

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

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

- (10) **FI/EP3808747 T3**
- (12) **EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION**
- (45) Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning - **07.02.2025**
Translation available to the public
- (97) Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för **18.12.2024**
det europeiska patentet - Date of grant of European patent
- (51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -
International patent classification
C07D 471/04 (2006 . 01)
A61P 1/04 (2006 . 01)
A61K 31/437 (2006 . 01)
A61K 31/444 (2006 . 01)
A61K 31/4545 (2006 . 01)
A61K 31/4709 (2006 . 01)
A61K 31/5377 (2006 . 01)
- (96) Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan - **EP19859445.9**
European patent application
- (22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date **12.09.2019**
- (97) Patenttihakemuksen julkiseksitulosopäivä - Patentansökans **21.04.2021**
publiceringsdag - Patent application available to the public
- (86) Kansainvälinen hakemus - Internationell **12.09.2019 PCT/JP2019035792**
ansökan - International application
- (30) Etuoikeus - Prioritet - Priority
13.09.2018 JP JP2018171839

(73) Haltija - Innehavare - Holder
1• KISSEI PHARMACEUTICAL CO., LTD., 19-48, Yoshino, Matsumoto-shi Nagano 399-8710, (JP)

(72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor
1• MORIYAMA Akihiro, c/o Central Research Laboratories, Kissei Pharmaceutical Co., Ltd., 4365-1, Hotaka- Kashiwabara, Azumino-shi, Nagano 399-8304, (JP)
2• TAKIGAWA Yasushi, c/o Central Research Laboratories, Kissei Pharmaceutical Co., Ltd., 4365-1, Hotaka- Kashiwabara, Azumino-shi, Nagano 399-8304, (JP)

(74) Asiamies - Ombud - Agent
Nordic Patent Service A/S, Bredgade 30, 1260 Copenhagen K, (DK)

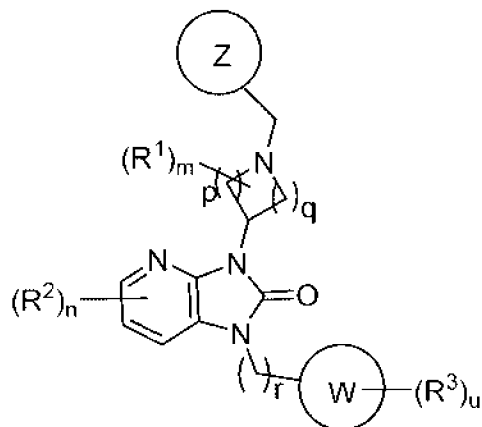
(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention
Imidatsopyridinoniyhdiste
IMIDAZOPYRIDINONE COMPOUND

PATENTTIVAATIMUKSET

1.

Yhdiste, jota edustaa kaava (I):

[Kem. 1]



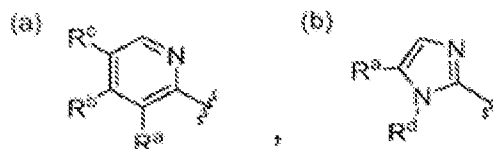
5

jossa

rengas W on fenyylä tai 5- tai 6-jäseninen heteroaryyli;

rengas Z on ryhmä, joka on valittu ryhmästä, joka koostuu seuraavista (a)–(c):

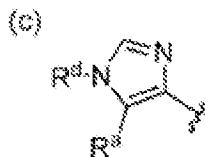
[Kem. 2]



10

ja

[Kem. 3]



jossa

15 R^a, R^b ja R^c ovat kukin itsenäisesti vetyatomi, halogeeni-atomi, C₁₋₆-alkyyli, syaani, hydroksi tai karboksi; ja

R^d on vetyatomi tai C₁₋₆-alkyyli;

R¹ on vetyatomi, halogeeni-atomi, C₁₋₆-alkyyli, syaani, hydroksi tai karboksi, jolloin kun m on 2 tai 3, kaksi tai useampi R¹ voi olla keskenään erilaisia;

20 R² on vetyatomi, halogeeni-atomi, C₁₋₆-alkyyli, halo-C₁₋₆-alkyyli, C₁₋₆-alkoksi, hydroksi, -

CO_2R^4 tai $-\text{CONR}^5\text{R}^5$, jolloin kun n on 2 tai 3, kaksi tai useampi R^2 voi olla keskenään erilaisia;

