

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

PATENTTI- JA REKISTERIHALLITUS
PATENT- OCH REGISTERSTYRELSEN
FINNISH PATENT AND REGISTRATION OFFICE

- (10) **FI/EP4259617 T3**
- (12) **EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION**
- (45) Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning - **27.11.2024**
Translation available to the public
- (97) Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för **23.10.2024**
det europeiska patentet - Date of grant of European patent
- (51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -
International patent classification
C07D 401/04 (2006 . 01)
A61P 7/00 (2006 . 01)
A61P 9/00 (2006 . 01)
A61P 11/00 (2006 . 01)
A61P 13/12 (2006 . 01)
A61K 31/496 (2006 . 01)
- (96) Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan - **EP21823605.7**
European patent application
- (22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date **09.12.2021**
- (97) Patenttihakemuksen julkiseksitilopäivä - Patentansökans **18.10.2023**
publiceringsdag - Patent application available to the public
- (86) Kansainvälinen hakemus - Internationell **09.12.2021 PCT/EP2021084987**
ansökan - International application
- (30) Etuoikeus - Prioritet - Priority
10.12.2020 EP EP20213020

(73) Haltija - Innehavare - Holder
1 • Bayer Aktiengesellschaft, Kaiser-Wilhelm-Allee 1, 51373 Leverkusen, (DE)

(72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor

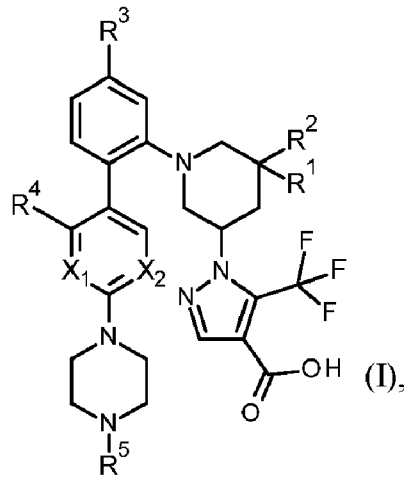
- 1 • **VAKALOPOULOS, Alexandros**, 40721 Hilden, (DE)
- 2 • **COLLIN-KRÖPELIN, Marie-Pierre**, 79576 Weil am Rhein, (DE)
- 3 • **ORTEGA HERNANDEZ, Nuria**, 42281 Wuppertal, (DE)
- 4 • **DIESKAU, Andre**, 42115 Wuppertal, (DE)
- 5 • **BOULTADAKIS-ARAPINIS, Melissa**, 40215 Düsseldorf, (DE)
- 6 • **CANDISH, Lisa**, 42115 Wuppertal, (DE)
- 7 • **STELFELD, Timo**, 14197 Berlin, (DE)
- 8 • **MATHAR, Ilka**, 40235 Düsseldorf, (DE)
- 9 • **HOFMEISTER, Lucas, Hudson**, 10245 Berlin, (DE)
- 10 • **SANDNER, Peter**, 42113 Wuppertal, (DE)
- 11 • **WUNDER, Frank**, 42117 Wuppertal, (DE)
- 12 • **DIETZ, Lisa**, 42111 Wuppertal, (DE)
- 13 • **WEBSTER, Robert, Alan**, 13467 Berlin, (DE)
- 14 • **SCHMECK, Carsten**, 45472 Mülheim, (DE)
- 15 • **MONDRITZKI, Thomas**, 45130 Essen, (DE)

(74) Asiamies - Ombud - Agent
Papula Oy, P.O.Box 981, 00101 Helsinki, (FI)

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention
SUBSTITUOITUJA PYRATSOLOPIPERIDIINIKARBOKSYLIHAPPOJA
SUBSTITUTED PYRAZOLO PIPERIDINE CARBOXYLIC ACIDS

