(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator dokumenta: **HR P20201821 T1**

HR P20201821 T1

(12) PRIJEVOD PATENTNIH ZAHTJEVA EUROPSKOG PATENTA

(51) MKP:
A61P 11/00 (2006.01)
C07F 5/02 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 16.04.2021.

(21) Broj predmeta: P20201821T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 16.11.2020.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2017060413
Datum podnošenja međunarodne prijave: 02.05.2017.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 17721137.2
Datum podnošenja europske prijave patenta: 02.05.2017.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2017191130
Datum međunarodne objave: 09.11.2017.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3452485 A2
Datum objave europske prijave patenta: 13.03.2019.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3452485 B1
Datum objave europskog patenta: 09.09.2020.

(31) Broj prve prijave:	(32) Datum podnošenja prve prijave:	(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave:
201662331550 P	04.05.2016.	US
41706616	04.05.2016.	PL
201762444669 P	10.01.2017.	US

(73) Nositelj patenta: **Oncoarendi Therapeutics SA , 02-089 Warszawa, PL**

(72) Izumitelji:
Roman Blaszczyk, 94-109 Lodz, PL
Julita Nowicka, 95-070 Wola Grzymkowa, PL
Bartlomiej Borek, 93-519 Lodz, PL
Joanna Brzezinska, 91-503 Lodz, PL
Anna Gzik, 99-220 Wartkowice, PL
Marek Dziegielewski, 94-047 Lodz, PL
Adam Golebiowski, Madison, CT 06443, US
Karol Jedrzejczak, 91-067 Lodz, PL
Krzysztof Matyszewski, 93-160 Lodz, PL
Jacek Olczak, 90-340 Lodz, PL

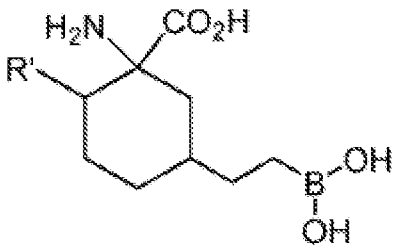
(74) Zastupnik: ZMP IP d.o.o., 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma: **INHIBITORI ARGINAZE I NJIHOVE TERAPEUTSKE PRIMJENE**

HR P20201821 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

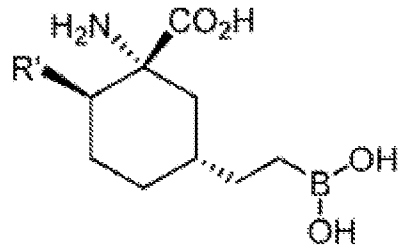
1. Spoj predstavljen formulom (Ib):



(Ib)

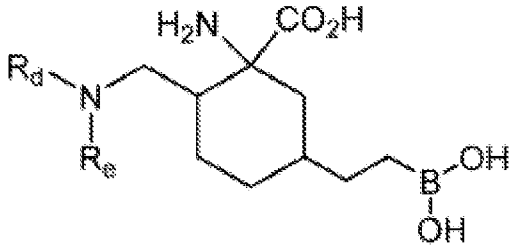
gdje:
R' je –OH, (C_1-C_8)alkil ili -NH_2, pri čemu je alkil izborno supstituiran s –NR^dR^e ili s heterociklilom koji ima od 3 do 7 atoma članova prstena;
pri čemu su R^d i R^e svaki nezavisno vodik, ravni ili razgranati (C_1-C_6)alkil, izborno supstituirani (C_3-C_{14})aril(C_1-C_6)alkilen- ili izborno supstituirani (C_3-C_{14})aril,
ili njegov tautomer, stereoizomer, racemat, farmaceutski prihvatljiva sol, ester, solvat, ili polimorf.

2. Spoj prema zahtjevu 1, koji ima strukturu formule (Ib-1):



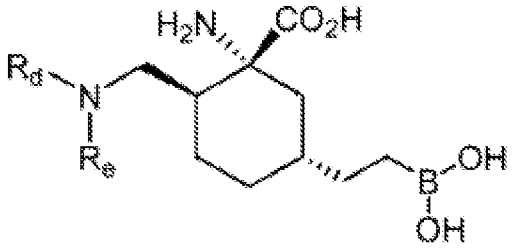
(Ib-1).

