



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20140680 T1

HR P20140680 T1

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

(51) MKP:

C07D 401/14 (2006.01)
C07D 409/14 (2006.01)
A61K 31/4439 (2006.01)
G01N 33/68 (2006.01)
C07D 401/04 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 10.10.2014.

(21) Broj predmeta: P20140680T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 15.07.2014.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/FR2009052691
Datum podnošenja međunarodne prijave: 24.12.2009.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 09805789.6
Datum podnošenja europske prijave patenta: 24.12.2009.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2010076524
Datum međunarodne objave: 08.07.2010.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2382205 A2
Datum objave europske prijave patenta: 02.11.2011.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2382205 B1
Datum objave europskog patenta: 23.04.2014.

(31) Broj prve prijave: 0807474
0904092

(32) Datum podnošenja prve prijave: 29.12.2008.
28.08.2009.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: FR
FR

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelji:

SANOFI, 54, rue La Boétie, 75008 Paris, FR

**Jean-Michel Altenburger, c/o Sanofi-Aventis Département Brevets, 174,
avenue de France, 75013 Paris, FR**

**Valérie Fossey, c/o Sanofi-Aventis Département Brevets, 174, avenue de
France, 75013 Paris, FR**

**Stéphane Illiano, c/o Sanofi-Aventis Département Brevets 174 avenue de
France, 75013 Paris, FR**

**Géraldine Manette, c/o Sanofi-Aventis Département Brevets 174 avenue
de France, 75013 Paris, FR**

(74) Zastupnik:

Hraste & Partneri odvjetničko društvo, 10000 Zagreb, HR

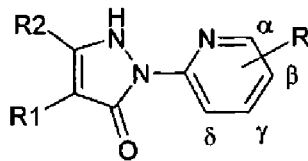
(54) Naziv izuma:

**DERIVATI 2-PIRIDIN-2-ILPIRAZOL-3(2H)-ONA, NJIHOVO DOBIVANJE I NJIHOVA UPOTREBA
U TERAPIJI KAO AKTIVATORA HIF**

HR P20140680 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

1. Spoj koji odgovara formuli (I) niže:



naznačen time što:

R predstavlja skupinu $-SO_2-NR_3R_4$ ili skupinu $-SO_2-R_4$; gdje su **R3**, **R4** i **R5** definirani kao niže;

R1 predstavlja heterocikloalkilnu skupinu koja ne sadrži atom dušika, skupinu $-W-(C_3-C_6)$ cikloalkil, skupinu $-W$ -aril, skupinu $-W$ -heteroaril, skupinu $-W$ -heterocikloalkil, skupinu $-W-COOR_5$ ili skupinu $-W-CONR_5R_6$,

(i) gdje su navedene arilna, heteroarilna i heterocikloalkilna skupina izborno supstituirane na najmanje jednom atomu ugljika s najmanje jednim supstituentom, kojeg se bira između atoma halogena, skupina (C_1-C_5) alkil, skupina $-(C_1-C_5)$ alkilen- $O-(C_1-C_5)$ alkil, skupina $-(C_1-C_5)$ alkoksi, hidroksilne funkcionalne skupine, skupina $-halogen(C_1-C_5)$ alkil, cijano funkcionalne skupine, skupina $-O(C_1-C_5)$ alkilen- $O-(C_1-C_5)$ alkil, skupina $-O-(C_1-C_5)$ alkilen- NR_5R_6 , skupina $-SO_2-(C_1-C_5)$ alkil, skupina $-NR_5R_6$ i skupina $-CO_2R_5$, i

(ii) gdje se podrazumijeva da kada je to heterocikloalkilna skupina, navedena skupina sadrži najmanje jedan atom dušika, gdje taj atom može izborno nositi supstituent kojeg se bira između skupina (C_1-C_5) alkil,

R2 predstavlja atom vodika, skupinu $-(C_1-C_5)$ alkil, skupinu $-(C_1-C_5)$ alkilen- $O-(C_1-C_5)$ alkil, skupinu $-halogen(C_1-C_5)$ alkil, skupinu $-W-COOR_5$, skupinu $-W-C(O)NHR_5$ ili skupinu $-W-C(O)-NR_5R_6$; gdje su **W**, **R5** i **R6** definirani kao niže;

gdje se podrazumijeva da:

◦ **n** predstavlja 0, 1 ili 2;

◦ **W** je

(i) skupina $-(C_1-C_5)$ alkilen-, izborno supstituirana sa skupinom koju se bira između skupina $-(CH_2)_n-CO_2R_5$ i skupina $-(CH_2)_n-(CO)NR_5R_6$, gdje je **n** definiran kao gore, a **R5** i **R6** su definirani kao niže; ili

(ii) skupina $-(C_3-C_6)$ cikloalkilen-,

◦ **R3** i **R4**

(i) koji mogu biti isti ili različiti, međusobno neovisno predstavljaju atom vodika, skupinu $-(C_1-C_5)$ alkil, skupinu $-(C_3-C_6)$ cikloalkil, skupinu $-(C_1-C_5)$ alkilen- $O-(C_1-C_5)$ alkil, aril, skupinu $-CH_2$ -aril, heteroaril, heterocikloalkil, skupinu $-W-OH$, skupinu $-W-CHOH-CH_2OH$, skupinu $-W-CO_2R_5$, skupinu $-W-NR_5R_6$ ili skupinu $-W-O-(CH_2)_n$ -aril;

gdje su navedene skupine $-(C_3-C_6)$ cikloalkil i heterocikloalkil izborno supstituirane

◦ na najmanje jednom atomu ugljika s najmanje jednom skupinom koju se bira između $-(C_1-C_5)$ alkila, skupine $-(C_1-C_5)$ alkoksi, hidroksilne funkcionalne skupine, skupine $-W-NR_5R_6$ i skupine $-W-CO_2R_5$, u slučaju skupina $-(C_3-C_6)$ cikloalkil i heterocikloalkila i/ili

