, $-NR^{601}R^{602}$, $-N(R^{601})C(O)R^{602}$, $-C(O)NR^{601}R^{602}$, $-C(O)NR^{601}C(O)R^{602}$, $-SR^{601}$, $-S(O)R^{602}$, $-S(O)_2R^{601}$, $-N(R^{601})S(O)_2R^{602}$ i $-S(O)_2NR^{601}R^{602}$,

R^{601} , R^{602} , R^{603} i R^{604} se neovisno bira iz skupine koju čine vodik, alkil, alkenil, i alkinil, gdje (a) navedeni R^{601} i R^{602} alkil mogu izborno biti supstituirani s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine halogen, cijano, hidroksi, karboksi, okso, alkenil, alkinil, halogenalkenil, hidroksialkenil, karboksialkenil, halogenalkinil, hidroksialkinil, karboksialkinil, alkoksi, halogenalkoksi, hidroksialkoksi i karboksialkoksi, i (b) navedeni R^{601} i R^{602} alkenilni i alkinilni supstituenti mogu izborno biti supstituirani s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine halogen, cijano, hidroksi, karboksi, okso, alkoksi, halogenalkoksi, hidroksialkoksi i karboksialkoksi;

R^8 je alkil, gdje navedeni R^8 supstituent može izborno biti supstituiran s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine halogen, cijano, hidroksi, karboksi, alkenil, alkinil, $-OR^{801}$, $-C(O)R^{801}$, $-C(O)OR^{801}$, $-OC(O)R^{801}$, $-NR^{801}R^{802}$, $-N(R^{801})C(O)R^{802}$, $-C(O)NR^{801}R^{802}$ i $-C(O)NR^{801}C(O)R^{802}$, gdje navedeni alkenilni i alkinilni supstituenti mogu izborno biti supstituirani s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine halogen, cijano, hidroksi, karboksi, okso i alkoksi; i

R^{801} i R^{802} se neovisno bira iz skupine koju čine vodik, alkil, alkenil i alkinil, gdje (a) kada navedeni alkil je metil, navedeni metil može izborno biti supstituiran s 1, 2 ili 3 fluora kao supstituentima, (b) kada navedeni alkil sadrži najmanje dva atoma ugljika, navedeni alkil može izborno biti supstituiran s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine halogen, cijano, hidroksi, karboksi, okso, alkinil, halogenalkinil, hidroksialkinil, karboksialkinil, alkoksi, halogenalkoksi, hidroksialkoksi i karboksialkoksi i (c) navedeni R^{801} i R^{802} alkenilni i

alkinilni supstituenti mogu izborno biti supstituirani s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine halogen, cijano, hidroksi, karboksi, okso, alkoksi, halogenalkoksi, hidroksialkoksi i karboksialkoksi.

2. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što:

R^2 se bira iz skupine koju čine fenil, tienil i piridinil, gdje R^2 fenil, tienil i piridinil mogu izborno biti supstituirani s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine halogen, cijano, nitro, okso, alkil, alkenil, -OR²⁰¹, -C(O)R²⁰¹, -C(O)OR²⁰, -NR²⁰¹R²⁰² i -S(O)₂R²⁰¹, gdje navedeni alkil i alkenilni supstituenti mogu izborno biti supstituirani s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine halogen, okso, -OR²⁰³ i -C(O)OR²⁰³; i

R^{201} , R^{202} i R^{203} se neovisno bira iz skupine koju čine vodik i alkil, gdje navedeni alkil može izborno biti supstituiran s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine halogen, hidroksi i alkoksi;

R^{6A} i R^{6B} , zajedno s dušikom na koji su vezani, tvore djelomično ili posve zasićeni 5- do 7-eročlani heterociklični prsten, gdje 5- do 7-eročlani heterociklični prsten može izborno biti supstituiran s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine vodik, halogen, cijano, okso, alkil, -OR⁶⁰¹, -C(O)R⁶⁰¹, -C(O)OR⁶⁰¹, -NR⁶⁰¹R⁶⁰², -N(R⁶⁰¹)C(O)R⁶⁰² i -C(O)NR⁶⁰¹R⁶⁰², gdje (a) navedeni alkinilni supstituent može izborno biti supstituiran s jednim ili više supstituenata, koje se bira iz skupine koju čine halogen, -OR⁶⁰³, -C(O)R⁶⁰³, -C(O)OR⁶⁰³, -NR⁶⁰³R⁶⁰⁴ i -C(O)NR⁶⁰³R⁶⁰⁴; i