3. Spoj prema zahtjevu 1, pri čemu R' je –CH_2NH_2, -CH_2NHCH_3, -$CH_2NHC(CH_3)_3$, -$CH_2N(CH_3)_2$, -$CH_2N(CH_3)(CH_2CH_3)$, -$CH_2N(CH_2CH_3)_2$, -$CH_2N(CH_3)(CH(CH_3)_2)$, -CH_2-pirolidinil, -CH_2-piperidinil, -CH_2-(7-azabiciklo[2.2.1]heptil), -CH_2-morfolinil, -CH_2NCH_3Bn, -CH_2-(4,4-dimetilpiperidinil), -CH_2-izoindolinil, -CH_2-(4-klorofenil-piperidinil), -CH_2-tetrahidroizokvinolinil, -$CH_2N(CH_3)Ph$, -$CH_2N(CH_3)(4\text{-}CH_3OC_6H_4)$ ili -$CH_2N(CH_3)$(diklorobenzil).
4. Spoj prema zahtjevu 1, pri čemu
R' je (C_1-C_4)alkil supstituiran s –NR^dR^e ili heterociklil koji ima od 5 do 6 atoma članova prstena;
pri čemu su R^d i R^e svaki nezavisno vodik ili ravni, razgranati (C_1-C_6)alkil.
5. Spoj prema zahtjevu 1, koji ima strukturu formule (Ic):



(Ic)

gdje:
R^d i R^e su svaki nezavisno odabrani od vodika, ravnog ili razgranatog (C_1-C_6)alkila
ili se R^d i R^e kombiniraju s atomom dušika na kojeg su vezani kako bi tvorili heterociklil koji ima od 5 do 6 atoma članova prstena.
6. Spoj prema zahtjevu 5, koji ima strukturu formule (Ic-1):



(Ic-1).

7. Spoj prema zahtjevu 5, pri čemu
-N(R^d)R^e) je -NH_2, -$NHCH_3$, -$NHC(CH_3)_3$, -$N(CH_3)_2$, $N(CH_3)(CH_2CH_3)$, $N(CH_2CH_3)_2$, $N(CH_3)(CH(CH_3)_2)$, -NCH_3Bn, -$N(CH_3)(4\text{-}CH_3OC_6H_4)$, -$N(CH_3)$(diklorobenzil) ili -$N(CH_3)Ph$,
ili se R^d i R^e kombiniraju s atomom dušika na kojeg su vezani kako bi tvorili-azetidinil, pirolidinil, piperidinil, (7-azabiciklo[2.2.1]heptil), morfolinil, (4,4-dimetilpiperidinil), izoindolinil, (4-klorofenil-piperidinil) ili tetrahidroizokvinolinil.

8. Spoj prema zahtjevu 5, pri čemu
-N(R^d)R^e) je -NH_2, -$NHCH_3$, -$NHC(CH_3)_3$, -$N(CH_3)_2$, $N(CH_3)(CH_2CH_3)$, $N(CH_2CH_3)_2$ ili $N(CH_3)(CH(CH_3)_2)$,
ili se R^d i R^e kombiniraju s atomom dušika na kojeg su vezani kako bi tvorili-pirolidinil, piperidinil ili (7-azabiciklo[2.2.1]heptil).