R^4 on vetyatomi tai C_{1-6} -alkyyli; ja

5 R^5 ja R^5 ovat kukin itsenäisesti vetyatomi, C_{1-6} -alkyyli, karboksi- C_{1-6} -alkyyli, hydroksi- C_{1-6} -alkyyli, halo- C_{1-6} -alkyyli, C_{3-8} -sykloalkyyli tai 3–8-jäseninen heterosykloalkyyli;

R^3 on vetyatomi, halogeeniatomi, C_{1-6} -alkyyli, halo- C_{1-6} -alkyyli, C_{1-6} -alkoksi, halo- C_{1-6} -alkoksi, C_{2-6} -alkenylyli, C_{1-6} -alkyylisulfanyyli, C_{1-6} -alkyylisulfinyyli, C_{1-6} -alkyylisulfonyyli, hydroksi, syano, nitro, $-\text{NR}^6\text{R}^6$, $-\text{CO}_2\text{R}^7$, $-\text{CONR}^8\text{R}^8$ tai seuraava ryhmä A, jolloin kun u on 2 tai 3, kaksi tai useampi R^3 voi olla keskenään erilaisia;

10 R^6 ja R^6 ovat kukin itsenäisesti vetyatomi tai C_{1-6} -alkyyli;

R^7 on vetyatomi tai C_{1-6} -alkyyli;

R^8 ja R^8 ovat kukin itsenäisesti vetyatomi, C_{1-6} -alkyyli, karboksi- C_{1-6} -alkyyli, hydroksi- C_{1-6} -alkyyli, halo- C_{1-6} -alkyyli, C_{3-8} -sykloalkyyli tai 3–8-jäseninen heterosykloalkyyli; ryhmä A on ryhmä, joka on valittu ryhmästä, joka koostuu seuraavista (a)–(h):

15 (a) C_{6-10} -aryyli, joka on substituoinaton tai substituoitu 1–3 ryhmällä, jotka on valittu substituenttiryhmästä B,

(b) 5- tai 6-jäseninen heteroaryyli, joka on substituoinaton tai substituoitu 1–3 ryhmällä, jotka on valittu substituenttiryhmästä B,

20 (c) C_{6-10} -aryyli- C_{1-6} -alkyyli, joka on substituoinaton tai substituoitu 1–3 ryhmällä, jotka on valittu substituenttiryhmästä B,

(d) C_{6-10} -aryylioksi, joka on substituoinaton tai substituoitu 1–3 ryhmällä, jotka on valittu substituenttiryhmästä B,

(e) 5- tai 6-jäseninen heteroaryyli- C_{1-6} -alkyyli, joka on substituoinaton tai substituoitu 1–3 ryhmällä, jotka on valittu substituenttiryhmästä B,

25 (f) 5- tai 6-jäseninen heteroaryylioksi, joka on substituoinaton tai substituoitu 1–3 ryhmällä, jotka on valittu substituenttiryhmästä B,

(g) C_{3-8} -sykloalkyyli, joka on substituoinaton tai substituoitu 1–3 ryhmällä, jotka on valittu substituenttiryhmästä B, ja

30 (h) 3–8-jäseninen heterosykloalkyyli, joka on substituoinaton tai substituoitu 1–3 ryhmällä, jotka on valittu substituenttiryhmästä B,

jolloin substituenttiryhmä B on ryhmä, joka koostuu halogeeniatomista, C_{1-6} -alkyylista, halo- C_{1-6} -alkyylista, C_{1-6} -alkoksista, halo- C_{1-6} -alkoksista, hydroksista, syaanista, $-\text{NR}^9\text{R}^9$:stä, $-\text{NR}^9\text{SO}_2\text{R}^{10}$:stä, $-\text{CO}_2\text{R}^{10}$:stä ja $-\text{CONR}^{11}\text{R}^{11}$:sta;

jolloin R^9 ja R^9 ovat kukin itsenäisesti vetyatomi tai C_{1-6} -alkyyli;

