

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

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

(10)

EP/EP3630744 T3

(12)

**EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION**

(45)

Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning -
Translation available to the public

21.03.2023

(97)

Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för
det europeiska patentet - Date of grant of European patent

25.01.2023

(96)

Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan -
European patent application

EP18806431.5

Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date

(97)

Patenttihakemuksen julkiseksitulosopäivä - Patentansökans
publiceringsdag - Patent application available to the public

08.04.2020

(86)

Kansainvälinen hakemus - Internationell
ansökan - International application

22.05.2018 PCT/US2018033959

(30)

Etuoikeus - Prioritet - Priority

23.05.2017 US US201762510213 P

(73)

Haltija - Innehavare - Holder

1• H. Lundbeck A/S, Ottiliavej 9, 2500 Valby, (DK)

(72)

Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1• GRICE, Cheryl A., 10835 Road to the Cure Suite 250, San Diego California 92121, (US)

2• WIENER, John J. M., 10835 Road to the Cure Suite 250, San Diego California 92121, (US)

3• WEBER, Olivia D., 10835 Road to the Cure Suite 250, San Diego California 92121, (US)

4• DUNCAN, Katharine K., 10835 Road to the Cure Suite 250, San Diego California 92121, (US)

(74)

Asiamies - Ombud - Agent

Kolster Oy Ab, Salmisaarenaukio 1, 00180 Helsinki, (FI)

(54)

Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

MAGL:n pyratsoli-inhibiittoreita

PYRAZOL MAGL-HÄMMARE

PYRAZOLE MAGL INHIBITORS

R^5 on H, halogeeni, C_{1-6} -alkyyli, C_{1-6} -halogeenialkyyli, C_{1-6} -halogeenialkoksi tai fenyyli;

R^6 on H, halogeeni tai C_{1-6} -alkyyli;

R^7 on H, C_{1-6} -alkyyli, C_{1-6} -halogeenialkyyli, $-C_{1-6}$ -alkyyli-OH, C_{2-9} -heterosykloalkyyli, C_{6-10} -aryyli tai C_{1-9} -heteroaryyli, jolloin C_{2-9} -heterosykloalkyyli, C_{6-10} -aryyli ja C_{1-9} -heteroaryyli on valinnaisesti substituoitu 1 tai 2 R^{14} :llä;

kukin R^8 ja kukin R^9 on valittu toisista riippumatta ryhmästä, jonka muodostavat H ja C_{1-6} -alkyyli; tai R^8 ja R^9 muodostavat yhdessä typhen kanssa, johon ne ovat kiinnittyneet, heterosykloalkyylirenkkaan;

kumpikin radikaaleista R^{10} ja R^{11} on toisesta riippumatta H tai C_{1-6} -alkyyli;

R^{12} on H, halogeeni tai C_{1-6} -alkyyli;

R^{13} on H tai C_{1-6} -alkyyli;

kukin R^{14} on toisista riippumatta valittu ryhmästä, jonka muodostavat halogeeni, -OH, C_{1-6} -alkyyli, C_{1-6} -halogeenialkyyli, C_{1-6} -alkoksi, $-C_{1-6}$ -alkyyli-OH, C_{3-8} -sykloalkyyli, $-C(O)OH$, $-C(O)NR^8R^9$, $-SO_2-C_{1-6}$ -alkyyli ja $-N(R^{17})C(O)-C_{1-6}$ -alkyyli;

R^{15} on H tai C_{1-6} -alkyyli;

R^{16} on H, C_{1-6} -alkyyli, $-C(O)-C_{1-6}$ -alkyyli, $-C_{1-6}$ -alkyyli-OH tai $-CH_2CO_2H$;

R^{17} on H tai C_{1-6} -alkyyli;

R^{18} on H tai C_{1-6} -alkyyli;

v on 0 tai 1;

n on 0 tai 1;

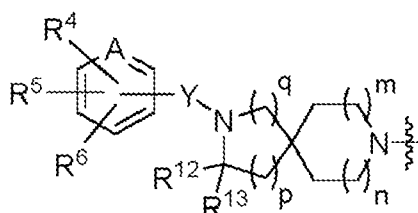
m on 0 tai 1;

p on 0, 1 tai 2; ja

q on 0, 1 tai 2;

tai sen solvaatti, hydraatti, tautomeeri, N-oksidi, stereoisomeeri tai farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste tai sen solvaatti, hydraatti, tautomeeri, N-oksidi, stereoisomeeri tai farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, jolloin R^3 on



3. Patenttivaatimuksen 2 mukainen yhdiste tai sen solvaatti, hydraatti, tautomeeri, N-oksidi, stereoisomeeri tai farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, jolloin m on 1, n on 1, q on 0 ja p on 2.

4. Jommankumman patenttivaatimuksen 2–3 mukainen yhdiste tai sen solvaatti, hydraatti, tautomeeri, N-oksidi, stereoisomeeri tai farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, jolloin Y on $-\text{CH}_2-$.

5. Jonkin patenttivaatimuksen 1–4 mukainen yhdiste tai sen solvaatti, hydraatti, tautomeeri, N-oksidi, stereoisomeeri tai farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, jolloin R^{13} on H ja R^{12} on H.

6. Jonkin patenttivaatimuksen 2–5 mukainen yhdiste tai sen solvaatti, hydraatti, tautomeeri, N-oksidi, stereoisomeeri tai farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, jolloin A on C(H).

7. Jonkin patenttivaatimuksen 2–6 mukainen yhdiste tai sen solvaatti, hydraatti, tautomeeri, N-oksidi, stereoisomeeri tai farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, jolloin R^6 on H.

8. Jonkin patenttivaatimuksen 1–7 mukainen yhdiste tai sen solvaatti, hydraatti, tautomeeri, N-oksidi, stereoisomeeri tai farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, jolloin R^4 on halogeeni, $-\text{OR}^7$, C_{1-6} -alkyyli, C_{2-6} -alkynyli, C_{1-6} -halogeenialkyyli, $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^8\text{R}^9$, C_{2-9} -heterosykloalkyyli, C_{6-10} -aryyli tai C_{1-9} -heteroaryyli, jolloin C_{2-9} -heterosykloalkyyli, $-\text{C}_{1-6}$ -alkyyli- C_{2-9} -heterosykloalkyyli, C_{6-10} -aryyli ja C_{1-9} -heteroaryyli on valinnaisesti substituoitu 1 tai 2 R^{14} :llä.

9. Patenttivaatimuksen 8 mukainen yhdiste tai sen solvaatti, hydraatti, tautomeeri, N-oksidi, stereoisomeeri tai farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, jolloin R^4 on halogeeni tai R^4 on C_{2-9} -heterosykloalkyyli, joka on valinnaisesti substituoitu 1 tai 2 R^{14} :llä.

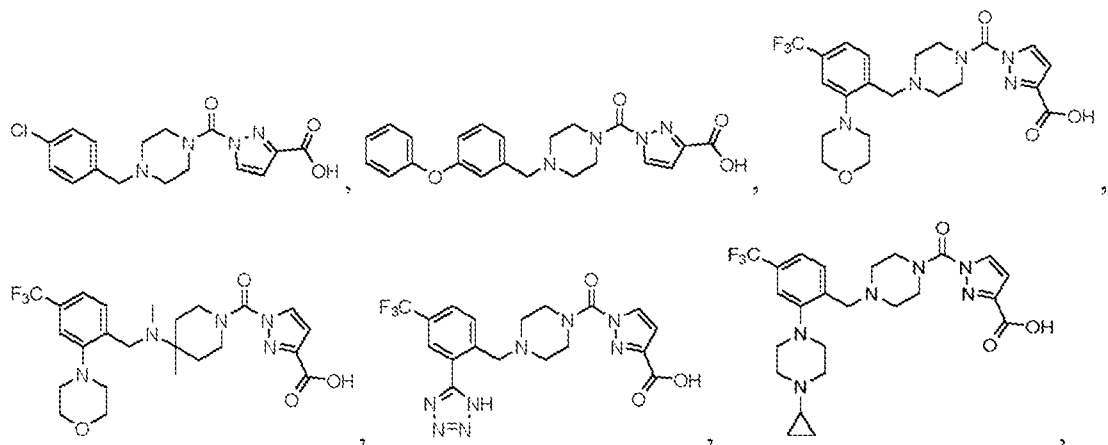
10. Patenttivaatimuksen 9 mukainen yhdiste tai sen solvaatti, hydraatti, tautomeeri, N-oksidi, stereoisomeeri tai farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, jolloin R^4 on substituoimaton C_{2-9} -heterosykloalkyyli.