9. Spoj prema zahtjevu 1, pri čemu je spoj:
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-hidroksicikloheksan-1-karboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((dimetilamino)metil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(morfolinometil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina;
1-amino-2-((benzil(metil)amino)metil)-5-(2-boronoetil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(pirolidin-1-ilmetil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina;
1-amino-2-(aminometil)-5-(2-boronoetil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(2-(pirolidin-1-il)etil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((4,4-dimetilpiperidin-1-il)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((4-(4-klorofenil)piperidin-1-il)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(((3,4-diklorobenzil)(metil)amino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(izoindolin-2-ilmetil)cikloheksankarboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((dietilamino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(piperidin-1-ilmetil)cikloheksankarboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((izopropil(metil)amino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((*tert*-butilamino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
2-(7-azabiciklo[2.2.1]heptan-7-ilmetil)-1-amino-5-(2-boronoetil)cikloheksankarboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((3,4-dihidroizokvinolin-2(1*H*)-il)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(((2,2,2-trifluoroetil)amino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(((4-metoksifenil)(metil)amino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((metilamino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((metil(fenil)amino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(1-(dimetilamino)etil)cikloheksankarboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(dimetilamino)cikloheksan-1-karboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((etil(metil)amino)metil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina; ili
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(piperidin-1-ilmetil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina
ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, ili njegov stereoizomer, tautomer ili solvat.

10. Spoj prema zahtjevu 1, pri čemu je spoj:
rac-(1*R*,2*R*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-hidroksicikloheksan-1-karboksilna kiselina; *rac*-(1*S*,2*R*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-hidroksicikloheksan-1-karboksilna kiselina; *rac*-(1*S*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-hidroksicikloheksan-1-karboksilna kiselina;
rac-(2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-hidroksicikloheksan-1-karboksilna kiselina;
rac-(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((dimetilamino)metil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina;
rac-(1*R*,2*R*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((dimetilamino)metil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina;
rac-(1*S*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((dimetilamino)metil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(morfolinometil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina;
1-amino-2-((benzil(metil)amino)metil)-5-(2-boronoetil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina;
rac-(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(pirolidin-1-ilmetil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina;
(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(pirolidin-1-ilmetil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina;

1-amino-2-(aminometil)-5-(2-boronoetil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(2-(pirolidin-1-il)etil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina; *rac*-(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((4,4-dimetilpiperidin-1-il)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
rac-(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((4-(4-klorofenil)piperidin-1-il)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
rac-(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(((3,4-diklorobenzil)(metil)amino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
rac-(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(izoindolin-2-ilmetil)cikloheksankarboksilna kiselina;
rac-(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((dietilamino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
rac-(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(piperidin-1-ilmetil)cikloheksankarboksilna kiselina;
rac-(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((izopropil(metil)amino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
rac-(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((tert-butilamino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
rac-(1*R*,2*S*,5*R*)-2-(7-azabiciklo[2.2.1]heptan-7-ilmetil)-1-amino-5-(2-boronoetil)cikloheksankarboksilna kiselina;
rac-(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((3,4-dihidroizokvinolin-2(1H)-il)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
rac-(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(((2,2,2-trifluoroetil)amino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
rac-(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(((4-metoksifenil)(metil)amino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((dimetilamino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((metilamino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
rac-(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((metil(fenil)amino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(1-(dimetilamino)etil)cikloheksankarboksilna kiselina;
(5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(2-(pirolidin-1-il)etil)cikloheksankarboksilna kiselina; (5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(2-(dimetilamino)etil)cikloheksankarboksilna kiselina; 1,2-diamino-5-(2-boronoetil)cikloheksankarboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(hidroksimetil)cikloheksankarboksilna kiselina;
1-amino-3-(2-boronoetil)-5-(dimetilamino)cikloheksan-1-karboksilna kiselina; (1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((etil(metil)amino)metil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina;
(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(piperidin-1-ilmetil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina;
ili (1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(pirolidin-1-ilmetil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina
ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, ili njegov stereoizomer, tautomer ili solvat.