R^{10} on vetyatomi tai C_{1-6} -alkyyli; ja

R^{11} ja $R^{11'}$ ovat kukin itsenäisesti vetyatomi, C_{1-6} -alkyyli, karboksi- C_{1-6} -alkyyli, hydroksi- C_{1-6} -alkyyli, halo- C_{1-6} -alkyyli, C_{3-8} -sykloalkyyli tai 3–8-jäseninen heterosykloalkyyli;

m, n ja u ovat kukin itsenäisesti kokonaisluku 1–3;

5 p ja q ovat kukin itsenäisesti 1 tai 2; ja

r on 0;

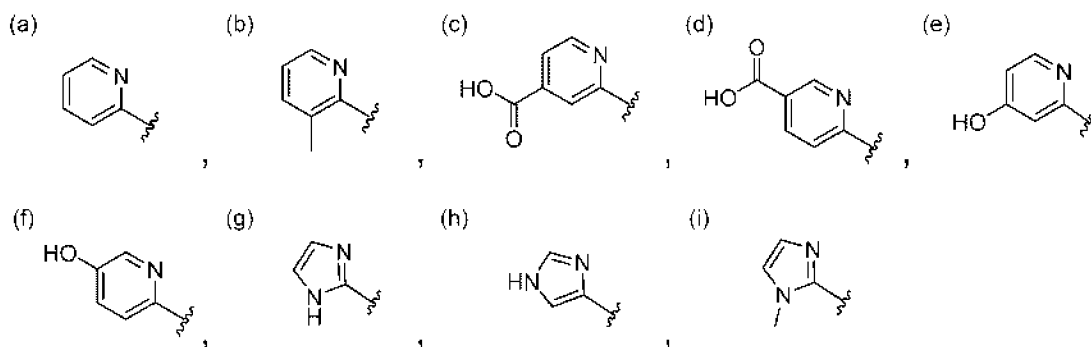
tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

2.

Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, jossa rengas Z on ryhmä, joka on valittu ryhmästä,

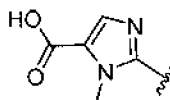
10 joka koostuu seuraavista (a)–(j):

[Kem. 4]



15 ja

[Kem. 5]



tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

20 3.

Patenttivaatimuksen 2 mukainen yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, jossa p on 2 ja q on 1.

4.

Patenttivaatimuksen 3 mukainen yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, jossa R^1

25 on vetyatomi tai halogeeniatomi.

5.

Patenttivaatimuksen 4 mukainen yhdiste:

jossa R^2 on vetyatomi, C_{1-6} -alkyyli, halo- C_{1-6} -alkyyli, C_{1-6} -alkoksi, karboksi tai -

CONR⁵R^{5'};

jossa R⁵ ja R^{5'} ovat kukin itsenäisesti vetyatomi, karboksi-C₁₋₆-alkyyli tai 3–8-jäseninen heterosykloalkyyli;

tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

5 6.

Patenttivaatimuksen 5 mukainen yhdiste:

jossa R³ on vetyatomi, halogeeniatomi, C₁₋₆-alkyyli, halo-C₁₋₆-alkyyli, C₁₋₆-alkoksi, halo-C₁₋₆-alkoksi, C₂₋₆-alkenyyl, C₁₋₆-alkyyliisulfanyyli, C₁₋₆-alkyyliisulfonyyli, hydroksi, syano, -CO₂R⁷, -CONR⁸R⁸ tai ryhmä A;

10 jossa R⁷:llä ja u:lla on patenttivaatimuksessa 1 kuvatut merkitykset;

R⁸ ja R⁸ ovat kukin itsenäisesti vetyatomi tai karboksi-C₁₋₆-alkyyli; ja

ryhmä A on fenyyl, joka on substituoinaton tai substituoitu 1–3 ryhmällä, jotka on valittu substituenttiryhmästä B, tai substituoinaton 5- tai 6-jäseninen heteroaryyli;

jossa substituenttiryhmä B on halogeeniatomi, C₁₋₆-alkyyli, halo-C₁₋₆-alkyyli, C₁₋₆-alkoksi, halo

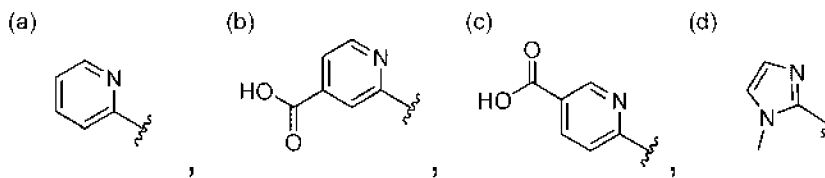
15 C₁₋₆-alkoksi, hydroksi, syaani tai karboksi;

tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

7.