R^{601} , R^{602} , R^{603} i R^{604} se neovisno bira iz skupine koju čine vodik i alkil, gdje (a) navedeni R^{601} i R^{602} alkil mogu izborno biti supstituirani s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine halogen, cijano, hidroksi, karboksi, okso, alkinil, halogenalkinil, hidroksialkinil, karboksialkinil, alkoksi, halogenalkoksi, hidroksialkoksi i karboksialkoksi;

R^8 je alkil, supstituiran s -OR⁸⁰¹; i

R^{801} se bira iz skupine koju čine vodik i alkil, gdje (a) kada navedeni alkil je metil, navedeni metil može izborno biti supstituiran s 1, 2, ili 3 fluora kao supstituentima, (b) kada navedeni alkil sadrži najmanje dva atoma ugljika, navedeni alkil može izborno biti supstituiran s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine halogen, hidroksi, karboksi, okso i alkinil;

ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

3. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 2, **naznačen time** što R^8 je C₁ do C₄ alkil, supstituiran s -OR⁸⁰¹, gdje R^{801} je C₁ do C₄ alkil, izborno supstituiran s 1, 2, ili 3 fluora kao supstituentima; ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

4. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 3, **naznačen time** što:

R^2 se bira iz skupine koju čine fenil, tienil i piridinil, gdje R^2 fenil, tienil i piridinil mogu izborno biti supstituirani s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine hidroksi, halogen, alkil, -OR²⁰¹, -C(O)R²⁰¹, NR²⁰¹R²⁰² i -S(O)₂R²⁰¹; gdje navedeni alkil može izborno biti supstituiran s jednim ili više -OR²⁰³; i

R^{201} , R^{202} i R^{203} se neovisno bira iz skupine koju čine vodik i alkil;

ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

5. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 4, **naznačen time** što:

R^2 fenil, tienil i piridinil mogu izborno biti supstituirani s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine hidroksi, klor, fluor, metil, metoksi, etoksi, hidroksimetil, -C(O)CH₃, -C(O)CH(CH₃)₂, -N(CH₃)₂ i -S(O)₂CH₂(CH₃);

ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

6. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 3, **naznačen time** što:

R^{6A} i R^{6B} , zajedno s dušikom na koji su vezani, tvore heterociklični, koji se bira iz skupine koju čine pirolidinil, piperidinil, piperazinil, morfolinil i diazepinil, gdje pirolidinil, piperidinil, piperazinil, morfolinil i diazepinil mogu izborno biti supstituirani s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine halogen, alkil, -OR⁶⁰¹ i -C(O)NR⁶⁰¹R⁶⁰², gdje navedeni alkinilni supstituent može izborno biti supstituiran s jednim ili više supstituenata, koje se bira iz skupine koju čine -OR⁶⁰³, -C(O)OR¹⁰³ i -NR⁶⁰³R⁶⁰⁴; i

R^{601} , R^{602} , R^{603} i R^{604} se neovisno bira iz skupine koju čine vodik i alkil;

ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

7. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 3, **naznačen time** što:

R^{6A} i R^{6B} , zajedno s dušikom na koji su vezani, tvore heterociklični, koji se bira iz skupine koju čine piperidinil, piperazinil i morfolinil, gdje piperidinil, piperazinil i morfolinil mogu izborno biti supstituirani s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine klor, hidroksi, metil, etil, propil, hidroksimetil, hidroksietil,

hidroksipropil, $-\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{NH}_2$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{NH}_2$, $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{OH}$, $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{OC}(\text{CH}_3)_3$, $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{OH}$ i $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$; ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

8. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 3, **naznačen time** što R^{6A} i R^{6B} , zajedno s dušikom na koji su vezani, tvore piperazinil, gdje piperazinil može izborno biti supstituiran s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine klor, hidroksi, metil, etil, propil, hidroksimetil, hidroksietil, hidroksipropil, $-\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{NH}_2$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{NH}_2$, $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{OH}$, $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{OC}(\text{CH}_3)_3$, $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{OH}$ i $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$;

ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

9. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 3, **naznačen time** što:

R^2 se bira iz skupine koju čine fenil i piridinil, gdje fenil i piridinil mogu izborno biti supstituirani s jednim ili više supstituenata, koje se bira iz skupine koju čine hidroksi, klor, fluor, metil, metoksi, etoksi, hidroksimetil, $-\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$, $-\text{C}(\text{O})\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{N}(\text{CH}_3)_2$ i $-\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_2(\text{CH}_3)$; i