11. Spoj prema zahtjevu 1, pri čemu je spoj:
rac-(1*R*,2*R*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-hidroksicikloheksan-1-karboksilna kiselina hidroklorid;
rac-(1*S*,2*R*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-hidroksicikloheksan-1-karboksilna kiselina hidroklorid;
rac-(1*S*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-hidroksicikloheksan-1-karboksilna kiselina hidroklorid;
rac-(2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-hidroksicikloheksan-1-karboksilna kiselina hidroklorid;
rac-(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((dimetilamino)metil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina dihidroklorid;
rac-(1*R*,2*R*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((dimetilamino)metil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina dihidroklorid;
rac-(1*S*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((dimetilamino)metil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina dihidroklorid;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(morfolinometil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina dihidroklorid;
1-amino-2-((benzil(metil)amino)metil)-5-(2-boronoetil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina dihidroklorid;
rac-(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(pirolidin-1-ilmetil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina dihidroklorid;
(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(pirolidin-1-ilmetil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina dihidroklorid;
1-amino-2-(aminometil)-5-(2-boronoetil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina dihidroklorid;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(2-(pirolidin-1-il)etil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina dihidroklorid;
rac-(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((4,4-dimetilpiperidin-1-il)metil)cikloheksankarboksilna kiselina dihidroklorid;
rac-(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((4-(4-klorofenil)pipendin-1-il)metil)cikloheksankarboksilna kiselina dihidroklorid;
rac-(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(((3,4-diklorobenzil)(metil)amino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina dihidroklorid;
rac-(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(izoindolin-2-ilmetil)cikloheksankarboksilna kiselina dihidroklorid;
rac-(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((dietilamino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina dihidroklorid;
rac-(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(piperidin-1-ilmetil)cikloheksankarboksilna kiselina dihidroklorid;
rac-(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((izopropil(metil)amino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina dihidroklorid;

rac-(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((tert-butilamino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina dihidroklorid;
rac-(1*R*,2*S*,5*R*)-2-(7-azabiciklo[2.2.1]heptan-7-ilmetil)-1-amino-5-(2-boronoetil)cikloheksankarboksilna kiselina dihidroklorid;
rac-(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((3,4-dihidroizokvinolin-2(1H)-il)metil)cikloheksankarboksilna kiselina dihidroklorid;
rac-(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(((2,2,2-trifluoroetil)amino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina dihidroklorid;
rac-(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(((4-metoksifenil)(metil)amino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina dihidroklorid; (1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((dimetilamino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina dihidroklorid;
(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((metilamino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina dihidroklorid;
rac-(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((metil(fenil)amino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina dihidroklorid;
(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(1-(dimetilamino)etil)cikloheksankarboksilna kiselina dihidroklorid;
(5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(2-(pirolidin-1-il)etil)cikloheksankarboksilna kiselina; (5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(2-(dimetilamino)etil)cikloheksankarboksilna kiselina dihidroklorid;
1,2-diamino-5-(2-boronoetil)cikloheksankarboksilna kiselina dihidroklorid;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(hidroksimetil)cikloheksankarboksilna kiselina dihidroklorid;
rac-(1*R*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(dimetilamino)cikloheksan-1-karboksilna kiselina dihidroklorid;
(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((etil(metil)amino)metil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina dihidroklorid;
(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(piperidin-1-ilmetil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina dihidroklorid;
ili (1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(pirolidin-1-ilmetil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina dihidroklorid
ili njegov solvat.

12. Spoj prema zahtjevu 1, pri čemu je spoj:
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(piperidin-1-ilmetil)cikloheksankarboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((izopropil(metil)amino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((tert-butilamino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
2-(7-azabiciklo[2.2.1]heptan-7-ilmetil)-1-amino-5-(2-boronoetil)cikloheksankarboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((dimetilamino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((metilamino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(2-(dimetilamino)etil)cikloheksankarboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(pirolidin-1-ilmetil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((etil(metil)amino)metil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina;
1-amino-2-(aminometil)-4-(2-boronoetil)ciklopentan-1-karboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(2-(pirolidin-1-il)etil)cikloheksankarboksilna kiselina;
1,2-diamino-5-(2-boronoetil)cikloheksankarboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-hidroksicikloheksan-1-karboksilna kiselina;
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((dimetilamino)metil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina; ili
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(piperidin-1-ilmetil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina;
ili njegov stereoizomer, tautomer, farmaceutski prihvatljiva sol, i/ili solvat.