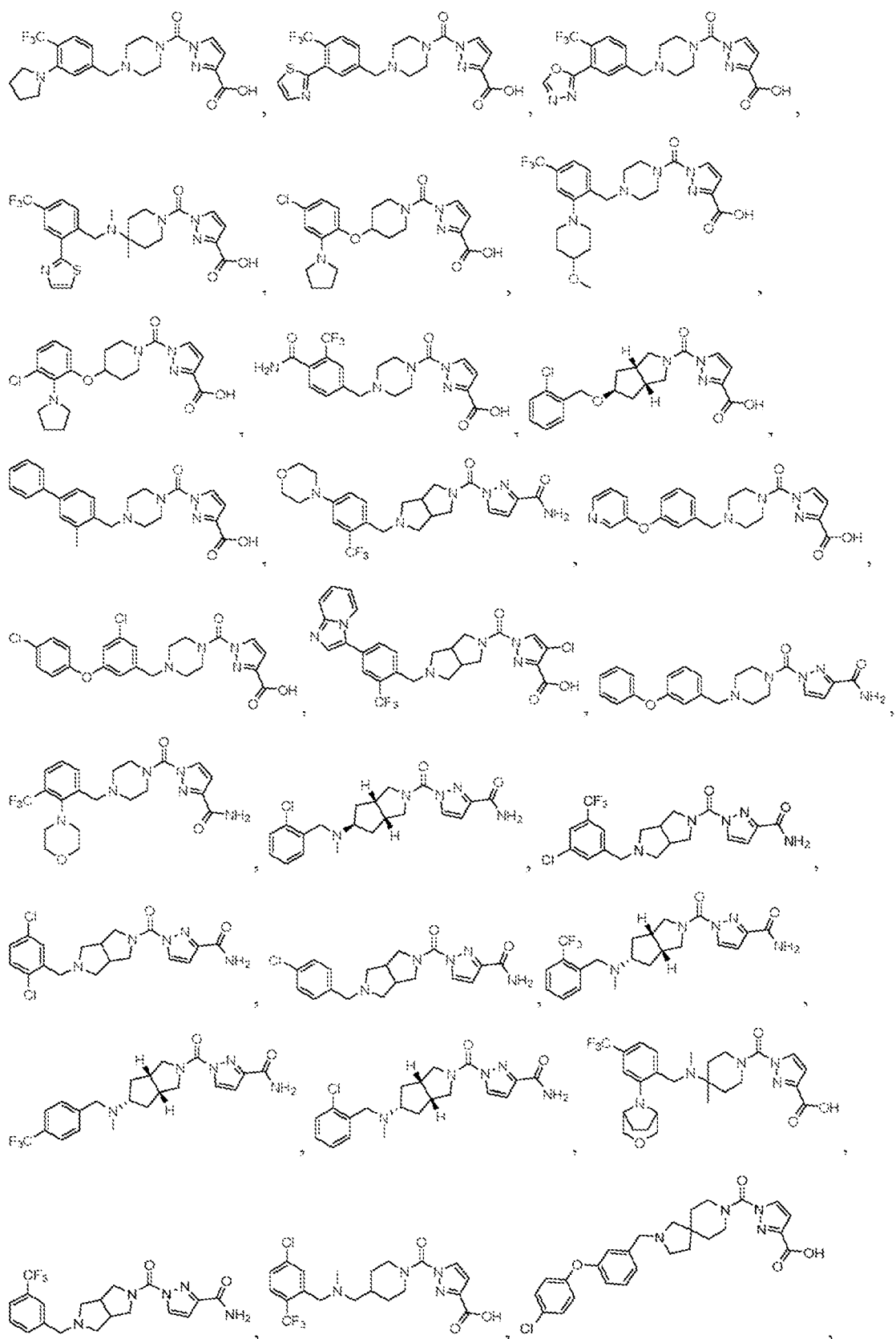
11. Jonkin patenttivaatimuksen 1–10 mukainen yhdiste tai sen solvaatti, hydraatti, tautomeeri, N-oksidi, stereoisomeeri tai farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, jolloin R^5 on H, halogeeni, C_{1-6} -alkyyli, C_{1-6} -halogeenialkyyli tai C_{1-6} -halogeenialkoksi.

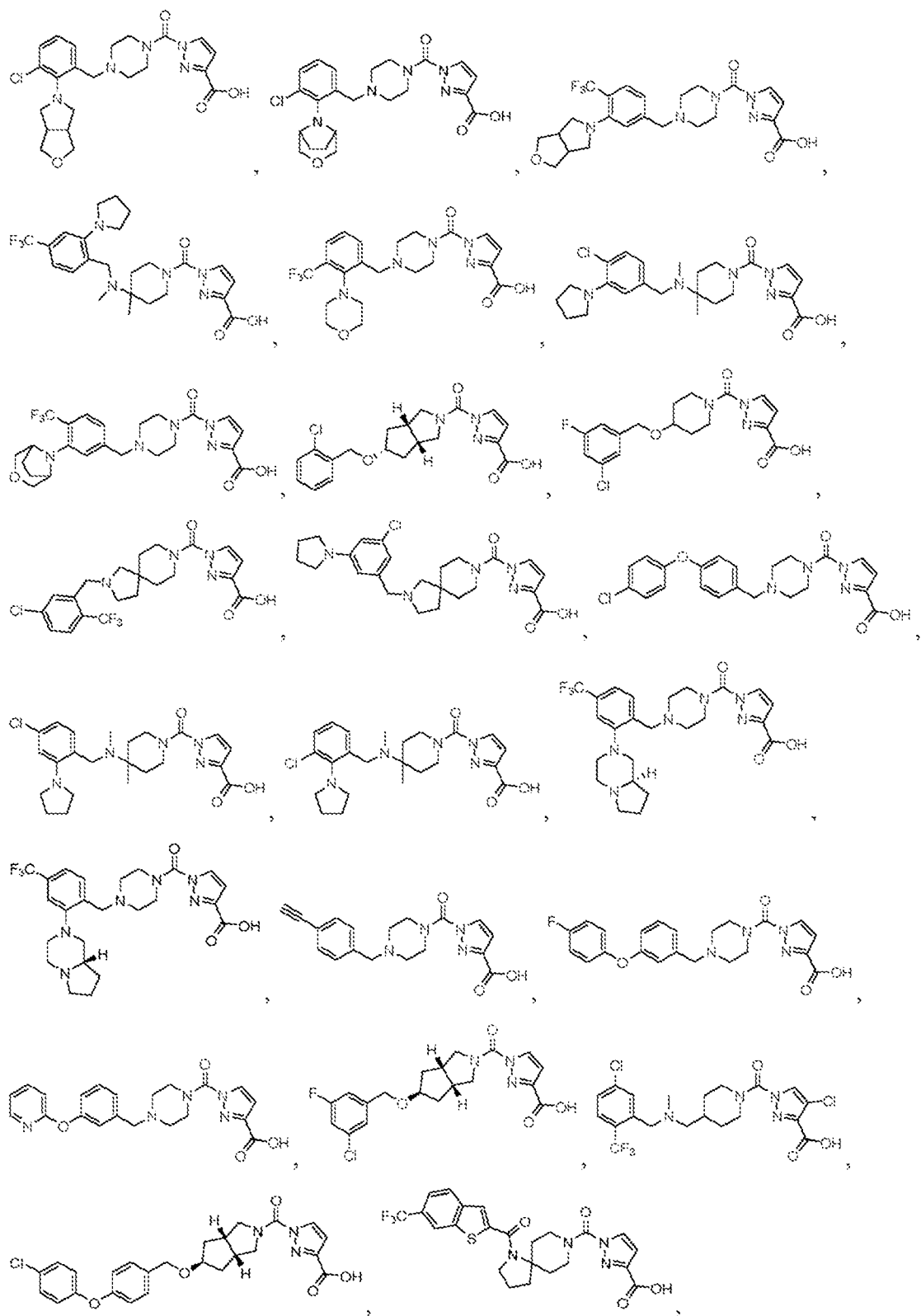
12. Jonkin patenttivaatimuksen 1–11 mukainen yhdiste tai sen solvaatti, hydraatti, tautomeeri, N-oksidi, stereoisomeeri tai farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, jolloin R^2 on H.

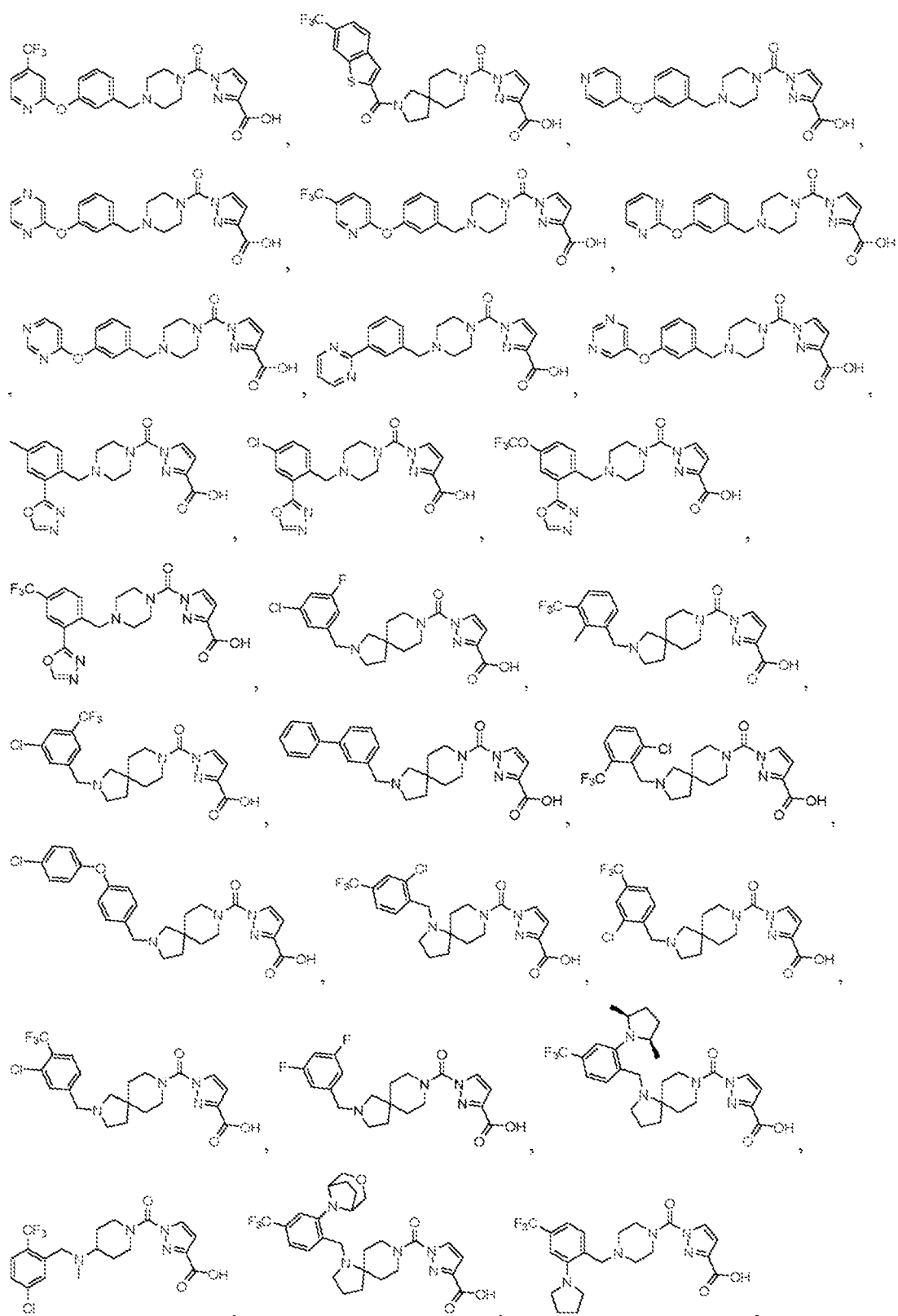
13. Jonkin patenttivaatimuksen 1–12 mukainen yhdiste tai sen solvaatti, hydraatti, tautomeeri, N-oksidi, stereoisomeeri tai farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, jolloin R^1 on $-C(O)OR^{15}$ ja R^{15} on H.