◦ na najmanje jednom heteroatomu, kojeg se bira između dušika, s najmanje jednom skupinom koju se bira između $-(C_1-C_5)$ alkila u slučaju heterocikloalkilne skupine,

gdje su **W** i **n** definirani kao gore, a **R5** i **R6** su definirani kao niže, te gdje se podrazumijeva da kada su **R3** i **R4** isti, ne mogu biti atom vodika;

(ii) ili, alternativno, **R3** i **R4** tvore, zajedno s atomom dušika koji ih nosi, heterocikloalkilnu skupinu, izborno supstituiranu na najmanje jednom atomu ugljika i/ili, kada je to prikladno, na najmanje jednom heteroatomu, s najmanje jednim supstituentom, kojeg se bira između skupina $-(C_1-C_5)$ alkil i skupina $-CH_2$ -aril;

◦ **R5** i **R6**, koji mogu biti isti ili različiti, međusobno neovisno predstavljaju atom vodika, skupinu $-(C_1-C_5)$ alkil ili skupinu $-(C_1-C_5)$ halogenalkil,

u obliku adicijske soli s bazom ili kiselinom.

2. Spoj koji odgovara formuli (I) u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što:

R predstavlja skupinu $-SO_2-NR_3R_4$ ili skupinu $-SO_2-R_4$; gdje su **R3**, **R4** i **R5** definirani kao niže;

i/ili

R1 predstavlja heterocikloalkilnu skupinu koja ne sadrži atom dušika, skupinu -W-(C3-C6)cikloalkil, skupinu -W-aril, skupinu -W-heteroaril, skupinu -W-heterocikloalkil, skupinu -W-COOR5 ili skupinu -W-CONR5R6,

(i) gdje su navedene arilna, heteroarilna i heterocikloalkilna skupina izborno supstituirane na najmanje jednom atomu ugljika s najmanje jednim supstituentom, kojeg se bira između atoma halogena, skupina (C1-C5)alkil, skupina -(C1-C5)alkilen-O-(C1-C5)alkil, skupina -(C1-C5)alkoksi, hidroksilne funkcionalne skupine, skupina -halogen(C1-C5)alkil, cijano funkcionalne skupine, skupina -O(C1-C5)alkilen-O-(C1-C5)alkil, skupina -O-(C1-C5)alkilen-NR5R6, skupina -SO₂-(C1-C5)alkil, skupina -NR5R6 i skupina -CO₂R5, i

(ii) gdje se podrazumijeva da kada je to heterocikloalkilna skupina, navedena skupina sadrži najmanje jedan atom dušika, gdje taj atom može izborno nositi supstituent kojeg se bira između skupina (C1-C5)alkil,

i/ili

R2 predstavlja atom vodika, skupinu -(C1-C5)alkil, skupinu -(C1-C5)alkilen-O-(C1-C5)alkil, skupinu -halogen(C1-C5)alkil, skupinu -W-COOR5, skupinu -W-C(O)NHR5 ili skupinu -W-C(O)-NR5R6; gdje su **W**, **R5** i **R6** definirani kao niže;

i/ili

n predstavlja 0, 1 ili 2;

i/ili

W je

(i) skupina -(C1-C5)alkilen-, izborno supstituirana sa skupinom koju se bira između skupina -(CH₂)_n-CO₂R5 i skupina -(CH₂)_n-(CO)NR5R6, gdje je **n** definiran kao gore, a **R5** i **R6** su definirani kao niže; ili

(ii) skupina -(C3-C6)cikloalkilen-,

i/ili

R3 i **R4**

(i) koji mogu biti isti ili različiti, međusobno neovisno predstavljaju atom vodika, skupinu -(C1-C5)alkil, skupinu -(C3-C6)cikloalkil, skupinu -(C1-C5)alkilen-O-(C1-C5)alkil, aril, skupinu -CH₂-aril, heteroaril, heterocikloalkil, skupinu -W-OH, skupinu -W-CHOH-CH₂OH, skupinu -W-CO₂R5, skupinu -W-NR5R6 ili skupinu -W-O-(CH₂)_n-aril;

gdje su navedene skupine -(C3-C6)cikloalkil i heterocikloalkil izborno supstituirane

- na najmanje jednom atomu ugljika s najmanje jednom skupinom koju se bira između -(C1-C5)alkila, skupine -(C1-C5)alkoksi, hidroksilne funkcionalne skupine, skupine -W-NR5R6 i skupine -W-CO₂R5, u slučaju skupina -(C3-C6)cikloalkil i heterocikloalkila i/ili

- na najmanje jednom heteroatomu, kojeg se bira između dušika, s najmanje jednom skupinom koju se bira između -(C1-C5)alkila, u slučaju heterocikloalkilne skupine,

gdje su **W** i **n** definirani kao gore, a **R5** i **R6** su definirani kao niže, te gdje se podrazumijeva da kada su **R3** i **R4** isti, ne mogu biti atom vodika;

(ii) ili, alternativno, **R3** i **R4** tvore, zajedno s atomom dušika koji ih nosi, heterocikloalkilnu skupinu, izborno supstituiranu na najmanje jednom atomu ugljika i/ili, kada je to prikladno, na najmanje jednom heteroatomu, s najmanje jednim supstituentom, kojeg se bira između skupina -(C1-C5)alkil i skupina -CH₂-aril;

i/ili

R5 i **R6**, koji mogu biti isti ili različiti, međusobno neovisno predstavljaju atom vodika, skupinu -(C1-C5)alkil ili skupinu -(C1-C5)halogenalkil.