13. Spoj prema zahtjevu 1, pri čemu je spoj:
(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(piperidin-1-ilmetil)cikloheksankarboksilna kiselina;
(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((izopropil(metil)amino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((tert-butilamino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
(1*R*,2*S*,5*R*)-2-(7-azabiciklo[2.2.1]heptan-7-ilmetil)-1-amino-5-(2-boronoetil)cikloheksankarboksilna kiselina;
(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((dimetilamino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((metilamino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
(5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(2-(dimetilamino)etil)cikloheksankarboksilna kiselina; (1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(pirolidin-1-ilmetil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina;
(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((etil(metil)amino)metil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina;
1-amino-2-(aminometil)-4-(2-boronoetil)ciklopentan-1-karboksilna kiselina;
1-amino-4-(2-boronoetil)-2-((dimetilamino)metil)ciklopentan-1-karboksilna kiselina; (5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(2-(pirolidin-1-il)etil)cikloheksankarboksilna kiselina; 1,2-diamino-5-(2-boronoetil)cikloheksankarboksilna kiselina;
rac-(1*R*,2*R*,5*R*)-1-Amino-5-(2-boronoetil)-2-hidroksicikloheksan-1-karboksilna kiselina; *rac*-(1*S*,2*R*,5*R*)-1-Amino-5-(2-boronoetil)-2-hidroksicikloheksan-1-karboksilna kiselina; *rac*-(1*S*,2*S*,5*R*)-1-Amino-5-(2-boronoetil)-2-hidroksicikloheksan-1-karboksilna kiselina; *rac*-(2*S*,5*R*)-1-Amino-5-(2-boronoetil)-2-hidroksicikloheksan-1-karboksilna kiselina;
rac-(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((dimetilamino)metil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina dihidroklorid;

rac-(1*R*,2*R*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((dimetilamino)metil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina dihidroklorid;
rac-(1*R*,2*R*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((dimetilamino)metil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina dihidroklorid; ili
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(piperidin-1-ilmetil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina
ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, i/ili solvat.

14. Spoj prema zahtjevu 1, pri čemu je spoj:
(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(piperidin-1-ilmetil)cikloheksankarboksilna kiselina dihidroklorid;
(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((izopropil(metil)amino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((tert-butilamino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina dihidroklorid;
(1*R*,2*S*,5*R*)-2-(7-azabiciklo[2.2.1]heptan-7-ilmetil)-1-amino-5-(2-boronoetil)cikloheksankarboksilna kiselina dihidroklorid;
(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((dimetilamino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina;
(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((metilamino)metil)cikloheksankarboksilna kiselina dihidroklorid;
(5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(2-(dimetilamino)etil)cikloheksankarboksilna kiselina dihidroklorid;
rac-(1*R*,2*R*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(pirolidin-1-ilmetil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina dihidroklorid;
(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(pirolidin-1-ilmetil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina dihidroklorid;
(1*R*,2*S*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((etil(metil)amino)metil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina;
1-amino-2-(aminometil)-4-(2-boronoetil)ciklopentan-1-karboksilna kiselina dihidroklorid;
1-amino-4-(2-boronoetil)-2-((dimetilamino)metil)ciklopentan-1-karboksilna kiselina; (5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(2-(pirolidin-1-il)etil)cikloheksankarboksilna kiselina; 1,2-diamino-5-(2-boronoetil)cikloheksankarboksilna kiselina dihidroklorid;
rac-(1*R*,2*R*,5*R*)-1-Amino-5-(2-boronoetil)-2-hidroksicikloheksan-1-karboksilna kiselina hidroklorid;
rac-(1*R*,2*R*,5*R*)-1-Amino-5-(2-boronoetil)-2-hidroksicikloheksan-1-karboksilna kiselina hidroklorid;
rac-(1*R*,2*R*,5*R*)-1-Amino-5-(2-boronoetil)-2-hidroksicikloheksan-1-karboksilna kiselina hidroklorid;
rac-(2*S*,5*R*)-1-Amino-5-(2-boronoetil)-2-hidroksicikloheksan-1-karboksilna kiselina hidroklorid;
rac-(1*R*,2*R*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((dimetilamino)metil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina dihidroklorid;
rac-(1*R*,2*R*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((dimetilamino)metil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina dihidroklorid;
rac-(1*R*,2*R*,5*R*)-1-amino-5-(2-boronoetil)-2-((dimetilamino)metil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina dihidroklorid; ili
1-amino-5-(2-boronoetil)-2-(piperidin-1-ilmetil)cikloheksan-1-karboksilna kiselina
ili njegov solvat.