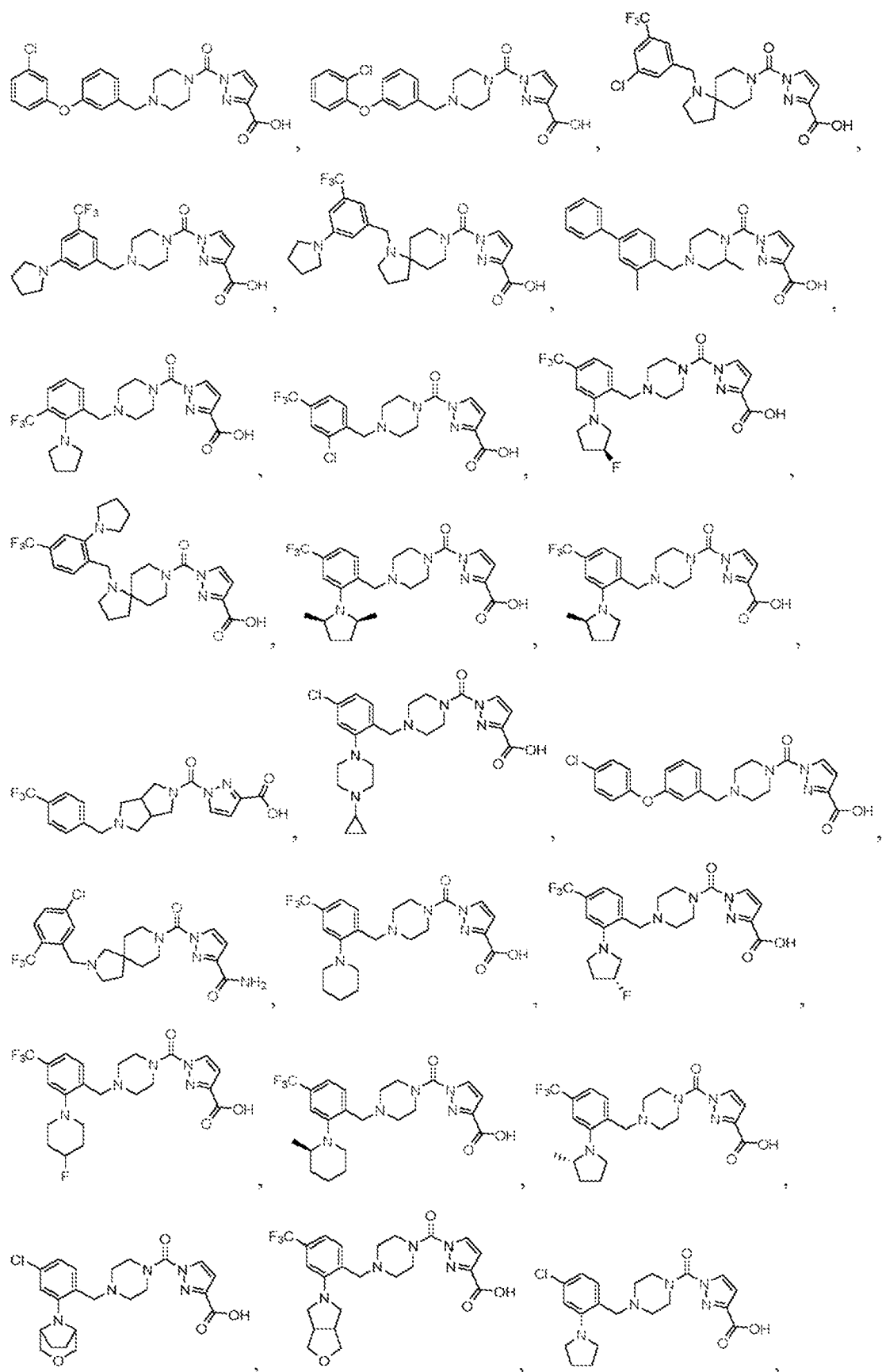
14. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, joka on valittu seuraavista:

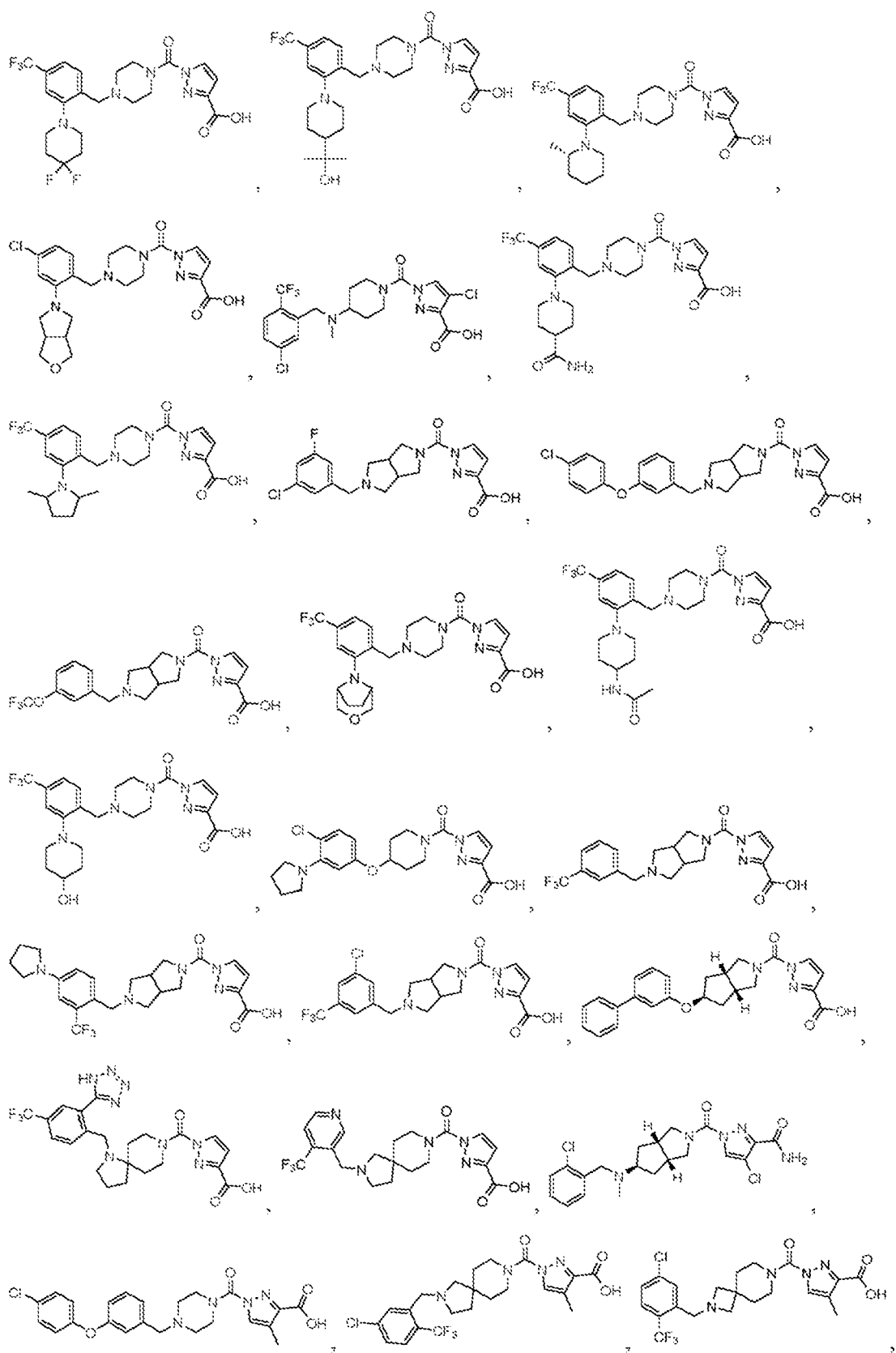


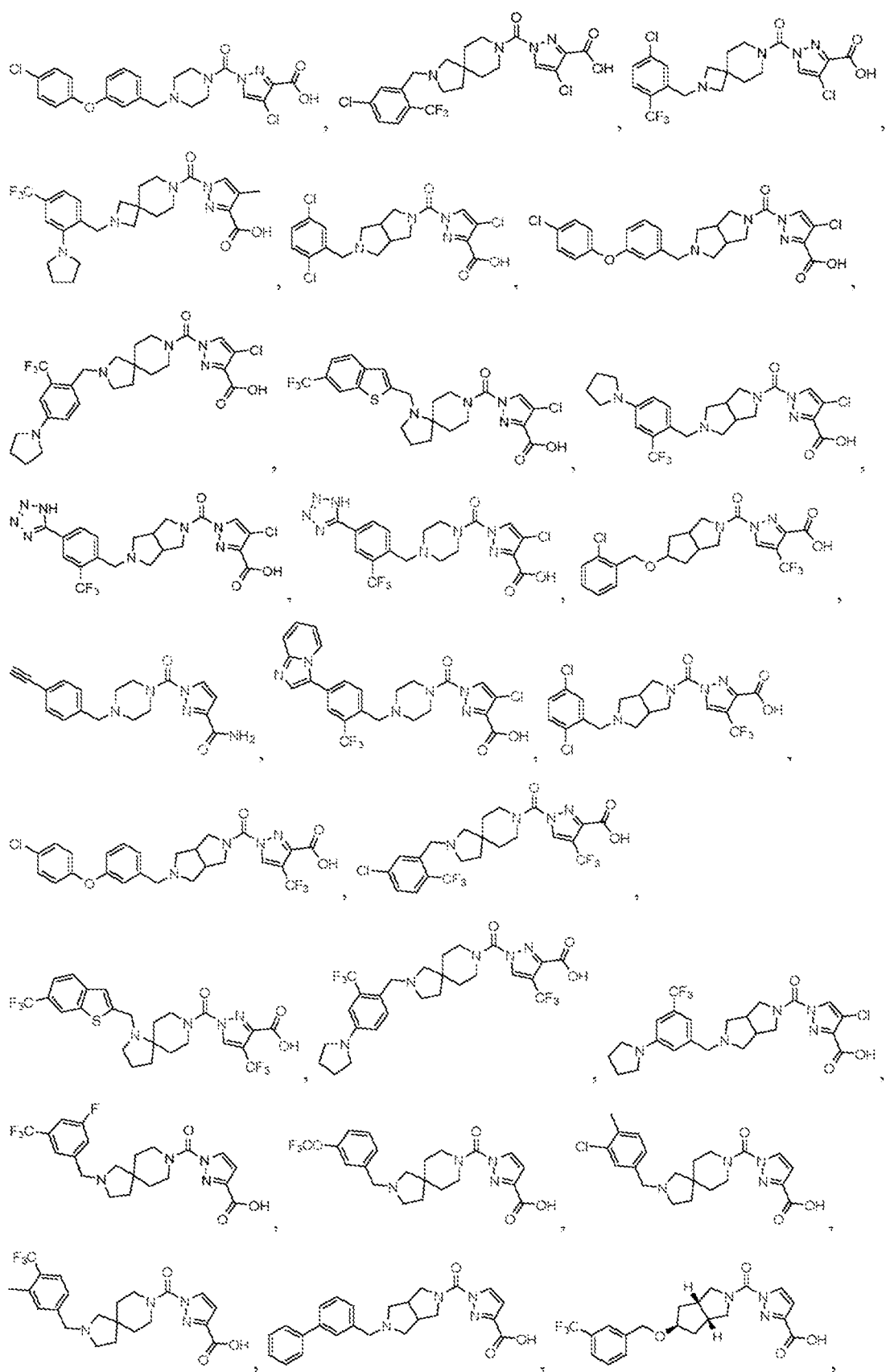


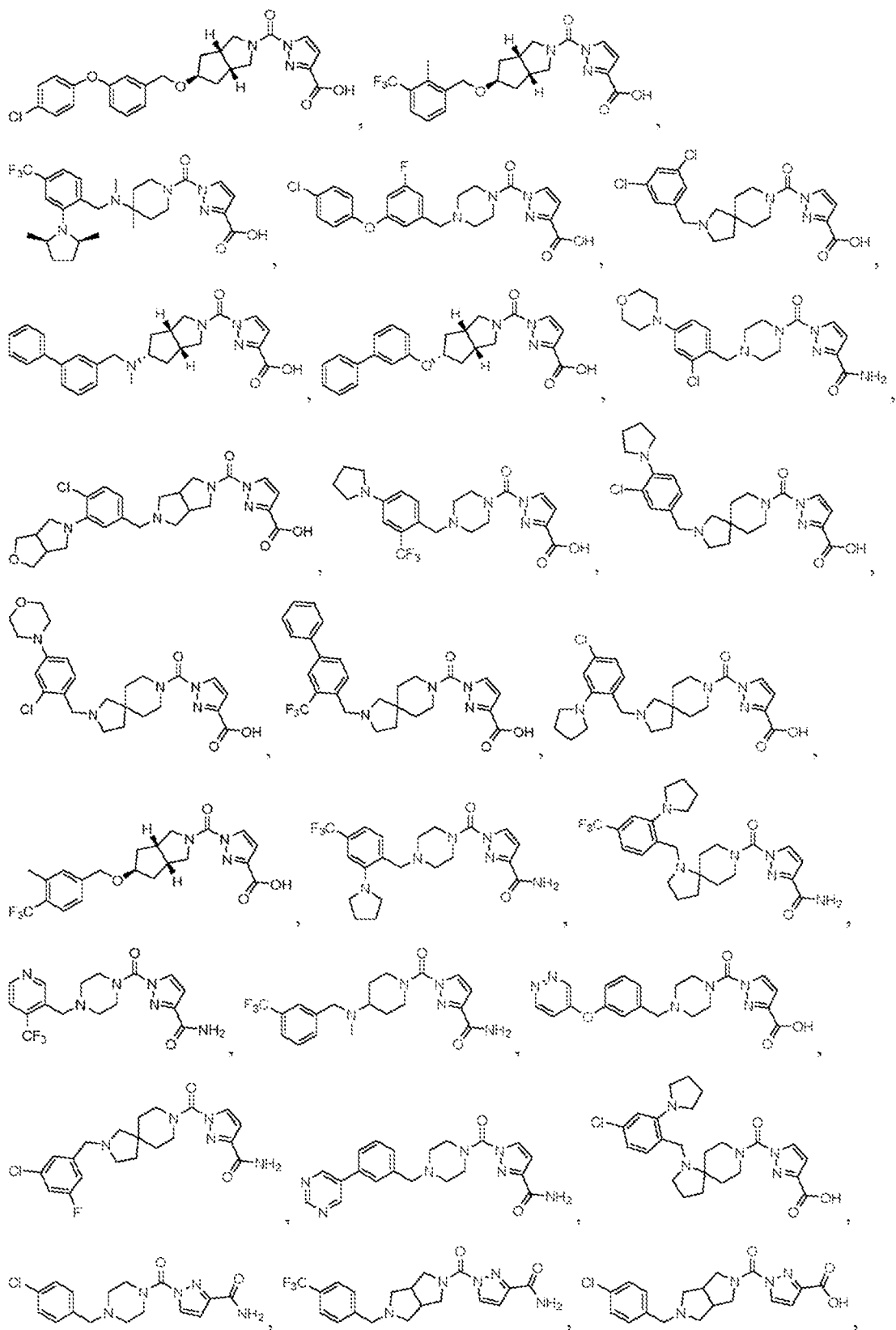


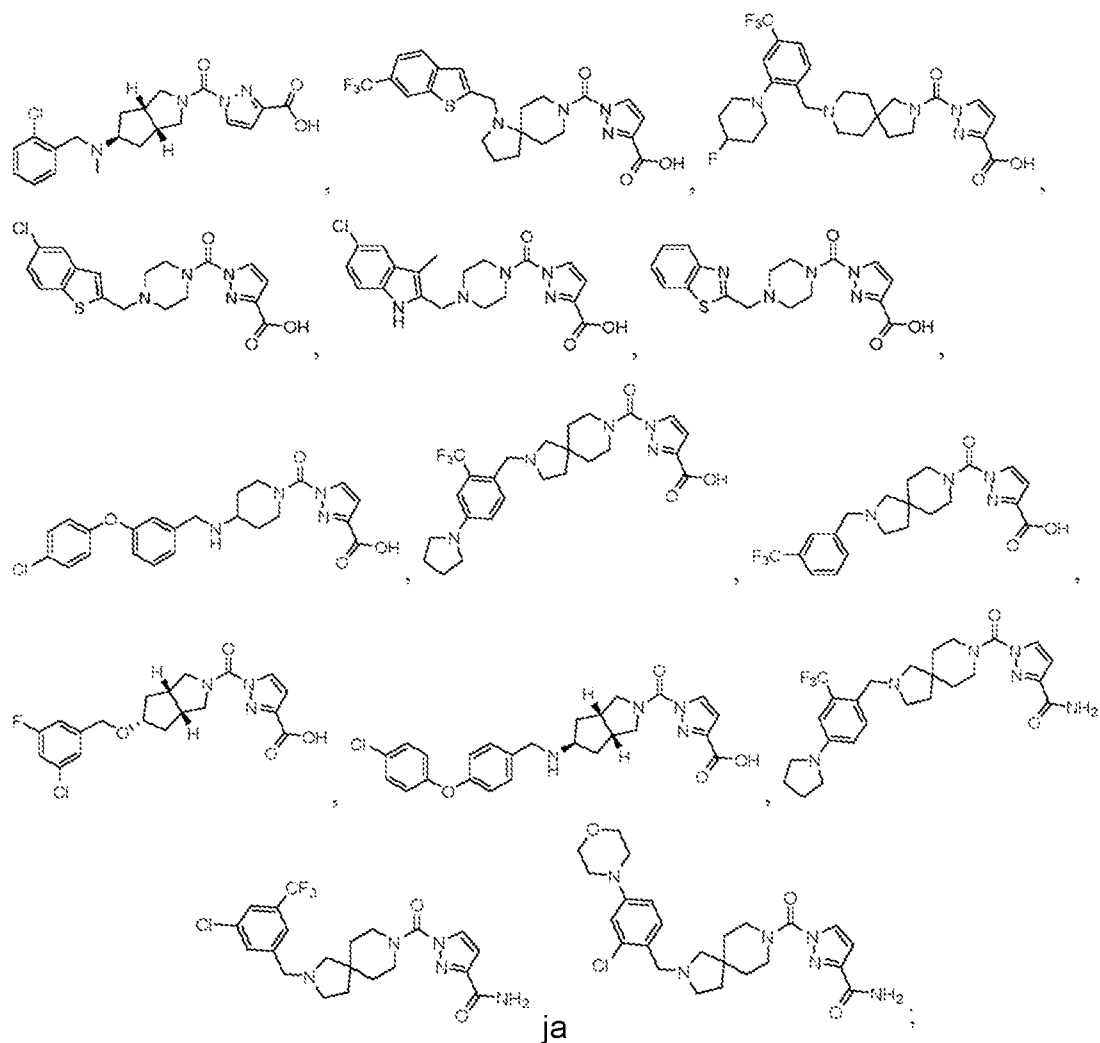








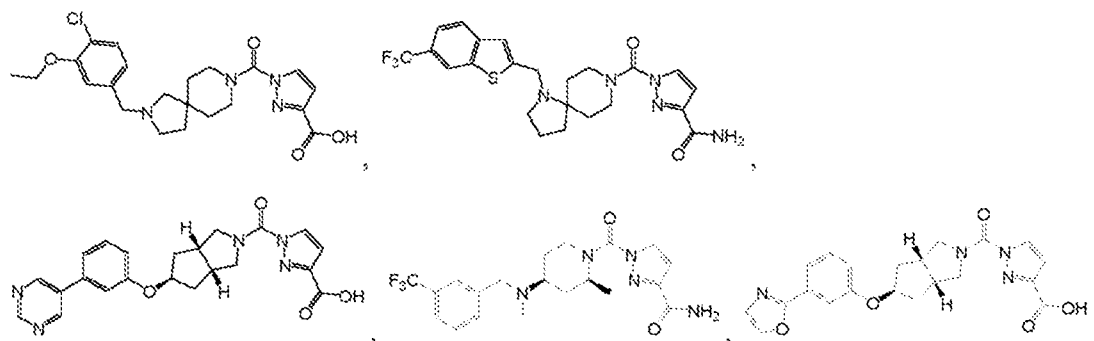


