



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20241543 T1

HR P20241543 T1

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

(51) MKP:

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)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 03.01.2025.

(21) Broj predmeta: P20241543T

(22) Datum podnošenja: 09.12.2021.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2021084987
Datum podnošenja međunarodne prijave: 09.12.2021.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 21823605.7
Datum podnošenja europske prijave patenta: 09.12.2021.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2022122914
Datum međunarodne objave: 16.06.2022.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 4259617 A1
Datum objave europske prijave patenta: 18.10.2023.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 4259617 B1
Datum objave europskog patenta: 23.10.2024.

(31) Broj prve prijave: 20213020

(32) Datum podnošenja prve prijave: 10.12.2020.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: EP

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelji:

Bayer Aktiengesellschaft, Kaiser-Wilhelm-Allee 1, 51373 Leverkusen, DE
Alexandros Vakalopoulos, 40721 Hilden, DE
Marie-Pierre Collin-Kroepelin, 79576 Weil am Rhein, DE
Nuria Ortega Hernandez, 42281 Wuppertal, DE
Andre Dieskau, 42115 Wuppertal, DE
Melissa Boulதாகis-Arapinis, 40215 Düsseldorf, DE
Lisa Candish, 42115 Wuppertal, DE
Timo Stellfeld, 14197 Berlin, DE
Ilka Mathar, 40235 Düsseldorf, DE
Lucas Hudson Hofmeister, 10245 Berlin, DE
Peter Sandner, 42113 Wuppertal, DE
Frank Wunder, 42117 Wuppertal, DE
Lisa Dietz, 42111 Wuppertal, DE
Robert Alan Webster, 13467 Berlin, DE
Carsten Schmeck, 45472 Mülheim, DE
Thomas Mondritzki, 45130 Essen, DE
Michael Hahn, 40764 Langenfeld, DE
Markus Follmann, 50859 Köln, DE
Jan Dreher, San Diego, CA 92101, US
Alexey Gromov, 40699 Erkrath, DE

(74) Zastupnik:

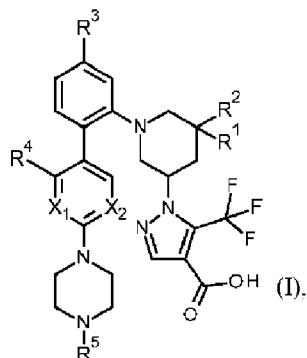
PRODUCTA d.o.o., 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma: SUPSTITUIRANE PIRAZOLO PIPERIDIN KARBOKSILNE KISELINE

HR P20241543 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

1. Spoj formule (I)



5 u kojoj

- R¹ predstavlja vodik ili halogen,
- R² predstavlja vodik ili halogen,
- R³ predstavlja kloro ili trifluorometil,
- R⁴ predstavlja vodik ili C₁-C₄-alkil
- R⁵ predstavlja C₁-C₆-alkil
- X₁ predstavlja dušik ili ugljik
- X₂ predstavlja dušik ili ugljik

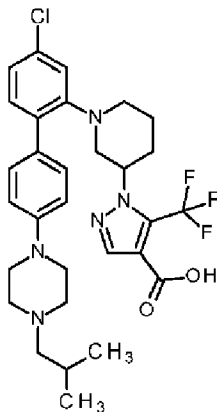
ili jedna od njegovih soli, njegovi solvati ili solvati njegovih soli.

2. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time što**

- R¹ predstavlja vodik, fluor
- R² predstavlja vodik, fluor
- R³ predstavlja kloro ili trifluorometil
- R⁴ predstavlja vodik ili metil
- R⁵ predstavlja izobutil
- X₁ predstavlja dušik ili ugljik
- X₂ predstavlja dušik ili ugljik

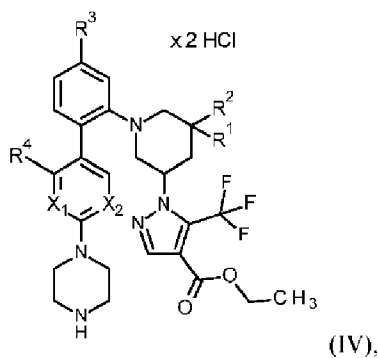
ili jedna od njegovih soli, njegovi solvati ili solvati njegovih soli.

3. Spoj prema zahtjevu 1 ili 2, naznačen time što ima formulu

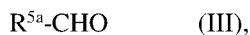


25 ili jedna od njegovih soli, njegovi solvati ili solvati njegovih soli.