15. Farmaceutski pripravak koji sadrži spoj prema zahtjevu 1, ili njegov stereoizomer, tautomer, farmaceutski prihvatljivu sol, ili solvat; i farmaceutski prihvatljivi nosač.

16. Spoj prema zahtjevu 1, ili njegov stereoizomer, tautomer, farmaceutski prihvatljiva sol, ili solvat, za uporabu u liječenju ili prevenciji bolesti ili stanja odabranog iz skupine koja se sastoji od kardiovaskularnih poremećaja, seksualnih poremećaja, poremećaja oporavka rana, gastrointestinalnih poremećaja, autoimunih poremećaja, imunoloških poremećaja, infekcija, plućnih poremećaja, hemolitičkih poremećaja, te rakova.

17. Spoj prema zahtjevu 1, ili njegov stereoizomer, tautomer, farmaceutski prihvatljiva sol, ili solvat, za uporabu prema zahtjevu 16, pri čemu je autoimuni poremećaj odabran iz skupine koja se sastoji od encefalomijelitisa, multiple skleroze, anti-fosfolipid sindroma 1, autoimune hemolitičke anemije, kronične upalne demijelinizirajuće poliradikuloneuropatije, dermatitis herpetiformisa, dermatomiozitisa, miastenije gravis, pemfigusa, reumatoidnog artritisa, sindroma ukočenja, dijabetesa tipa 1, ankilozantnog spondilitisa, paroksimalne nokturalne hemoglobinurije (PNH), paroksimalne hladne hemoglobinurije, teške idiopatske autoimune hemolitičke anemije, te Goodpastureovog sindroma.

18. Spoj prema zahtjevu 1, ili njegov stereoizomer, tautomer, farmaceutski prihvatljiva sol, ili solvat, za uporabu prema zahtjevu 16, pri čemu je plućni poremećaj odabran iz skupine koja se sastoji od kemijski inducirane fibroze pluća, idiopatske fibroze pluća, cistične fibroze, kronične opstruktivne bolesti pluća (COPD), te astme.

19. Spoj prema zahtjevu 1, ili njegov stereoizomer, tautomer, farmaceutski prihvatljiva sol, ili solvat, za uporabu prema zahtjevu 16, pri čemu je plućni poremećaj plućna hipertenzija.

20. Spoj prema zahtjevu 1, ili njegov stereoizomer, tautomer, farmaceutski prihvatljiva sol, ili solvat, za uporabu prema zahtjevu 16, pri čemu je hemolitički poremećaj bolest srpastih stanica.

21. Spoj prema zahtjevu 1, ili njegov stereoizomer, tautomer, farmaceutski prihvatljiva sol, ili solvat, za uporabu prema zahtjevu 16, pri čemu je rak odabran iz skupine koja se sastoji od raka želuca, raka gastroezofagealnog spoja, kolorektalnog raka, raka gušterače, raka jetre, raka dojke, raka pluća ne-malih stanica, raka bubrežnih stanica, raka prostate, multiplog mijeloma, akutne i kronične leukemije, limfoma T stanica, B stanica i NK stanica, neuroblastoma, glioblastoma, astrocitoma, raka skvamoznih stanica glave i vrata, te melanoma.