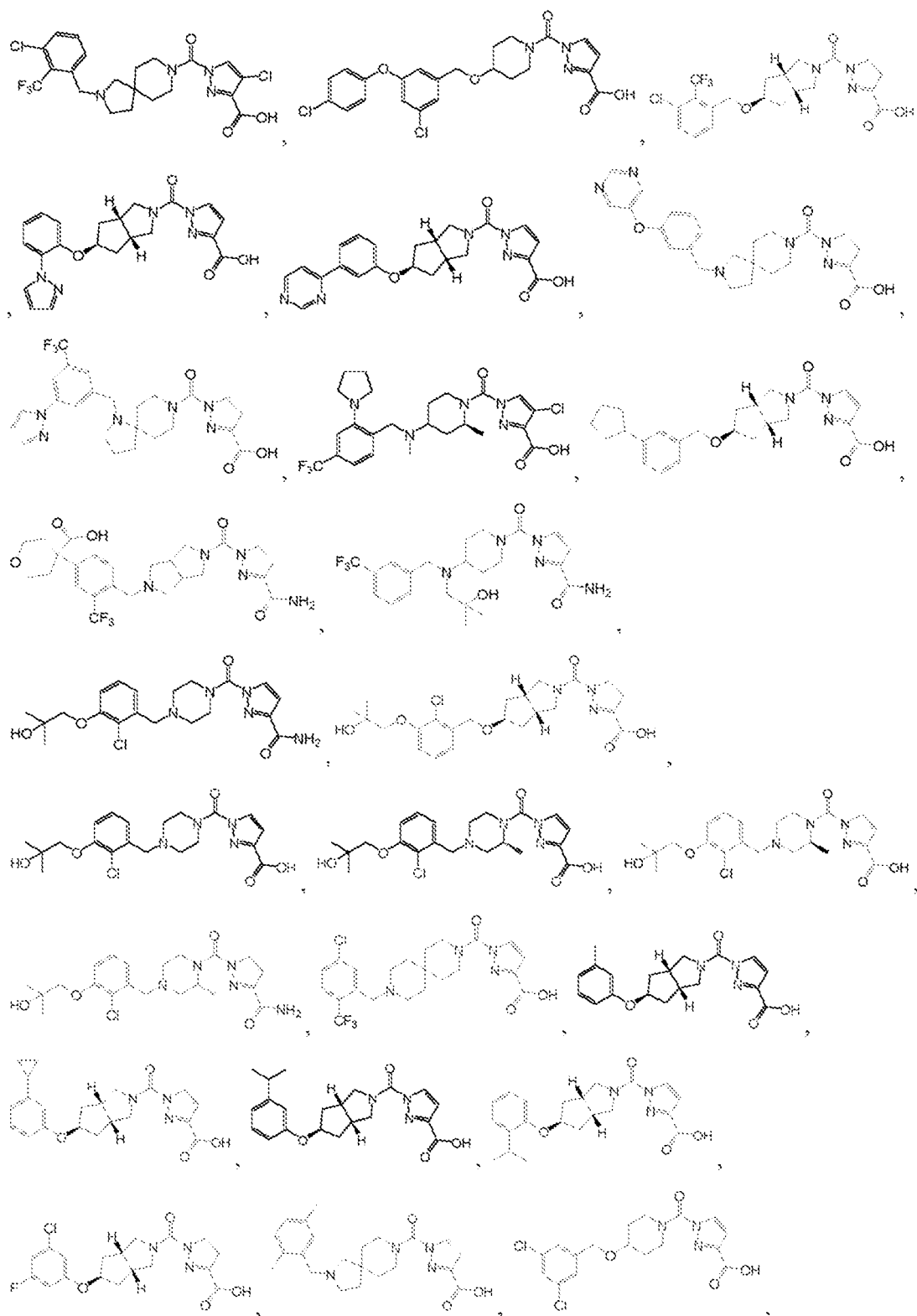


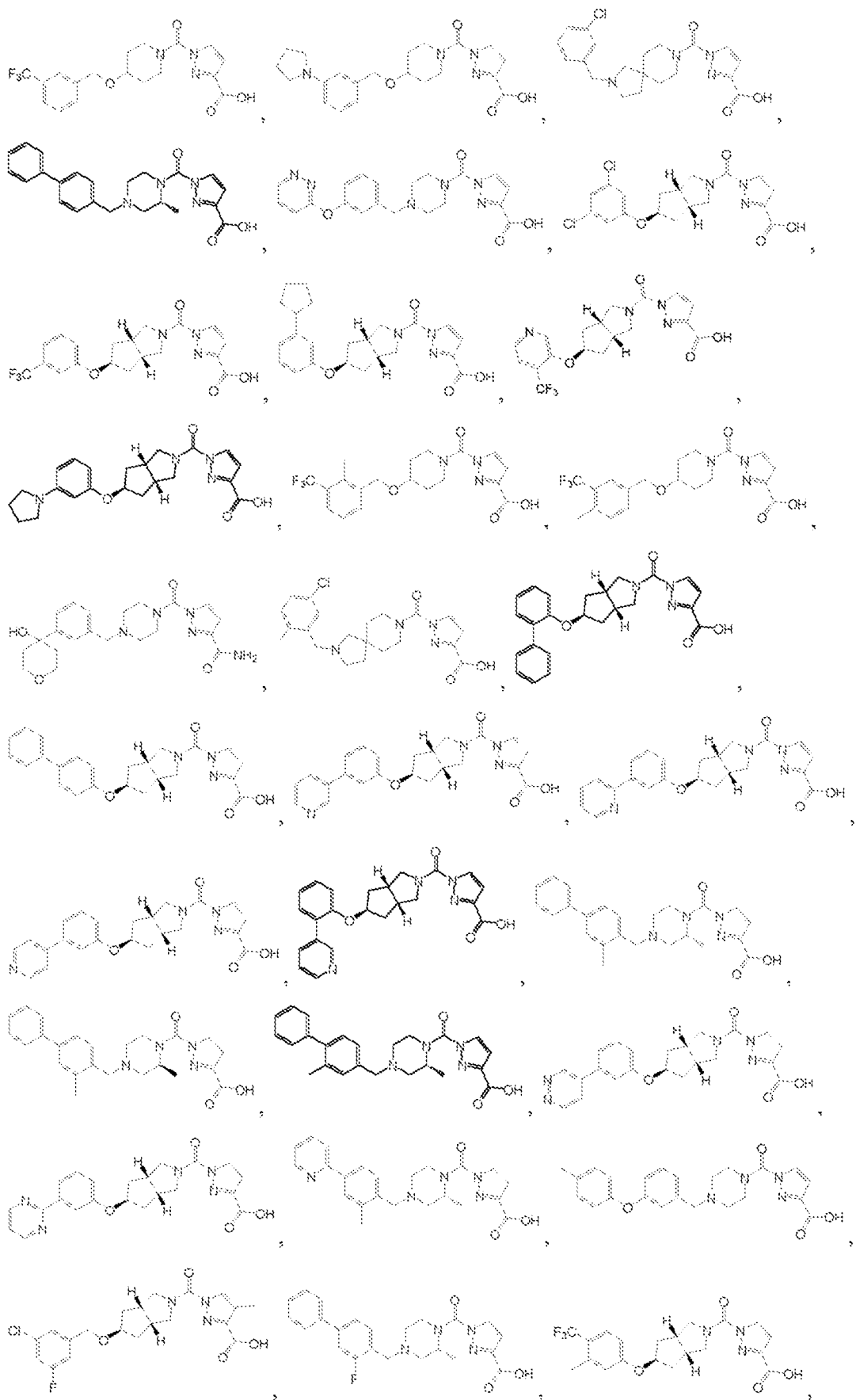
ja

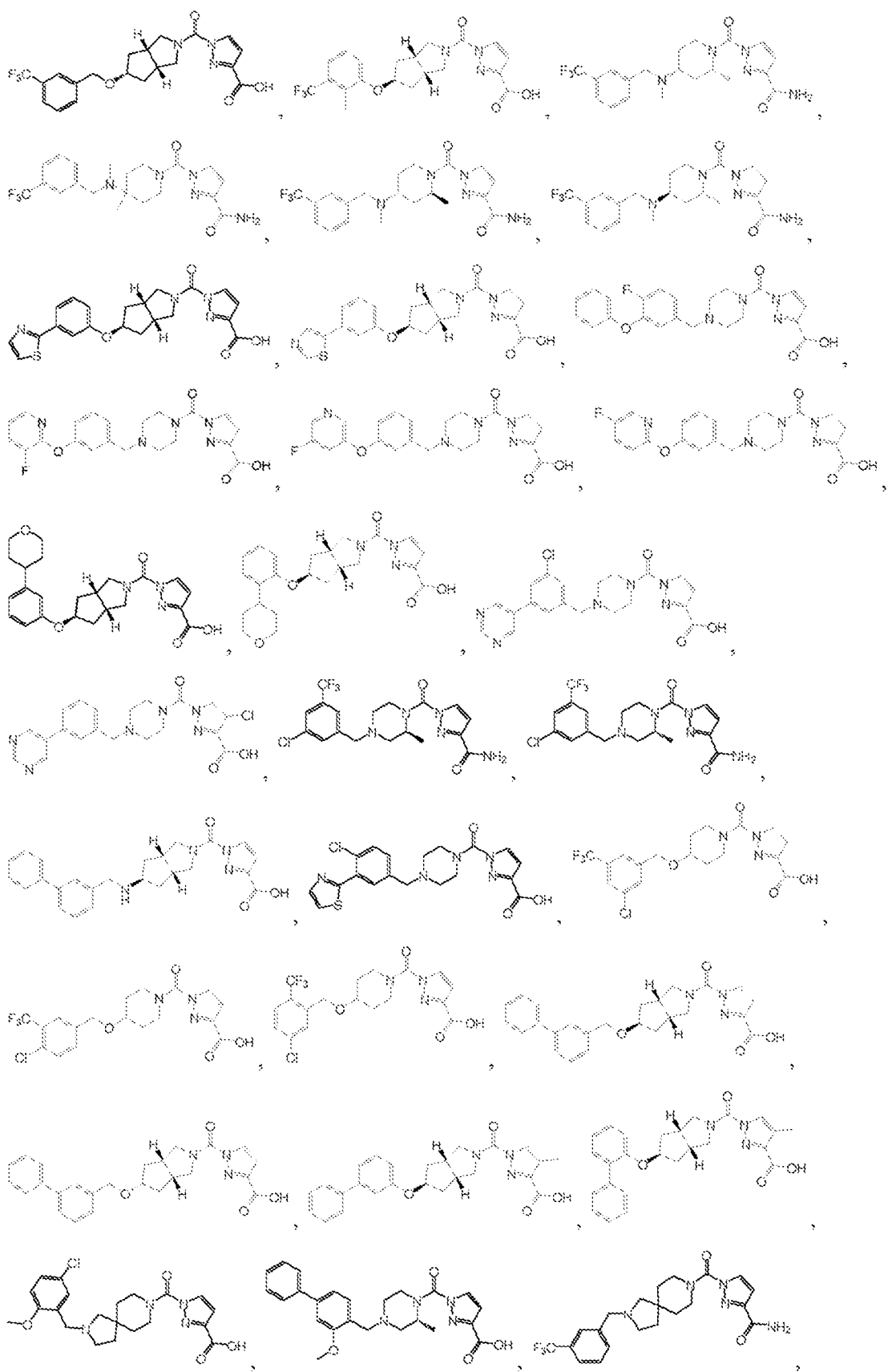
tai sen solvaatti, hydraatti, tautomeeri, N-oksidi, stereoisomeeri