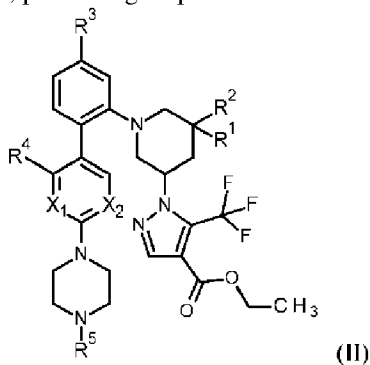
4. Postupak za dobivanje spoja formule (I) ili jedne od njegovih soli, njegovih solvata ili solvata njegovih soli prema jednom od zahtjeva 1 do 3, **naznačen time što**
u prvom koraku [B] spojevi formule (IV)



u kojoj su R^1 , R^2 , R^3 , R^4 i X_1 i X_2 definirani kao gore,
reagiraju sa spojevima formule (III)

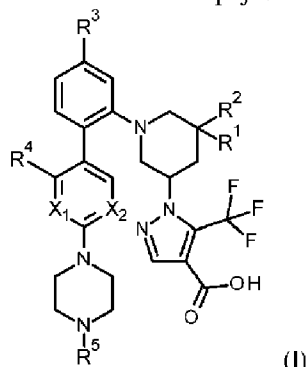


5 u kojoj R^{5a} predstavlja C_1 - C_3 -alkil, poželjno izopropil,
u prisutnosti redukcijskog sredstva, prikladnog otapala i baze da se dobiju spojevi formule (II)

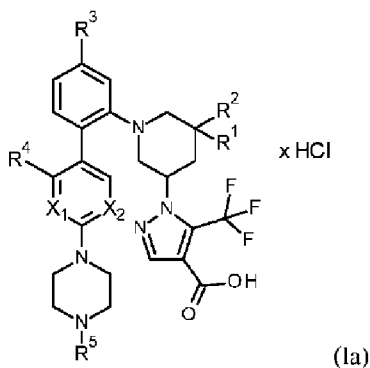


u kojoj su R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 i X_1 i X_2 definirani kao gore
i

10 u drugom koraku [A]
spojevi formule (II) reagiraju s bazom kako bi se dobili spojevi formule (I),



u kojoj su R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 i X_1 i X_2 definirani kao gore
15 izborno se spojevi formule (I) prenose u treći korak [A]*
u odgovarajuće soli formule (Ia)



u prisutnosti prikladne kiseline u prikladnom otapalu.

5. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 3, naznačen time što se koristi u liječenju i/ili profilaksi bolesti.

6. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 3, naznačen time što se koristi u liječenju i/ili profilaksi zatajenja srca (HFrEF, HFmrEF i HFpEF), hipertenzije (HTN), kronične i dijabetičke bolesti bubrega (CKD, DKD), plućne hipertenzije (PH), sistemske skleroze (SSc), bolesti srpastih stanica (SCD), neurodegenerativnih bolesti i demencija, i dijabetičkog ulkusa stopala (DFU).
- 5 7. Upotreba spoja prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 3 naznačena time što se koristi za proizvodnju lijeka za upotrebu u liječenju i/ili profilaksi bolesti.
8. Upotreba spoja prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 3 za proizvodnju lijeka za upotrebu u liječenju i/ili profilaksi zatajenja srca (HFrEF, HFmrEF i HFpEF), hipertenzije (HTN), kronične i dijabetičke bolesti bubrega (CKD, DKD), plućne hipertenzije (PH), sistemske skleroze (SSc), bolesti srpastih stanica (SCD), neurodegenerativnih bolesti i demencija, i dijabetičkog ulkusa stopala (DFU).
- 10 9. Lijek koji sadrži spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 3 u kombinaciji s inertnom, netoksičnom, farmaceutski prikladnom pomoćnom tvari.
- 10 10. Lijek prema zahtjevu 9 za upotrebu u liječenju i/ili profilaksi zatajenja srca (HFrEF, HFmrEF i HFpEF), hipertenzije (HTN), kronične i dijabetičke bolesti bubrega (CKD, DKD), plućne hipertenzije (PH), sistemske skleroze (SSc), bolesti srpastih stanica (SCD), neurodegenerativnih bolesti i demencija, i dijabetičkog ulkusa stopala (DFU).
- 15