3. Spoj formule (I) u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 i 2, **naznačen time** što **R** predstavlja skupinu -SO₂-NR3R4, gdje su **R3** i **R4** definirani kao u patentnom zahtjevu 1.

4. Spoj formule (I) u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 i 2, **naznačen time** što **R** predstavlja skupinu -SO₂-R4, gdje su **R4** i **R5** definirani kao u patentnom zahtjevu 1.

5. Spoj formule (I) u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 4, **naznačen time** što je **R** supstituent atoma na položaju β u piridinu.

6. Spoj formule (I) u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 5, **naznačen time** što **R1** predstavlja heterocikloalkilnu skupinu koja ne sadrži atom dušika, skupinu -W-(C3-C6)cikloalkil, skupinu -W-aril, skupinu -W-heteroaril, skupinu -W-heterocikloalkil, skupinu -W-COOR5 ili skupinu -W-CONR5R6,

gdje su navedene arilna, heteroarilna i heterocikloalkilna skupina izborno supstituirane na najmanje jednom atomu ugljika s najmanje jednim supstituentom, kojeg se bira između atoma halogena, skupina (C1-C5)alkil, skupina -(C1-C5)alkilen-O-(C1-C5)alkil, skupina -(C1-C5)alkoksi, hidroksilne funkcionalne skupine, skupina -halogen(C1-C5)alkil, cijano funkcionalne skupine, skupina -O(C1-C5)alkilen-O-(C1-C5)alkil, skupina -O-(C1-C5)alkilen-NR5R6, skupina -SO₂-(C1-C5)alkil, skupina -NR5R6 i skupina -CO₂R5, i

gdje se podrazumijeva da kada je to heterocikloalkilna skupina, navedena skupina sadrži najmanje jedan atom dušika, gdje taj atom može izborno nositi supstituent kojeg se bira između skupina (C1-C5)alkil,

gdje je **W** skupina (C1-C5)alkilen ili skupina (C3-C6)cikloalkilen, te gdje **R5** i **R6**, koji mogu biti isti ili različiti, međusobno neovisno predstavljaju atom vodika, skupinu -(C1-C5)alkil ili skupinu -(C1-C5)halogenalkil.

7. Spoj formule (I) u skladu s patentnim zahtjevom 6, **naznačen time** što navedena heterocikloalkilna skupina predstavlja piperidilnu skupinu, navedena arilna skupina predstavlja fenilnu skupinu, a navedena heteroarilna skupina predstavlja piridilnu skupinu.

8. Spoj formule (I) u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 7, **naznačen time** što **R2** predstavlja atom vodika, skupinu -(C1-C5)alkil, skupinu -(C1-C5)alkilen-O-(C1-C5)alkil, skupinu -halogen(C1-C5)alkil, skupinu -W-COOR5, skupinu -W-C(O)NHR5 ili skupinu -W-C(O)-NR5R6, gdje su **W**, **R5** i **R6** definirani kao u patentnom zahtjevu 1.

9. Spoj formule (I) u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 3 i 5 do 7, **naznačen time** što **R** predstavlja skupinu -SO₂-NR₃R₄, po mogućnosti na položaju β u piridinu, te gdje **R3** i **R4**, koji mogu biti isti ili različiti, međusobno neovisno predstavljaju atom vodika, skupinu -(C1-C5)alkil, skupinu -(C3-C6)cikloalkil, skupinu -(C1-C5)alkilen-O-(C1-C5)alkil, aril, skupinu -CH₂-aril, heteroaril, heterocikloalkil, skupinu -W-OH, skupinu -W-CHOH-CH₂OH, skupinu -W-CO₂R5, skupinu -W-NR₅R₆ ili skupinu -W-O-(CH₂)_n-aril;

gdje se podrazumijeva da:

kada su **R3** i **R4** isti, ne mogu biti atom vodika; te gdje

kada **R3** i/ili **R4** se bira između navedenih skupina -(C3-C6)cikloalkil i heterocikloalkil, te skupine mogu biti izborno supstituirane

- na najmanje jednom atomu ugljika, s najmanje jednom skupinom koju se bira između -(C1-C5)alkila, skupine -(C1-C5)alkoksi, hidroksilne funkcionalne skupine, skupine -W-NR₅R₆ i skupine -W-CO₂R5, u slučaju skupina -(C3-C6)cikloalkil i heterocikloalkil, i/ili

- na najmanje jednom heteroatomu, kojeg se bira između dušika, s najmanje jednom skupinom koju se bira između -(C1-C5)alkila, u slučaju heterocikloalkilne skupine,

gdje su **W**, **R5** i **R6** definirani kao u skladu s patentnim zahtjevom 1, te gdje **n** predstavlja 0, 1 ili 2.

10. Spoj formule (I) u skladu s patentnim zahtjevom 9, **naznačen time** što navedena heterocikloalkilna skupina predstavlja piperidilnu skupinu, navedena arilna skupina predstavlja fenilnu skupinu, a navedena heteroarilna skupina predstavlja piridilnu skupinu.

11. Spoj formule (I) u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 3 i 5 do 7, **naznačen time** što **R** predstavlja skupinu -SO₂-NR₃R₄, po mogućnosti na položaju β u piridinu, te gdje **R3** i **R4** tvore, zajedno s atomom dušika koji ih nosi, heterocikloalkilnu skupinu, izborno supstituiranu na najmanje jednom atomu ugljika i/ili, kada je to prikladno, na najmanje jednom heteroatomu, s najmanje jednim supstituentom, koji se bira između skupina -(C1-C5)alkil i skupina -CH₂-aril.

12. Spoj formule (I) u skladu s patentnim zahtjevom 11, **naznačen time** što navedena heterocikloalkilna skupina predstavlja skupinu koju se bira između piperidilne, piperazinilne, morfolinilne, piroolidinilne i heksametilenimino skupine, gdje navedena arilna skupina predstavlja fenilnu skupinu.