tai farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

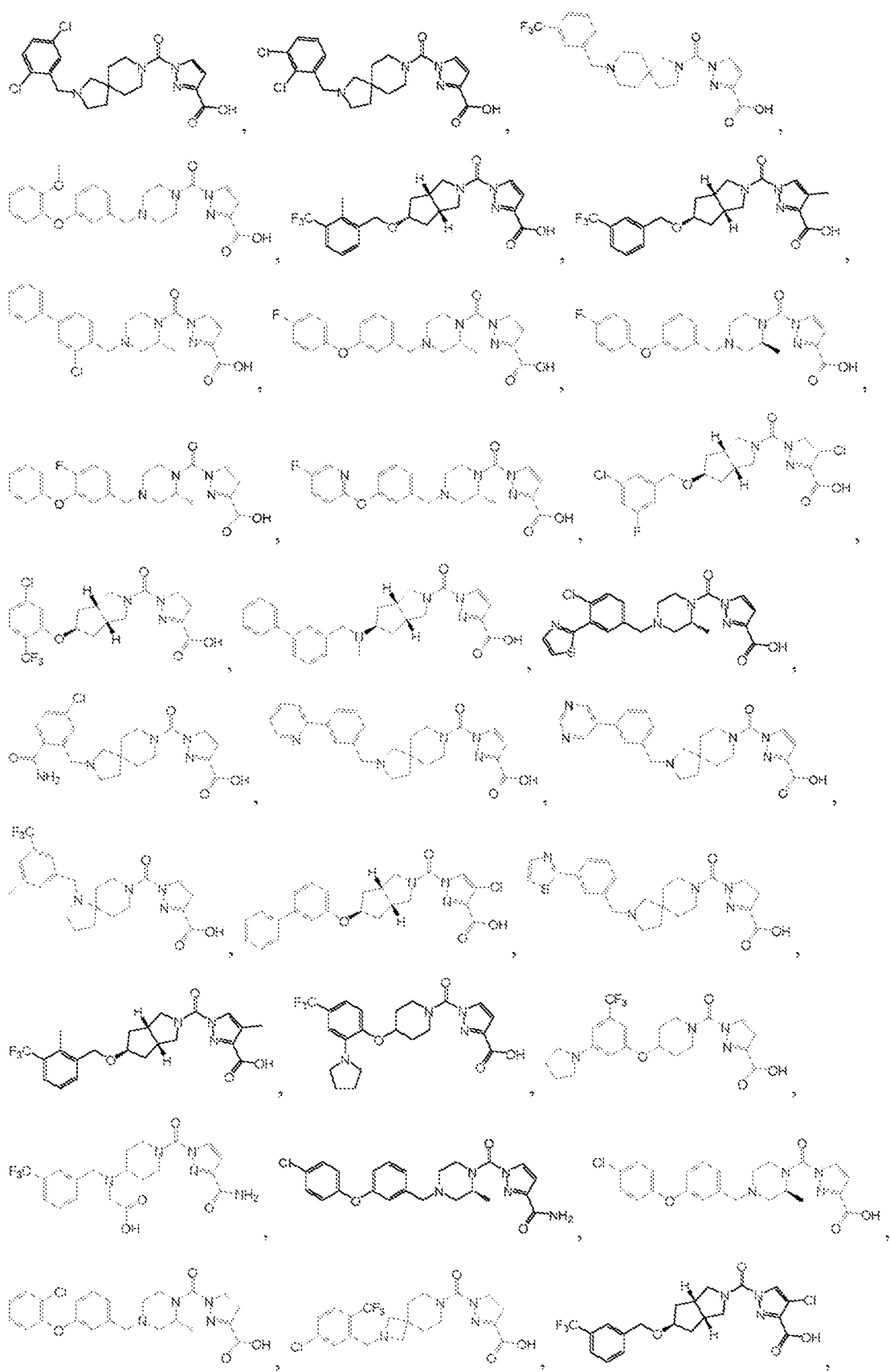
- 5 15. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, joka on valittu seuraavista:

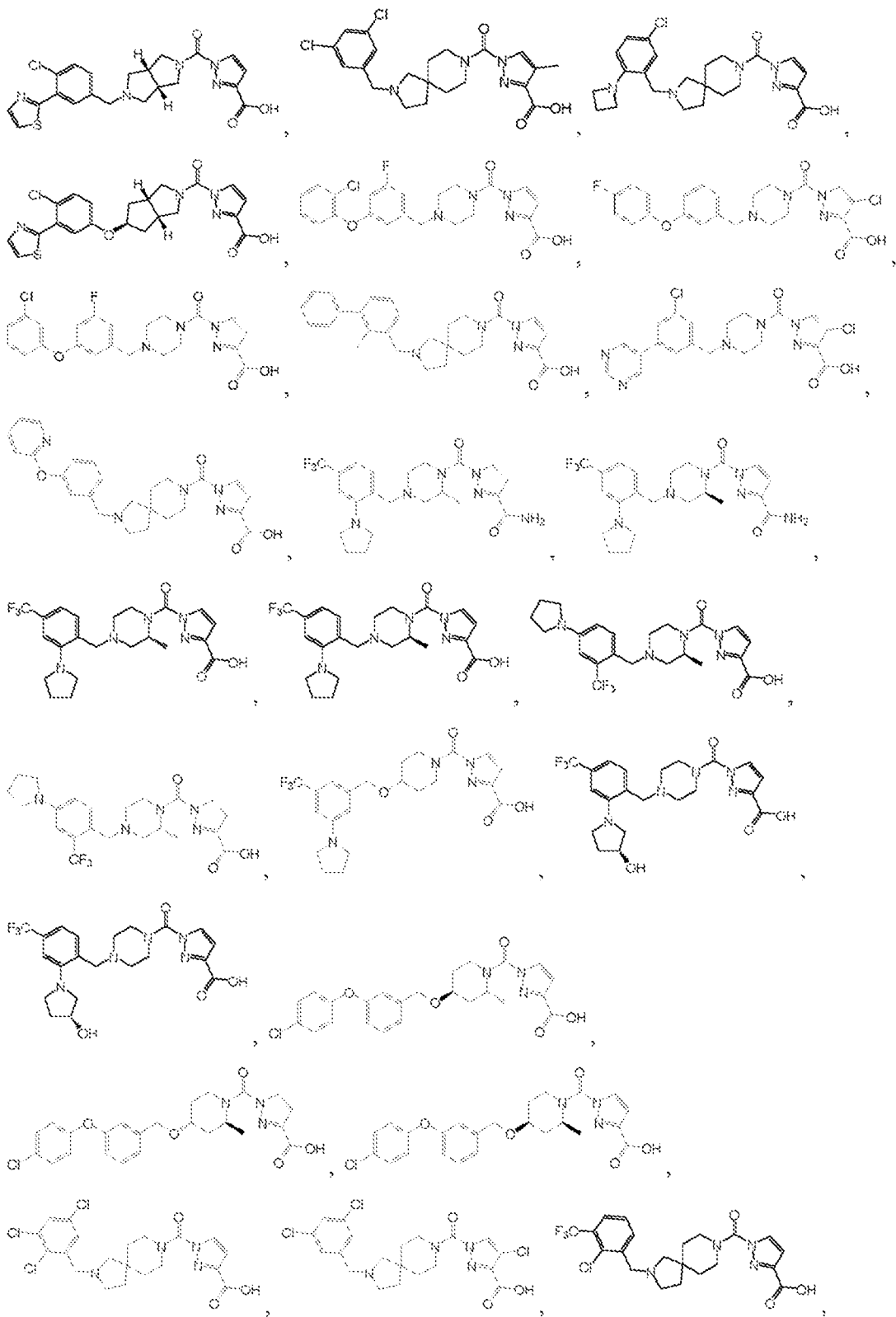


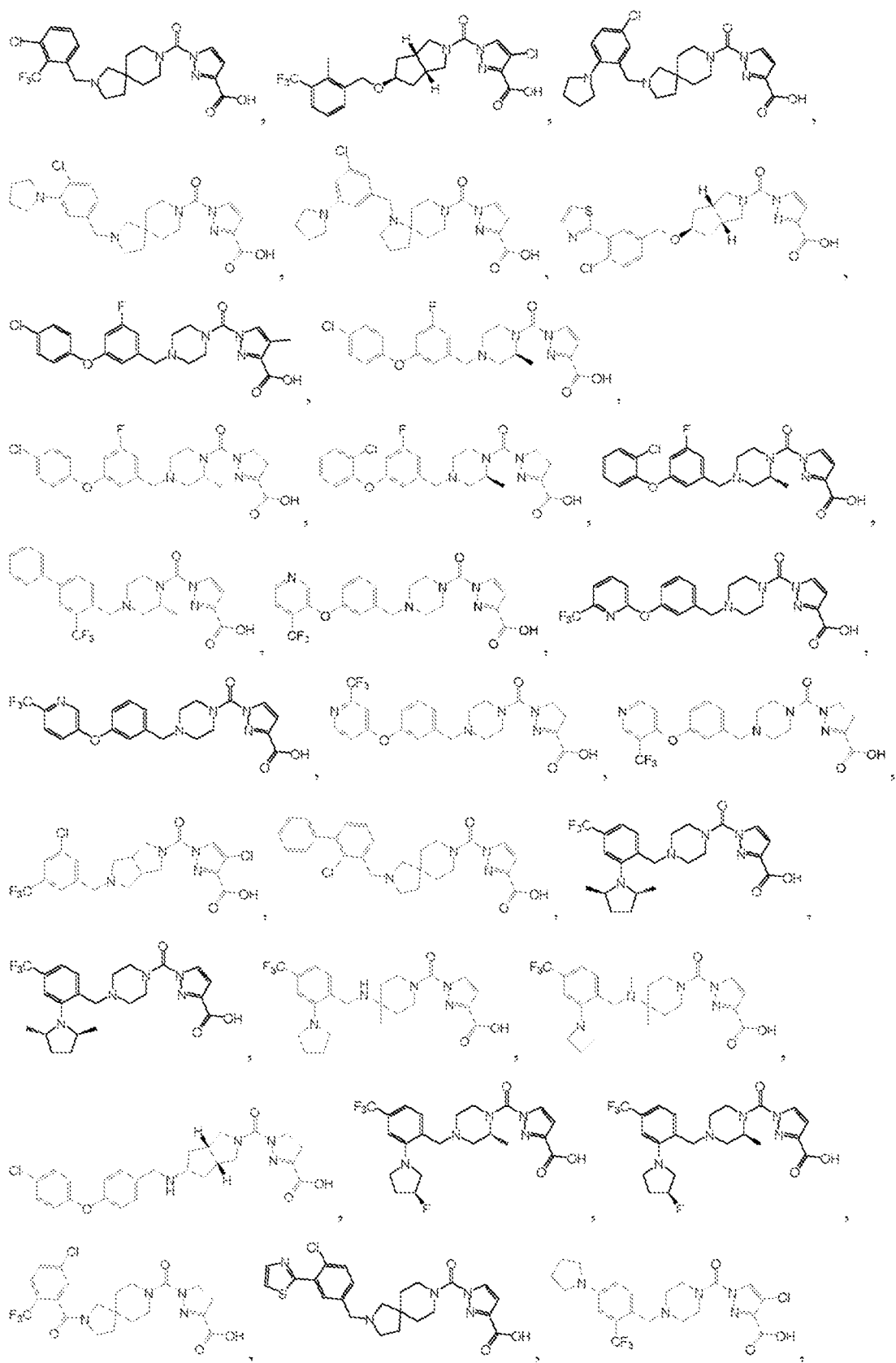


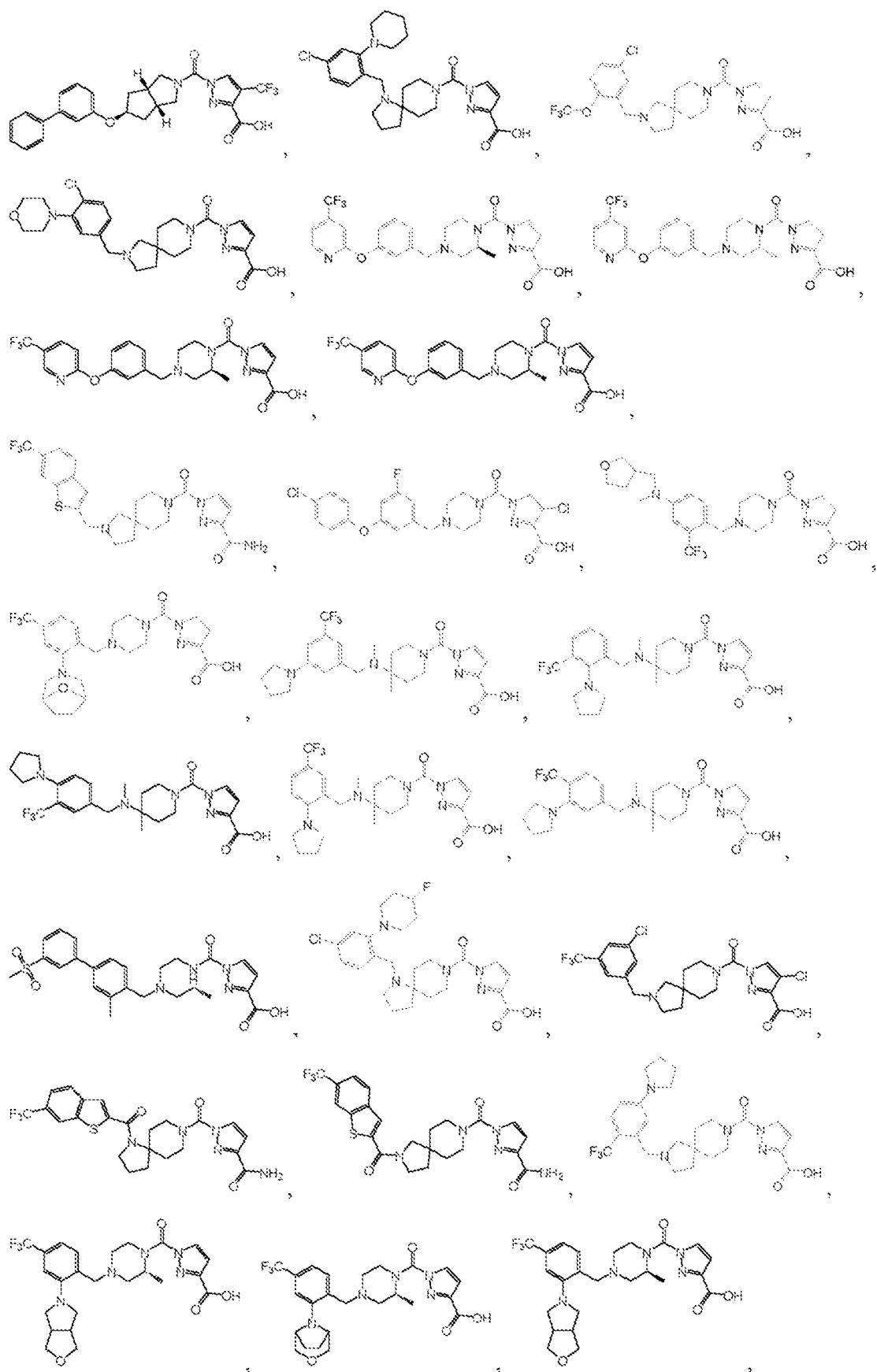


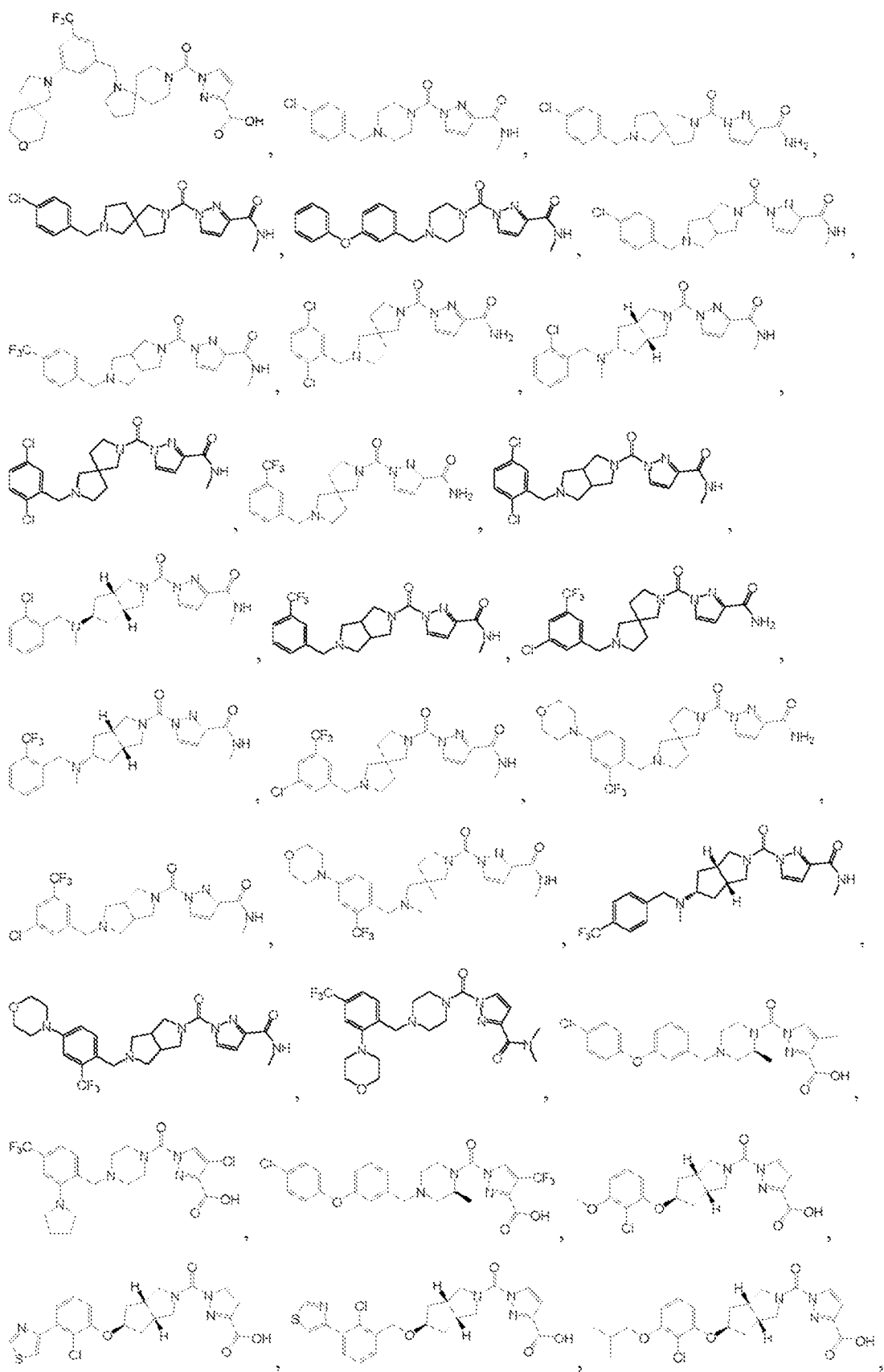


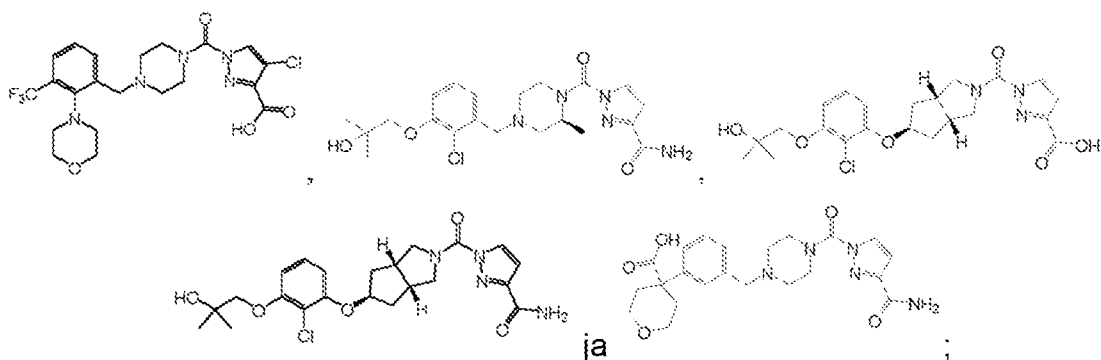






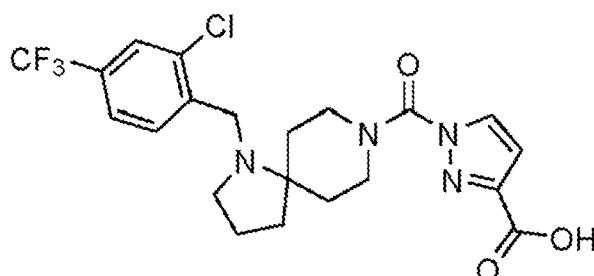






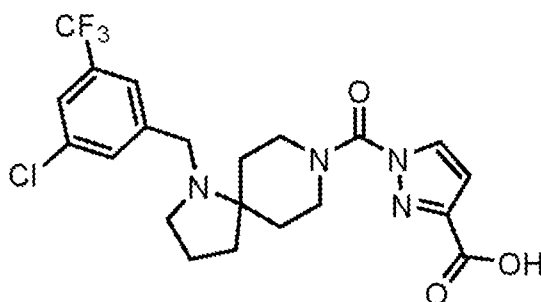
tai sen solvaatti, hydraatti, tautomeeri, N-oksidi, stereoisomeeri tai farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

5 16. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, jolloin yhdiste on



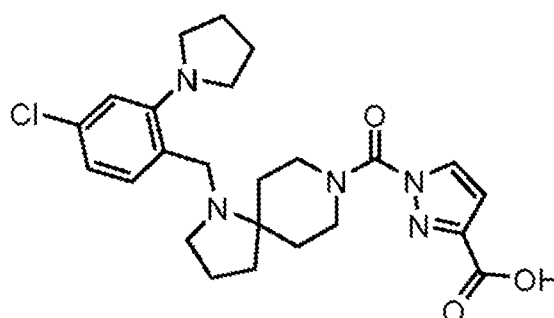
tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

17. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, jolloin yhdiste on



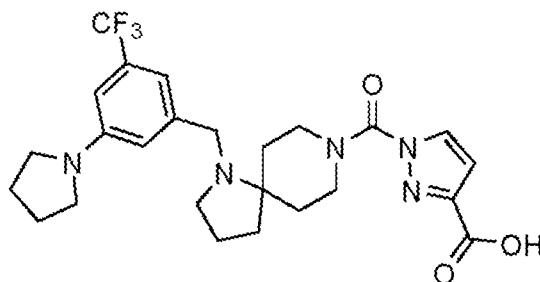
10 tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

18. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, jolloin yhdiste on



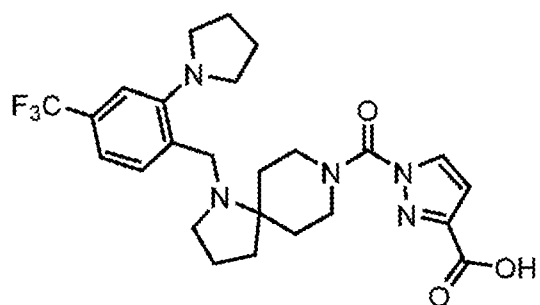
tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

19. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, jolloin yhdiste on



tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

20. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, jolloin yhdiste on



5

tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

21. Farmaseuttinen koostumus, joka käsittää jonkin patenttivaatimuksen 1–20 mukaisen yhdisteen tai sen solvaatin, hydraatin, tautomeerin, N-
 10 oksidin tai farmaseuttisesti hyväksyttävän suolan ja ainakin yhden farmaseuttisesti hyväksyttävän apuaineen.