Patenttivaatimuksen 6 mukainen yhdiste, jossa rengas Z on ryhmä, joka on valittu ryhmästä, joka koostuu seuraavista (a)–(e):

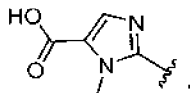
20 [Kem.6]



ja

[Kem.7]

(e)



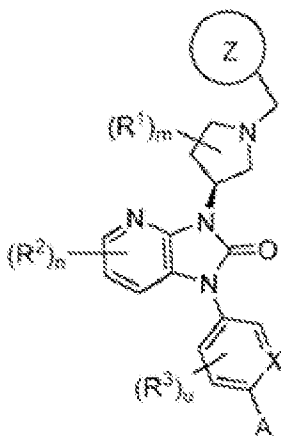
25

tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

8.

Patenttivaatimuksen 7 mukainen yhdiste, jota edustaa seuraava kaava:

[Kem.8]



jossa

X on CR³ tai N;

u on 1 tai 2;

5 R¹:llä on patenttivaatimuksessa 4 kuvatut merkitykset;

R²:lla on patenttivaatimuksessa 5 kuvatut merkitykset;

R³ on vetyatomi, C₁₋₆-alkyyli tai hydroksi;

ryhmällä A on patenttivaatimuksessa 6 kuvatut merkitykset;

renkaalla Z on patenttivaatimuksessa 7 kuvatut merkitykset; ja

10 m:llä ja n:llä on patenttivaatimuksessa 1 kuvatut merkitykset;

tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

9.

Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste:

jossa u on 2 tai 3;

15 yksi R³ on ryhmä A; ja

muut R³:t ovat kukin itsenäisesti vetyatomi, halogeeniatomi, C₁₋₆-alkyyli, halo-C₁₋₆-alkyyli, C₁₋₆-alkoksi, halo-C₁₋₆-alkoksi, C₂₋₆-alkenylyli, C₁₋₆-alkyyლისulfanyyli, C₁₋₆-alkyyლისulfonyyli, hydroksi, syano, nitro, -NR⁶R^{6'}, -CO₂R⁷ tai -CONR⁸R^{8'};

jossa ryhmällä A, R⁶:lla, R^{6'}:lla, R⁷:llä, R⁸:lla ja R^{8'}:lla on patenttivaatimuksessa 1 kuvatut