13. Spoj formule (I) u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 12, **naznačen time** što jedna ili više skupina **R**, **R1** i/ili **R2** sadrže jednu ili više skupina **R5** i/ili **R6**,

R5 ili **R6** su atom vodika, skupina -(C1-C5)alkil ili skupina -(C1-C5)halogenalkil, ili

R5 i **R6**, koji mogu biti isti ili različiti, međusobno neovisno predstavljaju atom vodika, skupinu -(C1-C5)alkil ili skupinu -(C1-C5)halogenalkil.

14. Spoj formule (I) u skladu s patentnim zahtjevom 13, **naznačen time** što se **R5** i/ili **R6** bira između skupina (C1-C5)alkil.

15. Spoj formule (I) u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 13, **naznačen time** što **R** predstavlja skupinu -SO₂-NR₃R₄ ili atom vodika, gdje su **R3** i **R4** definirani kao u patentnom zahtjevu 1, i/ili **R2** predstavlja atom vodika ili skupina -(C1-C5)alkil, po mogućnosti metil, i/ili **R1** predstavlja skupinu -W-aril ili skupinu -W-heteroaril, po mogućnosti gdje navedeni **W** predstavlja -CH₂-, navedeni aril predstavlja fenil, a navedeni heteroaril predstavlja piridin.

16. Spoj formule (I) u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 15, **naznačen time** što je:

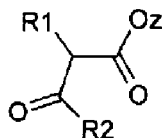
- 4-(2-klorbenzil)-5-metil-2-[5-(trifluormetil)piridin-2-il]-1,2-dihidro-3H-pirazol-3-on;
- 6-[4-(2-klorbenzil)-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1H-pirazol-1-il]piridin-3-karboksilna kiselina;
- 4-(2-klorbenzil)-5-metil-2-(piridin-2-il)-1,2-dihidro-3H-pirazol-3-on;
- 4-(2-klorbenzil)-5-metil-2-{5-[(4-metilpiperazin-1-il)sulfonil]piridin-2-il}-1,2-dihidro-3H-pirazol-3-on-trifluoracetat;
- (±)-4-(2-klorbenzil)-2-(5-{[(3R,5S)-3,5-dimetilpiperidin-1-il]sulfonil}piridin-2-il)-5-metil-1,2-dihidro-3H-pirazol-3-on;
- 6-[4-(2-klorbenzil)-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1H-pirazol-1-il]-N,N-dietilpiridin-3-sulfonamid;
- 6-[4-(2-klorbenzil)-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1H-pirazol-1-il]-N-etil-N-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 6-[4-(2-klorbenzil)-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1H-pirazol-1-il]-N,N-di(propan-2-il)piridin-3-sulfonamid;
- 4-(2-klorbenzil)-5-metil-2-[5-(piperidin-1-ilsulfonil)piridin-2-il]-1,2-dihidro-3H-pirazol-3-on;
- N,N-dietil-6-[4-(2-fluorbenzil)-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1H-pirazol-1-il]piridin-3-sulfonamid;
- 4-(2-fluorbenzil)-5-metil-2-(piridin-2-il)-1,2-dihidro-3H-pirazol-3-on;
- 4-(2-fluorbenzil)-5-metil-2-[5-(trifluormetil)piridin-2-il]-1,2-dihidro-3H-pirazol-3-on;