PATENTTIVAATIMUKSET

1. Kaavan (I) mukainen yhdiste



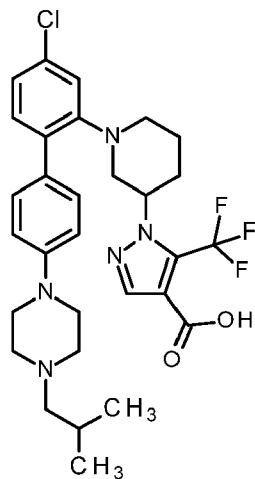
jossa

5 R^1 esittää vetyä tai halogeenia,
 R^2 esittää vetyä tai halogeenia,
 R^3 esittää klooria tai trifluorimetyyliä,
 R^4 esittää vetyä tai C_1 - C_4 -alkyyliä
 R^5 esittää C_1 - C_6 -alkyyliä
 X^1 esittää typpeä tai hiiltä
 10 X^2 esittää typpeä tai hiiltä
 tai jokin sen suoloista, sen solvaateista tai
 sen suolojen solvaateista.

2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste,
 tunnettu siitä, että

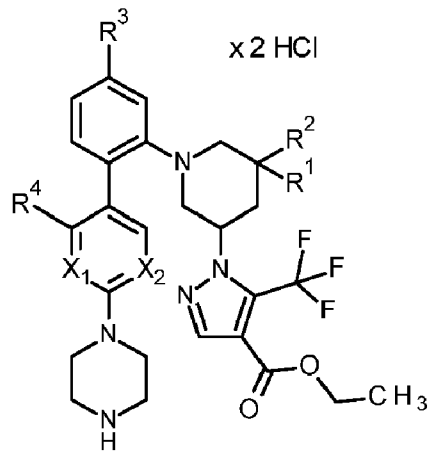
15 R^1 esittää vetyä, fluoria
 R^2 esittää vetyä, fluoria
 R^3 esittää klooria tai trifluorimetyyliä
 R^4 esittää vetyä tai metyyliä
 R^5 esittää isobutylyliä
 20 X^1 esittää typpeä tai hiiltä
 X^2 esittää typpeä tai hiiltä
 tai jokin sen suoloista, sen solvaateista tai
 sen suolojen solvaateista.

3. Patenttivaatimuksen 1 tai mukainen yhdiste,
 25 jolla on kaava



tai jokin sen suoloista, sen solvaateista tai sen suolojen solvaateista.

4. Menetelmä jonkin patenttivaatimuksista 1-3 mukaisen kaavan (I) mukaisen yhdisteen tai jonkin sen
 5 suoloista, sen solvaateista tai sen suolojen solvaateista valmistamiseksi, tunnettu siitä, että ensimmäisessä vaiheessa [B] kaavan (IV) mukaisten yhdisteiden



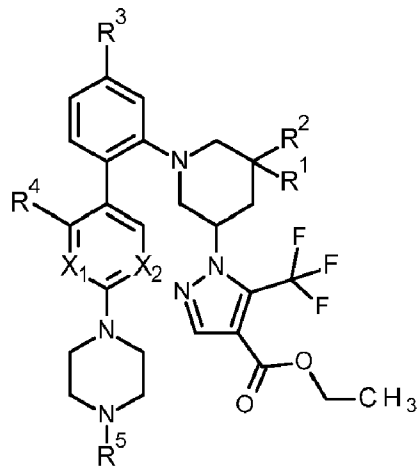
(IV), jossa R^1 , R^2 , R^3 , R^4

10 ja X^1 ja X^2 ovat kuten edellä on määritelty, annetaan reagoida kaavan (III) mukaisten yhdisteiden kanssa

R^{5a} -CHO (III),

15 jossa R^{5a} esittää C_1 - C_3 -alkyyliä, edullisesti isopropyyliä,

pelkistimen, sopivan liuottimen ja emäksen läsnä ollessa kaavan (II) mukaisten yhdisteiden tuottamiseksi