22. Spoj prema zahtjevu 1, ili njegov stereoizomer, tautomer, farmaceutski prihvatljiva sol, ili solvat, za uporabu prema zahtjevu 16, pri čemu je rak kronična limfocitna leukemija, akutna limfoblastična leukemija, kronična

mijelogena leukemija, akutna mijeloična leukemija, adrenokortikalni karcinom, analni rak, rak slijepog crijeva, atipični teratoidni/rabdoidni tumor, karcinom bazalnih stanica, rak žučnog kanala, rak mokraćnog mjehura, rak kostiju, tumor mozga, tumor moždane i leđne moždine, gliom moždanog debla, atipični teratoidni/rabdoidni tumor središnjeg živčanog sustava, embrionalni tumori središnjeg živčanog sustava, rak dojke, tumori bronha, burkittov limfom, karcinoidni tumor, karcinom nepoznatog primarnog sijela, rak središnjeg živčanog sustava, rak vrata maternice, rakovi u djetinjstvu, kordom, kronični mijeloproliferativni poremećaji, rak debelog crijeva, kraniofaringiom, kožni limfom t-stanica, duktalni karcinom in situ, embrionalni tumori, rak endometrija, ependimoblastom, ependimom, rak jednjaka, estezioneuroblastom, ewingov sarkom, ekstrakranijalni tumor zametnih stanica, ekstrahepatični rak žučnog kanala, rak oka, vlaknasti histiocitom kostiju, rak žučne vrećice, rak želuca, gastrointestinalni karcinoidni tumor, gastrointestinalni stromalni tumori, tumor zametnih stanica, ekstrakranijalni tumor zametnih stanica, ekstragonadni tumor zametnih stanica, tumor zametnih stanica jajnika, gestacijski trofoblastični tumor, gliom, leukemija dlakavih stanica, rak glave i vrata, rak srca, hepatocelularni rak, histiocitoza, rak langerhansovih stanica, hodgkinov limfom, hipofaringealni rak, intraokularni melanom, tumori otočnih stanica, kaposi sarkom, rak bubrega, histiocitoza langerhansovih stanica, rak grkljana, rak usana i usne šupljine, lobularni karcinom in situ, limfom, limfom povezan sa AIDS-om, makroglobulinemija, karcinom dojke kod muškaraca, meduloblastom, meduloepiteliom, karcinom merkelovih stanica, maligni mezoteliom, metastatski skvamozni karcinom vrata s okultnim primarnim sijelom, karcinom srednjeg trakta koji uključuje NUT gen, rak usta, sindrom multiple endokrine neoplazije, neoplazam plazma stanica, fungoidna mikoza, mijelom, kronični mijeloproliferativni poremećaj, rak nosne šupljine, rak paranazalnih sinusa, rak nazofarinksa, ne-hodgkinov limfom, rak usta, rak usne šupljine, rak usne, rak orofaringusa, osteosarkom, rak jajnika, papilomatoza, paragangliom, rak paranazalnih sinusa, rak nosne šupljine, paratireoidni rak, rak penisa, faringealni rak, feokromocitom, šišarkasti parenhimski tumori srednje diferencijacije, pineoblastom, tumor hipofize, neoplazam plazma stanica, pleuropulmonalni blastom, primarni limfom središnjeg živčanog sustava, rak rektuma, rak bubrežnih stanica, rak bubrežne zdjelice, rak mokraćovoda, prijelazni stanični rak, retinoblastom, rabdomiosarkom, rak žlijezde slinovnice, sarkom, sezari sindrom, rak kože, rak pluća malih stanica, rak tankog crijeva, sarkom mekih tkiva, karcinom skvamoznih stanica, skvamozni rak vrata s okultnim primarnim sijelom, rak želuca, supratentorijalni primitivni neuroektodermalni tumori, rak testisa, rak grla, timom, timusni karcinom, rak štitnjače, prijelazni rak bubrežne zdjelice i mokraćovoda, gestacijski trofoblastni tumor, nepoznato primarno sijelo, neobični rak u djetinjstvu, rak uretre, rak maternice, sarkom maternice, waldenstrom makroglobulinemija ili wilms tumor.