- 4-(2-fluorbenzil)-5-metil-2-{5-[(4-metilpiperazin-1-il)sulfonil]piridin-2-il}-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on-trifluoracetat;
- 2-(5-{[(3*R*,5*S*)-3,5-dimetilpiperidin-1-il]sulfonil}piridin-2-il)-4-(2-fluorbenzil)-5-metil-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- 5 • *N*-etil-6-[4-(2-fluorbenzil)-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 4-(2-fluorbenzil)-5-metil-2-[5-(piperidin-1-ilsulfonil)piridin-2-il]-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- 4-(2,4-diklorbenzil)-5-metil-2-(piridin-2-il)-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- 4-(2,4-diklorbenzil)-5-metil-2-[5-(trifluormetil)piridin-2-il]-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- 10 • 4-(2,4-diklorbenzil)-5-metil-2-{5-[(4-metilpiperazin-1-il)sulfonil]piridin-2-il}-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on-trifluoracetat;
- 4-(2,4-diklorbenzil)-2-(5-{[(3*R*,5*S*)-3,5-dimetilpiperidin-1-il]sulfonil}piridin-2-il)-5-metil-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- 6-[4-(2,4-diklorbenzil)-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-etil-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 15 • 6-[4-(2,4-diklorbenzil)-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N,N*-di(propan-2-il)piridin-3-sulfonamid;
- 4-(2,4-diklorbenzil)-5-metil-2-[5-(piperidin-1-ilsulfonil)piridin-2-il]-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- 4-(2-klor-6-fluorbenzil)-5-metil-2-[5-(trifluormetil)piridin-2-il]-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- 4-(2-klor-6-fluorbenzil)-5-metil-2-{5-[(4-metilpiperazin-1-il)sulfonil]piridin-2-il}-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on-trifluoracetat;
- 20 • 4-(2-klor-6-fluorbenzil)-2-(5-{[(3*R*,5*S*)-3,5-dimetilpiperidin-1-il]sulfonil}piridin-2-il)-5-metil-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- 6-[4-(2-klor-6-fluorbenzil)-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N,N*-dietil-piridin-3-sulfonamid;
- 6-[4-(2-klor-6-fluorbenzil)-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-etil-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 6-[4-(2-klor-6-fluorbenzil)-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N,N*-di(propan-2-il)piridin-3-sulfonamid;
- 25 • 4-(2-klor-6-fluorbenzil)-5-metil-2-[5-(piperidin-1-ilsulfonil)piridin-2-il]-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- metil-6-[4-(2-klorbenzil)-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]piridin-3-karboksilat;
- 4-(4-klorbenzil)-5-metil-2-(piridin-2-il)-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- 4-(4-klorbenzil)-5-metil-2-{5-[(4-metilpiperazin-1-il)sulfonil]piridin-2-il}-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- 30 • 4-(4-klorbenzil)-2-(5-{[(3*R*,5*S*)-3,5-dimetilpiperidin-1-il]sulfonil}piridin-2-il)-5-metil-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- 6-[4-(4-klorbenzil)-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N,N*-dietilpiridin-3-sulfonamid;
- 6-[4-(4-klorbenzil)-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-etil-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 6-[4-(4-klorbenzil)-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N,N*-di(propan-2-il)piridin-3-sulfonamid;
- 35 • 4-(4-klorbenzil)-5-metil-2-[5-(piperidin-1-ilsulfonil)piridin-2-il]-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- 6-[4-(2-fluorbenzil)-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N,N*-di(propan-2-il)piridin-3-sulfonamid;
- 4-(1,1-dioksidotetrahidrothiofen-3-il)-5-metil-2-[5-(piperidin-1-ilsulfonil)piridin-2-il]-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- 6-[4-(1,1-dioksidotetrahidrothiofen-3-il)-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-etil-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 40 • 6-[4-(1,1-dioksidotetrahidrothiofen-3-il)-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N,N*-di(propan-2-il)piridin-3-sulfonamid;
- 2-{[5-metil-3-okso-2-(piridin-2-il)-2,3-dihidro-1*H*-pirazol-4-il]metil}benzonitril;
- 4-{[5-metil-3-okso-2-(piridin-2-il)-2,3-dihidro-1*H*-pirazol-4-il]metil}benzonitril;
- *N*-etil-6-[4-[4-(metoksimetil)benzil]-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 45 • 4-[3-(metoksimetil)benzil]-5-metil-2-(piridin-2-il)-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- *N*-etil-6-[4-[3-(metoksimetil)benzil]-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 6-[4-(3-cijanobenil)-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-etil-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 6-[4-(4-cijanobenil)-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-etil-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 5-metil-2-(piridin-2-il)-4-(piridin-4-ilmetil)-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- 50 • 3-{[5-metil-3-okso-2-(piridin-2-il)-2,3-dihidro-1*H*-pirazol-4-il]metil}benzonitril;
- 4-benzil-2-(5-bromopiridin-2-il)-5-metil-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- 6-[4-(2-cijanobenil)-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-etil-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- *N*-etil-6-[4-[3-(2-metoksietoksi)benzil]-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 55 • 4-(3,5-dimetoksibenil)-5-metil-2-(piridin-2-il)-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- 5-metil-4-[4-(metilsulfonil)benzil]-2-(piridin-2-il)-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- *N*-etil-6-[3-metil-4-[4-(metilsulfonil)benzil]-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 4-[3-(2-metoksietoksi)benzil]-5-metil-2-(piridin-2-il)-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- 4-benzil-5-metil-2-(piridin-2-il)-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- 60 • *N*-etil-6-[3-metil-5-okso-4-(piridin-4-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- *N*-etil-6-[3-metil-5-okso-4-(piridin-2-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 5-metil-2-(piridin-2-il)-4-(piridin-3-ilmetil)-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;