R^{6A} i R^{6B} , zajedno s dušikom na koji su vezani, tvore heterociklil, koji se bira iz skupine koju čine piperidinil, piperazinil i morfolinil, gdje piperidinil, piperazinil, i morfolinil mogu izborno biti supstituirani s jednim ili više supstituenata, koje se bira iz skupine koju čine klor, hidroksi, etil, hidroksimetil, hidroksietil, hidroksipropil, $-\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{NH}_2$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{NH}_2$, $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{OH}$, $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{OC}(\text{CH}_3)_3$, $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{OH}$ i $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$;

ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

10. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 9, **naznačen time** što:

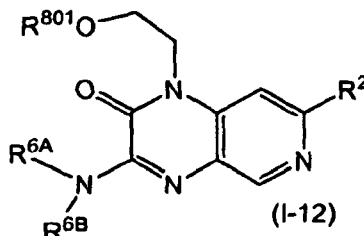
R^2 je piridinil, supstituiran s metoksi;

R^{6A} i R^{6B} , zajedno s dušikom na koji su vezani, tvore piperazinil, izborno supstituiran s jednim ili više supstituenata, koje se bira iz skupine koju čine klor, hidroksi, etil, hidroksimetil, hidroksietil, hidroksipropil, $-\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{NH}_2$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}(\text{CH}_3)\text{NH}_2$, $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{OH}$, $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{OC}(\text{CH}_3)_3$, $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{OH}$ i $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$; i

R^8 je propoksietil;

ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

11. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, ili farmaceutski prihvatljiva sol spoja, **naznačen time** što spoj ima strukturu Formule I-12:



te time što

R^2 je piridinil, izborno supstituiran s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine halogen, cijano, nitro, okso, alkil, alkenil, alkinil, cikloalkil, $-\text{OR}^{201}$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{201}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{201}$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{201}$, $\text{NR}^{201}\text{R}^{202}$, $-\text{N}(\text{R}^{202})\text{C}(\text{O})\text{R}^{202}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{201}\text{R}^{202}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{201}\text{C}(\text{O})\text{R}^{202}$ i $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{201}$; gdje navedeni alkilni, alkenilni, alkinilni i cikloalkilni supstituenti mogu izborno biti supstituirani s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine halogen, okso, $-\text{OR}^{203}$ i $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{203}$;

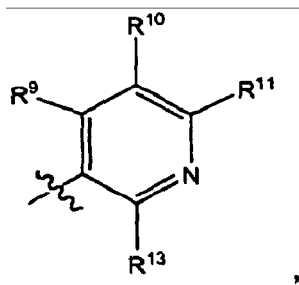
R^{201} , R^{202} i R^{203} se neovisno bira iz skupine koju čine vodik i alkil, gdje navedeni alkil može izborno biti supstituiran s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine halogen, hidroksi, alkoksi, karboksi i $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$;

R^{6A} i R^{6B} , zajedno s dušikom na koji su vezani, tvore 5- do 7-eročlani djelomično ili posve zasićeni heterociklilni prsten, gdje heterociklil može izborno biti supstituiran s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine vodik, halogen, okso, alkil, alkenil, alkinil, cijano, $-\text{OR}^{601}$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{601}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{601}$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{601}$, $-\text{NR}^{601}\text{R}^{602}$, $-\text{N}(\text{R}^{601})\text{C}(\text{O})\text{R}^{602}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{601}\text{R}^{602}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{601}\text{C}(\text{O})\text{R}^{602}$, cikloalkil, akril i heterociklil, gdje (a) navedeni alkilni, alkoksi, alkilamino, alkilkarbonilni, alkenilni, alkinilni i cikloalkilni supstituenti mogu izborno biti supstituirani s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine halogen, cijano, okso, $-\text{OR}^{603}$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{603}$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{603}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{603}$, $-\text{NR}^{603}\text{R}^{604}$, $-\text{N}(\text{R}^{603})\text{C}(\text{O})\text{R}^{604}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{603}\text{R}^{604}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{603}\text{C}(\text{O})\text{R}^{604}$, $-\text{SR}^{603}$, $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{603}$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{603}$, $-\text{N}(\text{R}^{603})\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{604}$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{603}\text{R}^{604}$, $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{603}\text{C}(\text{O})\text{R}^{604}$, $-\text{SR}^{603}$, $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{603}$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{603}$, $-\text{N}(\text{R}^{603})\text{S}(\text{O})\text{R}^{604}$ i $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{604}\text{R}^{604}$ i (b) navedeni R^6 arilni i heterociklilni supstituenti mogu izborno biti supstituirani s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine halogen, alkil, alkenil, alkinil, cijano, okso, $-\text{OR}^{601}$, $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{601}$, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{601}$, $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^{601}$, $-\text{NR}^{601}\text{R}^{602}$, $-\text{N}(\text{R}^{601})\text{C}(\text{O})\text{R}^{602}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{601}\text{R}^{602}$, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{601}\text{C}(\text{O})\text{R}^{602}$, $-\text{SR}^{601}$, $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{602}$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{601}$, $-\text{N}(\text{R}^{601})\text{S}(\text{O})\text{R}^{602}$ i $-\text{S}(\text{O})\text{NR}^{601}\text{R}^{602}$;