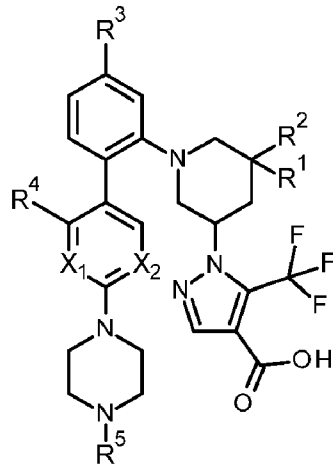
(II) jossa R^1 , R^2 , R^3 , R^4 ,

R^5 ja X^1 ja X^2 ovat kuten edellä on määritelty

ja

toisessa vaiheessa [A]

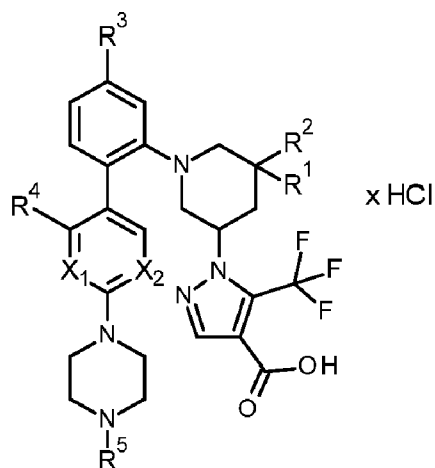
5 kaavan (II) mukaisten yhdisteiden annetaan reagoita emäksen kanssa kaavan (I) mukaisten yhdisteiden tuottamiseksi,



(I) jossa R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 ja

X^1 ja X^2 ovat kuten edellä on määritelty

10 kaavan (I) mukaiset yhdisteet valinnaisesti muunnetaan kolmannessa vaiheessa [A]* vastaaviksi kaavan (Ia) mukaisiksi suoloiksi



(Ia) sopivan hapon läsnä

ollessa sopivassa liuottimessa.

5. Jonkin patenttivaatimuksista 1-3 mukainen yhdiste käytettäväksi tautien hoidossa ja/tai estohoidossa.

6. Jonkin patenttivaatimuksista 1-3 mukainen yhdiste käytettäväksi sydämen vajaatoiminnan (HF_rEF, HF_mrEF ja HF_pEF), verenpaineaudin (HTN), kroonisen ja diabeettisen munuaistaudin (CKD, DKD), keuhkoverenpainetaudin (PH), systeemisen skleroosin (SSc), sirppisolautaudin (SCD), neurodegeneratiivisten tautien ja dementioiden ja diabeettisen jalkahaavauman (DFU) hoidossa ja/tai estohoidossa.

7. Jonkin patenttivaatimuksista 1-3 mukaisen yhdisteen käyttö lääkkeen valmistamiseen tautien hoidossa ja/tai estohoidossa käytettäväksi.

8. Jonkin patenttivaatimuksista 1-3 mukaisen yhdisteen käyttö lääkkeen valmistamiseen käytettäväksi sydämen vajaatoiminnan (HF_rEF, HF_mrEF ja HF_pEF), verenpaineaudin (HTN), kroonisen ja diabeettisen munuaistaudin (CKD, DKD), keuhkoverenpainetaudin (PH), systeemisen skleroosin (SSc), sirppisolautaudin (SCD), neurodegeneratiivisten tautien ja dementioiden ja diabeettisen jalkahaavauman (DFU) hoidossa ja/tai estohoidossa.

9. Lääke, joka käsittää jonkin patenttivaatimuksista 1-3 mukaisen yhdisteen yhdessä inertin, myrkyttömän farmaseuttisesti sopivan apuaineen kanssa.

10. Patenttivaatimuksen 9 mukainen lääke käytettäväksi sydämen vajaatoiminnan (HF_rEF, HF_mrEF ja HF_pEF), verenpainetaudin (HTN), kroonisen ja diabeettisen munuaistaudin (CKD, DKD), keuhkoverenpainetaudin (PH), systeemisen skleroosin (SSc), sirppisolutaudin (SCD), neurodegeneratiivisten tautien ja dementioiden ja diabeettisen jalkahaavauman (DFU) hoidossa ja/tai estohoidossa.