- 6-(4-benzil-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)-*N*-etil-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- *N*-etil-6-[3-metil-5-okso-4-(piridin-3-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 4-(2,5-dimetoksibenzil)-5-metil-2-(piridin-2-il)-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- 6-[4-(2,5-dimetoksibenzil)-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-etil-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 5 • *N*-etil-6-[3-metil-4-[(1-metilpiperidin-4-il)metil]-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- *N*-etil-6-[3-metil-5-okso-4-[4-(trifluormetil)benzil]-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- *N*-etil-6-[3-metil-5-okso-4-[3-(trifluormetil)benzil]-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 10 • 5-metil-2-(piridin-2-il)-4-[3-(trifluormetil)benzil]-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- 5-metil-2-(piridin-2-il)-4-[4-(trifluormetil)benzil]-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- 6-[4-(3,5-dimetoksibenzil)-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-etil-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 4-(4-hidroksibenzil)-5-metil-2-(piridin-2-il)-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- *N*-etil-6-[4-(4-hidroksibenzil)-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 6-(4-{4-[2-(dimetilamino)etoksi]benzil}-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)-*N*-etil-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 15 • 6-{4-[4-(dimetilamino)benzil]-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il}-*N*-etil-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 5-metil-2-(piridin-2-il)-4-[2-(trifluormetil)benzil]-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- 4-[4-(dimetilamino)benzil]-5-metil-2-(piridin-2-il)-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- *N*-etil-6-[3-metil-5-okso-4-[2-(trifluormetil)benzil]-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 20 • 6-(4-benzil-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)-*N*-(3-metilbutil)piridin-3-sulfonamid;
- 4-[3-(dimetilamino)benzil]-5-metil-2-(piridin-2-il)-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- 6-{4-[3-(dimetilamino)benzil]-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il}-*N*-etil-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 4-(4-metoksibenzil)-5-metil-2-(piridin-2-il)-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- *N*-etil-6-[4-(4-metoksibenzil)-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 25 • 4-(2-metoksibenzil)-5-metil-2-(piridin-2-il)-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- 4-(3-metoksibenzil)-5-metil-2-(piridin-2-il)-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- *N*-etil-6-[4-(3-metoksibenzil)-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 6-(4-{3-[2-(dimetilamino)etoksi]benzil}-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)-*N*-etil-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 30 • *N*-etil-6-[4-(2-metoksibenzil)-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 4-benzil-5-metil-2-[5-(morfolin-4-ilsulfonil)piridin-2-il]-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- *N*-etil-6-[4-(3-hidroksibenzil)-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 6-(4-benzil-3-etil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)-*N*-etil-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 4-(3-hidroksibenzil)-5-metil-2-(piridin-2-il)-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- 35 • *N*-etil-6-[4-[4-(2-metoksietoksi)benzil]-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 4-benzil-5-etil-2-(piridin-2-il)-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- 4-benzil-5-metil-2-[5-(pirolidin-1-ilsulfonil)piridin-2-il]-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- 40 • 2-[5-(azepan-1-ilsulfonil)piridin-2-il]-4-benzil-5-metil-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- *N,N*-dietil-6-[3-metil-5-okso-4-(piridin-3-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]piridin-3-sulfonamid;
- *N,N*-dietil-6-[3-metil-5-okso-4-(piridin-3-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]piridin-3-sulfonamid-hidroklorid;
- *N,N*-dimetil-6-[3-metil-5-okso-4-(piridin-3-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]piridin-3-sulfonamid;
- *N,N*-dimetil-6-[3-metil-5-okso-4-(piridin-3-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]piridin-3-sulfonamid-hidroklorid;
- 45 • 6-(4-benzil-5-okso-3-propil-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)-*N*-etil-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid-hidroklorid;
- 6-[3-metil-5-okso-4-(piridin-3-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-(propan-2-il)piridin-3-sulfonamid-hidroklorid;
- 5-metil-4-(piridin-3-ilmetil)-2-[5-(pirolidin-1-ilsulfonil)piridin-2-il]-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on hidroklorid;
- *N-tert*-butil-6-[3-metil-5-okso-4-(piridin-3-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]piridin-3-sulfonamid-hidroklorid;
- 50 • *N*-ciklopropil-6-[3-metil-5-okso-4-(piridin-3-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]piridin-3-sulfonamid-hidroklorid;
- *N*-ciklopentil-6-[3-metil-5-okso-4-(piridin-3-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]piridin-3-sulfonamid-hidroklorid;
- 55 • *N*-etil-6-[3-metil-5-okso-4-(2-feniletil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 5-metil-4-(2-feniletil)-2-(piridin-2-il)-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- *N*-metil-6-[3-metil-5-okso-4-(piridin-3-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-(piridin-2-il)piridin-3-sulfonamid-hidroklorid;
- 2-{5-[(4-benzilpiperidin-1-il)sulfonil]piridin-2-il}-5-metil-4-(piridin-3-ilmetil)-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- 60 • *N*-etil-6-[3-metil-5-okso-4-(2-fenilpropan-2-il)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- *N*-etil-6-[4-{(6-metoksipiridin-2-il)metil}-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;