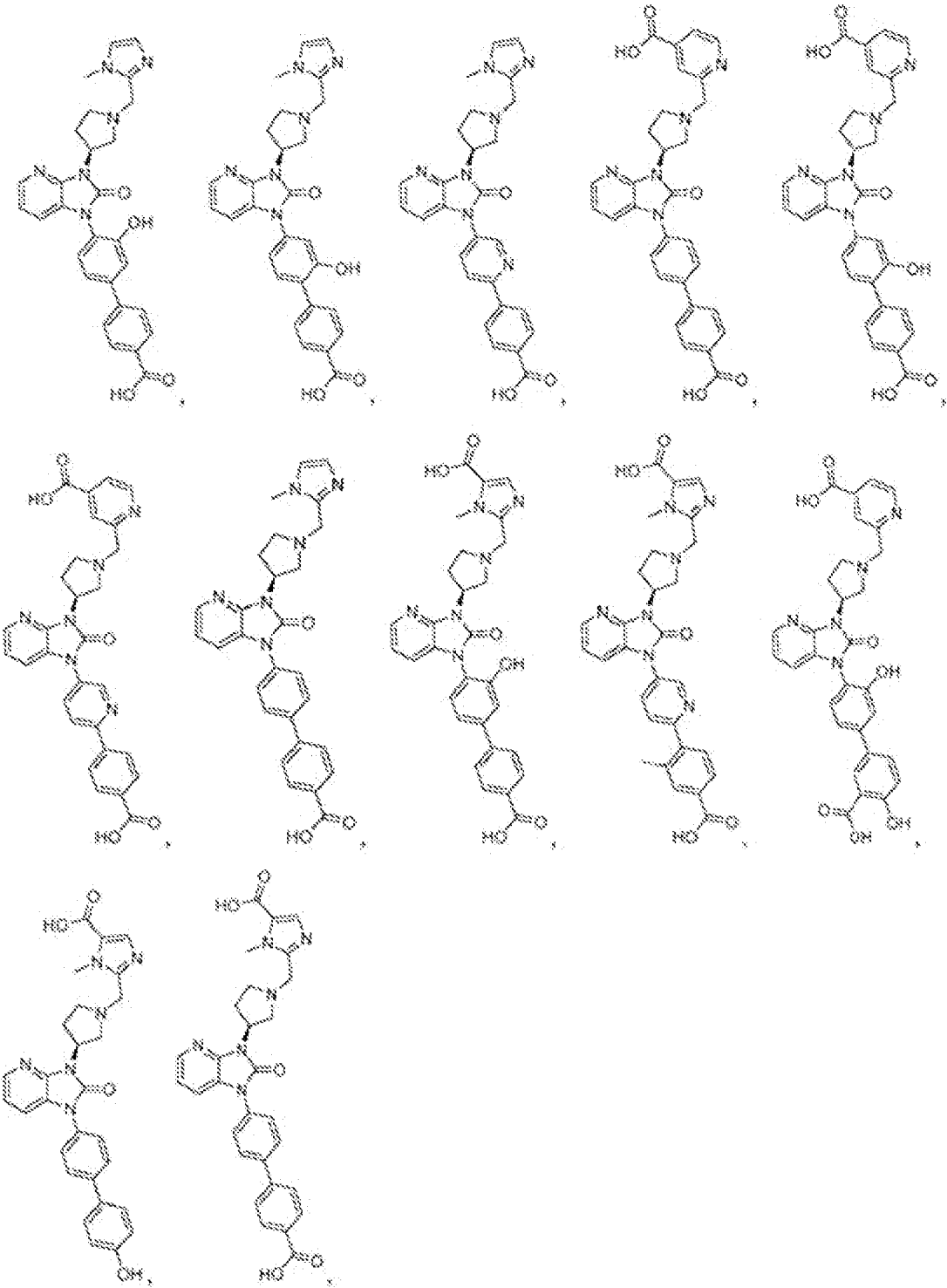
20 merkitykset;

tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

10.

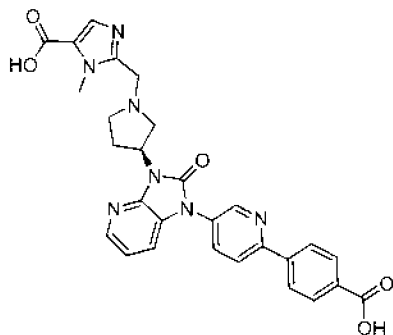
Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, joka valitaan ryhmästä, joka koostuu seuraavista yhdisteistä:

25 [Kem.9]



ja

[Kem.10]

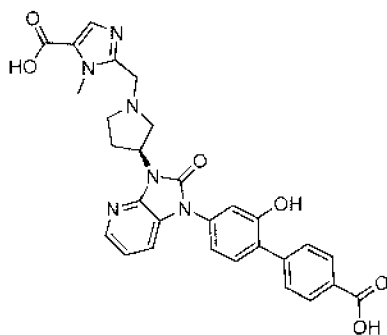


tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

11.

Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, jota edustaa seuraava kaava:

5 [Kem. 11.



tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

12.

10 Farmaseuttinen koostumus, joka käsittää jonkin patenttivaatimuksista 1–11 mukaisen yhdisteen tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävän suolan ja vähintään yhden farmaseuttisen lisäaineen.

13.

Patenttivaatimuksen 12 mukainen farmaseuttinen koostumus, joka on farmaseuttinen koostumus käytettäväksi tulehduksellisen suolistosairauden hoidossa.

15 14.

Farmaseuttinen koostumus käytettäväksi patenttivaatimuksen 13 mukaisesti, jolloin tulehduksellinen suolistosairaus on haavainen koliitti tai Crohnin tauti.