

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges
Eigentum

Internationales Büro

(43) Internationales
Veröffentlichungsdatum
30. Mai 2013 (30.05.2013)



(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2013/076168 A1

(51) Internationale Patentklassifikation:

C07D 471/04 (2006.01) **A61P 9/00** (2006.01)
A61K 31/506 (2006.01)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2012/073276

(22) Internationales Anmeldedatum:
21. November 2012 (21.11.2012)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
11190789.5 25. November 2011 (25.11.2011) EP
11192301.7 7. Dezember 2011 (07.12.2011) EP

(71) Anmelder: **BAYER PHARMA**
AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; Müllerstr. 178,
13353 Berlin (DE). **BAYER INTELLECTUAL**
PROPERTY GMBH [DE/DE]; Alfred-Nobel-Str. 10,
40789 Monheim (DE).

(72) Erfinder: **FEY, Peter**; Am Eickhof 23, 42111 Wuppertal
(DE).

(74) Anwalt: **BAYER INTELLECTUAL PROPERTY**
GMBH; Alfred-Nobel-Str.10, 40789 Monheim (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,
AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW,
BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK,
DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM,
GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN,
KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD,
ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI,
NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU,
RW, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ,
TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA,
ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,
GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, SZ,
TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ,
RU, TJ, TM), europäisches (AL, AT, BE, BG, CH, CY,
CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT,
LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE,
SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA,
GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

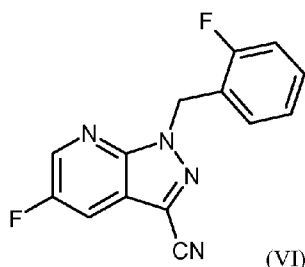
Erklärungen gemäß Regel 4.17:

— hinsichtlich der Identität des Erfinders (Regel 4.17 Ziffer i)

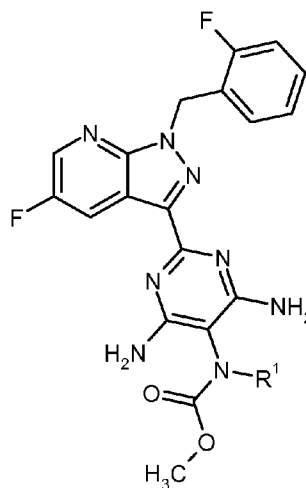
[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: METHOD FOR PRODUCING SUBSTITUTED 5-FLUORO-1H-PYRAZOLOPYRIDINES

(54) Bezeichnung : VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON SUBSTITUIERTEN 5-FLUOR-1H-PYRAZOLOPYRIDINEN



(VI)



(I),

(57) Abstract: The present application relates to a novel and efficient method for producing novel substituted 5-fluoro-1H-pyrazolopyridines of the formula (VI) which are suitable as an intermediate for producing medicaments and for producing medicaments for the treatment and/or prophylaxis of cardiovascular disorders. In particular, the 5-fluoro-1H-pyrazolopyridines of the formula (VI) are suitable for producing the compound of the formula (I) which serves for producing medicaments, for producing medicaments for the treatment and/or prophylaxis of cardiovascular disorders.

(57) Zusammenfassung:

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]



WO 2013/076168 A1

**Veröffentlicht:**

— mit internationalem Recherchenbericht (Artikel 21 Absatz 3)

— vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen eingehen (Regel 48 Absatz 2 Buchstabe h)

Die vorliegende Anmeldung betrifft ein neues und effizientes Verfahren zur Herstellung von neuen substituierten 5-Fluor-1H-pyrazolopyridinen der Formel (VI), welche sich als Zwischenstufe zur Herstellung von Arzneimitteln und zur Herstellung von Arzneimitteln zur Behandlung und/oder Prophylaxe von kardiovaskulären Erkrankungen eignen. Insbesondere eignen sich die 5-Fluor-1H-pyrazolopyridine der Formel (VI) zur Herstellung der Verbindung der Formel (I), welche zur Herstellung von Arzneimitteln, zur Herstellung von Arzneimitteln zur Behandlung und/oder Prophylaxe von kardiovaskulären Erkrankungen, dient.