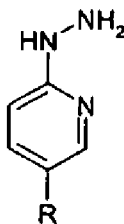
- 6-[3-metil-5-okso-4-(piridin-3-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-(piridin-2-il)piridin-3-sulfonamid-hidroklorid;
- *N*-etil-6-[3-metil-5-okso-4-(1-fenilciklopropil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- *N*-etil-6-[4-[(3-metoksipiridin-2-il)metil]-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid-hidroklorid;
- 6-[4-benzil-3-(metoksimetil)-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-etil-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 6-[4-benzil-5-okso-3-(trifluormetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-etil-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 1-[5-(azepan-1-ilsulfonil)piridin-2-il]-3-metil-4-(piridin-3-ilmetil)-1*H*-pirazol-5-olat;
- *N*-etil-6-[3-metil-5-okso-4-[2-(piridin-2-il)etil]-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- *N*-etil-6-[4-[(5-metoksipiridin-3-il)metil]-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- *N*-(2-metoksietil)-*N*-metil-6-[3-metil-5-okso-4-(piridin-3-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]piridin-3-sulfonamid;
- 6-[4-benzil-3-(2-metilpropil)-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-etil-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- *N*-etil-6-[3-metil-5-okso-4-(piridin-3-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]piridin-3-sulfonamid;
- 6-[3-metil-5-okso-4-(piridin-3-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- *N*-etil-6-[3-metil-5-okso-4-(3-fenilpropil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 6-(4-benzil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)-*N*-etil-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- *N*-ciklopropil-*N*-metil-6-[3-metil-5-okso-4-(piridin-3-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]piridin-3-sulfonamid;
- *N*-*tert*-butil-6-[4-[(5-metoksipiridin-3-il)metil]-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]piridin-3-sulfonamid;
- 6-[4-[(5-cijanopiridin-3-il)metil]-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-etil-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- *tert*-butil-6-[5-okso-4-(piridin-3-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]piridin-3-karboksilat;
- *tert*-butil-6-[3-metil-5-okso-4-(piridin-3-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]piridin-3-karboksilat;
- *N*-*tert*-butil-6-[5-okso-4-(piridin-3-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]piridin-3-sulfonamid;
- *N*-*tert*-butil-6-[5-okso-4-(piridin-3-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]piridin-3-sulfonamid-hidroklorid;
- *N*-etil-6-[5-okso-4-(piridin-3-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 6-(4-benzil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)-*N*-*tert*-butil-*N*-metilpiridin-3-sulfonamid;
- *N*-etil-6-[4-[(5-metoksipiridin-3-il)metil]-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- 5-metil-2-[5-(fenilsulfonil)piridin-2-il]-4-(piridin-3-ilmetil)-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- *N*-*tert*-butil-6-[4-[(5-metoksipiridin-3-il)metil]-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-metilpiridin-3-sulfonamid;
- 6-[4-[(6-cijanopiridin-3-il)metil]-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-etil-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
- (2-{5-[etil(fenil)sulfamoil]piridin-2-il}-3-okso-2,3-dihidro-1*H*-pirazol-4-il)octena kiselina;
- 2-(2-{5-[etil(fenil)sulfamoil]piridin-2-il}-3-okso-2,3-dihidro-1*H*-pirazol-4-il)-*N,N*-dimetilacetamid;
- metil-(2-{5-[etil(fenil)sulfamoil]piridin-2-il}-3-okso-2,3-dihidro-1*H*-pirazol-4-il)acetat;
- etil-(4-benzil-1-{5-[etil(fenil)sulfamoil]piridin-2-il}-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-3-il)acetat;
- 2-(2-{5-[etil(fenil)sulfamoil]piridin-2-il}-3-okso-2,3-dihidro-1*H*-pirazol-4-il)-*N*-metilacetamid;
- *N*-*tert*-butil-6-[4-[(5-metoksipiridin-2-il)metil]-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-metilpiridin-3-sulfonamid;
- 2-(4-benzil-1-{5-[etil(fenil)sulfamoil]piridin-2-il}-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-3-il)-*N,N*-dimetilacetamid;
- 3-(2-{5-[etil(fenil)sulfamoil]piridin-2-il}-3-okso-2,3-dihidro-1*H*-pirazol-4-il)propanska kiselina;
- metil-3-[(2-{5-[etil(fenil)sulfamoil]piridin-2-il}-5-metil-3-okso-2,3-dihidro-1*H*-pirazol-4-il)metil]benzoat;
- metil-3-(2-{5-[etil(fenil)sulfamoil]piridin-2-il}-3-okso-2,3-dihidro-1*H*-pirazol-4-il)propanoat;
- metil-{2-[5-(*tert*-butilsulfamoil)piridin-2-il]-3-okso-2,3-dihidro-1*H*-pirazol-4-il}(fenil)acetat;
- metil-2-[(2-{5-[etil(fenil)sulfamoil]piridin-2-il}-5-metil-3-okso-2,3-dihidro-1*H*-pirazol-4-il)metil]benzoat;
- *N*-ciklopentil-*N*-etil-6-[5-okso-4-(piridin-3-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]piridin-3-sulfonamid;
- *N*-ciklopentil-*N*-metil-6-[5-okso-4-(piridin-3-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]piridin-3-sulfonamid;
- 2-[(1-{5-[etil(fenil)sulfamoil]piridin-2-il}-3-metil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-4-il)metil]benzoat;
- 2-[5-(azepan-1-ilsulfonil)piridin-2-il]-4-(piridin-3-ilmetil)-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
- *N*-ciklopentil-*N*-metil-6-[5-okso-4-(piridin-4-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]piridin-3-sulfonamid;
- *N*-ciklopentil-*N*-etil-6-[5-okso-4-(piridin-4-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]piridin-3-sulfonamid;
- metil-3-(2-{5-[ciklopentil(metil)sulfamoil]piridin-2-il}-3-okso-2,3-dihidro-1*H*-pirazol-4-il)-3-fenilpropanoat;
- *N*-(2,2-dimetilpropil)-*N*-metil-6-[5-okso-4-(piridin-3-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]piridin-3-sulfonamid;
- 2,2-dimetilpropil-6-[5-okso-4-(piridin-3-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]piridin-3-karboksilat;
- metil-*N*-ciklopentil-*N*-({6-[5-okso-4-(piridin-3-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]piridin-3-il)sulfonil)glicinat;
- 6-(4-benzil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)-*N*-[2-(benziloksi)etil]-*N*-ciklopentilpiridin-3-sulfonamid;
- 6-(4-benzil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)-*N*-[3-(benziloksi)propil]-*N*-ciklopentilpiridin-3-sulfonamid;
- 6-(4-benzil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)-*N*-ciklopentil-*N*-(3-hidroksipropil)piridin-3-sulfonamid;