R^{601} , R^{602} , R^{603} i R^{604} se neovisno bira iz skupine koju čine vodik, alkil, alkenil, i alkinil, gdje (a) navedeni R^{601} i R^{602} alkil mogu izborno biti supstituirani s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine halogen, cijano, hidroksi, karboksi, okso, alkinil, halogenalkinil, hidroksialkinil, karboksialkinil, alkoksi, halogenalkoksi, hidroksialkoksi i karboksialkoksi i (b) navedeni R^{601} i R^{602} alkenilni i alkinilni supstituenti mogu izborno biti supstituirani s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine halogen, cijano, hidroksi, karboksi, okso, alkoksi, halogenalkoksi, hidroksialkoksi i karboksialkoksi; i

R^{801} se bira iz skupine koju čine vodik, i metil, etil i propil, gdje navedeni metil, etil i propil mogu izborno biti supstituirani s 1, 2, ili 3 fluora kao supstituentima.

12. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 11, **naznačen time** što R^2 je



gdje R^9 , R^{10} , R^{11} , i R^{13} se neovisno bira iz skupine koju čine vodik, klor, fluor, hidroksi, metil, etil, metoksi, etoksi, hidroksimetil, hidroksietil, $-C(O)CH_3$, $-C(O)CH(CH_3)_2$, $-N(CH_3)_2$ i $-S(O)_2CH_2(CH_3)$; ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

13. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 12, **naznačen time** što svaki od R^9 , R^{10} i R^{13} je vodik, a R^{11} se bira iz skupine koju čine vodik, klor, fluor, hidroksi, Metil, etil, metoksi, etoksi, hidroksimetil, hidroksietil, $-C(O)CH_3$, $-C(O)CH(CH_3)_2$, $-N(CH_3)_2$ i $-S(O)_2CH_2(CH_3)$; ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

14. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 12, **naznačen time** što svaki od R^9 , R^{10} i R^{13} je vodik, a R^{11} je metoksi; ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

15. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 11, **naznačen time** što:

R^{6A} i R^{6B} , zajedno s dušikom na koji su vezani, tvore heterociklil, koji se bira iz skupine koju čine pirolidinil, piperidinil, piperazinil, morfolinil i diazepinil, gdje pirolidinil, piperidinil, piperazinil, morfolinil i diazepinil mogu izborno biti supstituirani s jednim ili više supstituenata, koje se neovisno bira iz skupine koju čine klor, hidroksi, metil, etil, propil, hidroksimetil, hidroksietil, hidroksipropil, $-CH_2C(CH_3)_2NH_2$, $-CH(CH_3)CH(CH_3)NH_2$, $-CH_2CH(CH_3)OH$, $-CH_2C(O)OC(CH_3)_3$, $-CH_2C(O)OH$ i $-C(O)NH_2$; ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

16. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što ga se bira iz skupine koju čine:
7-(6-metoksipiridin-3-il)-3-(piperazin-1-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

3-[(1*R*,4*R*)-2,5-diazabicyclo[2.2.1]hept-2-il]-7-(6-metoksipiridin-3-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

7-(6-metoksipiridin-3-il)-3-morfolin-4-il-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

3-(3-hidroksipiperidin-1-il)-7-(6-metoksipiridin-3-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

3-[4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il]-7-(6-metoksipiridin-3-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

3-[3-(hidroksimetil)piperidin-1-il]-7-(6-metoksipiridin-3-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

tert-butil-{4-[7-(6-metoksipiridin-3-il)-2-okso-1-(2-propoksietil)-1,2-dihidropirido[3,4-*b*]pirazin-3-il]piperazin-1-il}acetat;

{4-[7-(6-metoksipiridin-3-il)-2-okso-1-(2-propoksietil)-1,2-dihidropirido[3,4-*b*]pirazin-3-il]piperazin-1-il}acetic acid;

3-[(3*S*)-4-(2-hidroksietil)-3-metilpiperazin-1-il]-7-(6-metoksipiridin-3-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

3-[4-(3-hidroksipropil)-3,5-dimetilpiperazin-1-il]-7-(6-metoksipiridin-3-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

3-[4-(3-hidroksipropil)piperazin-1-il]-7-(6-metoksipiridin-3-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

3-[4-(2-hidroksietil)-1,4-diazepan-1-il]-7-(6-metoksipiridin-3-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

7-(4-klorfenil)-3-(4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

3-(4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il)-7-(4-hidroksifenil)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

7-(4-(dimetilamino)-2-metilfenil)-3-(4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

7-(3-klorfenil)-3-(4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

3-(4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il)-7-(4-metoksifenil)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

7-(2,4-difluorfenil)-3-(4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

7-(4-(etilsulfonil)fenil)-3-(4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

7-(2-fluor-3-metoksifenil)-3-(4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

3-(4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il)-7-(4-izopropoksifenil)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

3-(4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il)-7-(izokinolin-5-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

3-(4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il)-7-(4-(hidroksimetil)fenil)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

7-(4-etoksifenil)-3-(4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

7-(4-fluor-3-metilfenil)-3-(4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

7-(2,3-difluorfenil)-3-(4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

3-(4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il)-1-(2-propoksietil)-7-*p*-tolilpirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

7-(5-acetiltiofen-2-il)-3-(4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

3-(4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il)-7-(3-metoksifenil)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

3-(4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il)-7-(3-(hidroksimetil)fenil)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

3-(4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il)-1-(2-propoksietil)-7-(piridin-3-il)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

7-(3-etoksifenil)-3-(4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

7-(3-fluor-4-metoksifenil)-3-(4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

7-(5-klor-2-fluorfenil)-3-(4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

3-(4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il)-7-(4-metoksi-3-metilfenil)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

3-(4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il)-1-(2-propoksietil)-7-*m*-tolilpirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

3-(4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il)-7-(2-hidroksifenil)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

7-(2-fluorfenil)-3-(4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

3-(4-etilpiperazin-1-il)-7-(6-metoksipiridin-3-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

1-(1,2-dihidro-7-(6-metoksipiridin-3-il)-2-okso-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-3-il)piperidin-3-karboksamid;

1-(1,2-dihidro-7-(6-metoksipiridin-3-il)-2-okso-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-3-il)piperidin-4-karboksamid;

3-(3-hidroksipirolidin-1-il)-7-(6-metoksipiridin-3-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

3-(4-(2-hidroksi-2-metilpropil)piperazin-1-il)-7-(6-metoksipiridin-3-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

3-(4-((2*S*,3*R*)-3-hidroksibutan-2-il)piperazin-1-il)-7-(6-metoksipiridin-3-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

3-(4-((2*R*,3*R*)-3-hidroksibutan-2-il)piperazin-1-il)-7-(6-metoksipiridin-3-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

3-(4-((*S*)-2-hidroksipropil)piperazin-1-il)-7-(6-metoksipiridin-3-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

3-(4-((*R*)-2-hidroksipropil)piperazin-1-il)-7-(6-metoksipiridin-3-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on;

3-(4-(3-hidroksipropil)-1,4-diazepan-1-il)-7-(6-metoksipiridin-3-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on,

i njihove farmaceutske prihvatljive soli.

17. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što je 3-[4-(2-hidroksietil)piperazin-1-il]-7-(6-metoksipiridin-3-il)-1-(2-propoksietil)pirido[3,4-*b*]pirazin-2(1*H*)-on, ili njegove farmaceutske prihvatljive soli.

18. Farmaceutski pripravak, **naznačen time** što sadrži spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 17, ili njegovu farmaceutske prihvatljivu sol, i farmaceutske prihvatljivu podlogu.

19. Spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 17, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi *as a medicament*.

20. Spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 17, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi u liječenju stanja koje se bira iz skupine koju čine kardiovaskularna bolest, metabolička stanja, stanja središnjeg živčanog sustava, plućna stanja, spolna disfunkcija, bol i disfunkcija bubrega.

21. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 20, **naznačen time** što kardiovaskularno stanje je hipertenzija.

22. Spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 17, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi u poticanju neuroobnavljanja kod subjekta.

23. Farmaceutski pripravak, **naznačen time** što sadrži spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 17, jedno ili više dodatnih terapijskih sredstava i farmaceutske prihvatljivu podlogu.

24. Farmaceutski pripravak, **naznačen time** što sadrži spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 17, jedan ili više inhibitora 3-hidroksi-3-metilglutarilkoenzim A-reduktaze i farmaceutske prihvatljivu podlogu.