- 6-(4-benzil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)-*N*-ciklopentil-*N*-(2-hidroksietil)piridin-3-sulfonamid;
 - metil-(1*S*,2*R*)-2-[metil({6-[5-okso-4-(piridin-3-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]piridin-3-il)sulfonylamino]ciklopentanekarboksilat;
 - 6-(4-benzil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)-*N*-ciklopentil-*N*-(2,3-dihidroksipropil)piridin-3-sulfonamid;
 - 6-(4-benzil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)-*N*-ciklopentil-*N*-[2-(dimetilamino)etil]piridin-3-sulfonamid;
 - 4-benzil-2-{5-[(4-metilpiperazin-1-il)sulfonyl]piridin-2-il}-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
 - 6-[4-(ciklopentilmetil)-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-etil-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
 - 4-benzil-2-{5-[(4-metil-1,4-diazepan-1-il)sulfonyl]piridin-2-il}-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
 - *N*-(2,2-dimetilpropil)-6-[5-okso-4-(piridin-3-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]piridin-3-sulfonamid;
 - *N*-(2-metilbutan-2-il)-6-[5-okso-4-(piridin-3-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]piridin-3-sulfonamid;
 - 6-(4-benzil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)-*N*-[(1*R*,3*S*)-3-(hidroksimetil)iklopentil]-*N*-metilpiridin-3-sulfonamid;
 - 6-(4-benzil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)-*N*-metil-*N*-(1-metilpirolidin-3-il)piridin-3-sulfonamid;
 - 6-(4-benzil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)-*N*-(2-metoksi-2-metilpropil)piridin-3-sulfonamid;
 - 2,2-dimetilpropil-6-(4-benzil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)piridin-3-karboksilat;
 - 6-(4-benzil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)-*N*-ciklopentil-*N*-[(2*R*)-2,3-dihidroksipropil]piridin-3-sulfonamid;
 - 6-(4-benzil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)-*N*-(2,3-dihidroksipropil)-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
 - *N*-ciklopentil-6-{4-[(4-metoksipiridin-3-il)metil]-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il}-*N*-metilpiridin-3-sulfonamid;
 - *N*-metil-*N*-(2-metilbutan-2-il)-6-[5-okso-4-(piridin-3-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]piridin-3-sulfonamid;
 - 3-(2-{5-[ciklopentil(metil)sulfamoil]piridin-2-il}-3-okso-2,3-dihidro-1*H*-pirazol-4-il)-3-fenil-*N*-(2,2,2-trifluoretil)propanamid;
 - 6-(4-benzil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)-*N*-ciklopentil-*N*-[3-hidroksi-2-(hidroksimetil)propil]piridin-3-sulfonamid;
 - 6-(4-benzil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)-*N*-ciklopentil-*N*-[(2*S*)-2,3-dihidroksipropil]piridin-3-sulfonamid;
 - 2,2-dimetilpropil-6-[5-okso-4-(piridin-4-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]piridin-3-karboksilat;
 - 6-(4-benzil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)-*N*-[(1*S*,2*S*)-2-hidroksiciklopentil]piridin-3-sulfonamid;
 - *N*-*tert*-butil-6-[5-okso-4-(piridin-4-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]piridin-3-sulfonamid;
 - 4-benzil-2-(5-{[(3*R*)-3-(dimetilamino)pirolidin-1-il]sulfonyl}piridin-2-il)-1,2-dihidro-3*H*-pirazol-3-on;
 - 6-(4-benzil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)-*N*-[1-(dimetilamino)-2-metilpropan-2-il]piridin-3-sulfonamid;
 - 6-(4-benzil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)-*N*-metil-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid;
 - metil-3-{2-[5-(*tert*-butilsulfamoil)piridin-2-il]-3-okso-2,3-dihidro-1*H*-pirazol-4-il}-3-(piridin-3-il)propanoat;
 - etil-3-{2-[5-(*tert*-butilsulfamoil)piridin-2-il]-3-okso-2,3-dihidro-1*H*-pirazol-4-il}-3-fenilpropanoat;
 - 6-(4-benzil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)-*N*-*tert*-butil-*N*-(2,3-dihidroksipropil)piridin-3-sulfonamid;
 - 6-(4-benzil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)-*N*-(2-hidroksietil)piridin-3-sulfonamid;
 - *N*-(2,3-dihidroksipropil)-6-[5-okso-4-(piridin-3-ilmetil)-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il]-*N*-fenilpiridin-3-sulfonamid-hidroklorid;
 - metil-3-(2-{5-[ciklopentil(metil)sulfamoil]piridin-2-il}-3-okso-2,3-dihidro-1*H*-pirazol-4-il)-3-(piridin-3-il)propanoat-hidroklorid;
 - 6-(4-benzil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)-*N*-ciklopentil-*N*-[3-(dimetilamino)propil]piridin-3-sulfonamid-hidroklorid;
 - 6-(4-benzil-5-okso-2,5-dihidro-1*H*-pirazol-1-il)-*N*-ciklopentil-*N*-[3-(dimetilamino)propil]piridin-3-sulfonamid-hidroklorid.
17. Postupak dobivanja spoja formule (I) u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 16, **naznačen time** što spoj formule (II)



(II)

u kojoj R1 i R2 su definirani kao u patentnom zahtjevu 1, a z predstavlja alkilnu skupinu, reagira sa spojem formule (III)



(III)

u kojoj R je definiran kao u patentnom zahtjevu 1.

18. Medikament, **naznačen time** što sadrži spoj formule (I) u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 16, ili adicijsku sol spoja formule (I) s farmaceutski prihvatljivom kiselinom.
- 5 19. Farmaceutski pripravak, **naznačen time** što sadrži spoj formule (I) u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 16, ili farmaceutski prihvatljivu sol tog spoja, a također i najmanje jednu farmaceutski prihvatljivu pomoćnu tvar.
20. Upotreba spoja formule (I) u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 16, **naznačena time** što je navedeni spoj namijenjen pripravi medikamenta za liječenje odnosno profilaksu kardiovaskularnih bolesti.
- 10 21. Upotreba spoja formule (I) u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 16, **naznačena time** što je navedeni spoj namijenjen pripravi medikamenta za liječenje odnosno profilaksu ishemijske donjih udova, srčane insuficijencije, bolesti koronarnih arterija ishemijskog uzroka, primjerice angine pectoris ili infarkta miokarda, arterioskleroze, infarkta ishemijskog uzroka, plućne hipertenzije i bilo koje patološke pojave uzrokovane djelomičnim ili potpunim začepljenjem krvnih žila.
- 15 22. Upotreba spoja formule (I) u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 16, **naznačena time** što je navedeni spoj namijenjen pripravi medikamenta za liječenje odnosno profilaksu glaukoma, bubrežnih bolesti ili cerebralnih bolesti neurodegenerativnog ili kojeg drugog uzroka, anemije, ili medikamenta za poticanje zacjelivanja, ili agensa koji skraćuju vrijeme postoperativnog oporavka, ili medikamenta za liječenje stanja općeg umora, ili, alternativno, medikamenta kojeg se upotrebljava u svrhu dobivanja krvi u kontekstu autotransfuzije koja je nužna nakon velikih kirurških intervencija, poput zahvata na lubanji ili prsnoj koži, ili operacija na srcu, karotidama ili aorti.
- 20 23. Upotreba spoja formule (I) u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 16, **naznačena time** što je navedeni spoj namijenjen pripravi medikamenta za liječenje odnosno profilaksu bolesti srca ili perifernih krvnih žila ishemijskog uzroka uz pomoć regenerativne medicine gdje se upotrebljavaju matične stanice.
- 25 24. Kombinacija spoja formule (I) u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 16, **naznačena time** što se kombinira s jednim ili više aktivnih spojeva korisnih u liječenju hipertenzije, srčane insuficijencije, dijabetesa i anemije.