



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20171560 T1

HR P20171560 T1

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

(51) MKP:

A61K 45/06 (2006.01)	C07D 405/12 (2006.01)
A61K 9/06 (2006.01)	C07D 233/64 (2006.01)
A61K 9/08 (2006.01)	C07D 403/06 (2006.01)
A61K 9/10 (2006.01)	C07D 413/06 (2006.01)
A61K 47/38 (2006.01)	A61K 9/00 (2006.01)
A61K 31/4172 (2006.01)	A61K 9/20 (2006.01)
A61K 31/4439 (2006.01)	A61K 9/48 (2006.01)
C07D 233/90 (2006.01)	A61K 31/417 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01)	A61K 31/4178 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 01.12.2017.

(21) Broj predmeta: P20171560T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 16.10.2017.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/JP2011055953
Datum podnošenja međunarodne prijave: 14.03.2011.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 11756249.6
Datum podnošenja europske prijave patenta: 14.03.2011.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2011115064
Datum međunarodne objave: 22.09.2011.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2548871 A1
Datum objave europske prijave patenta: 23.01.2013.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2548871 B1
Datum objave europskog patenta: 19.07.2017.

(31) Broj prve prijave: 2010062155 (32) Datum podnošenja prve prijave: 18.03.2010. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: JP

(73) Nositelj patenta:

Daiichi Sankyo Company, Limited, 3-5-1, Nihonbashi Honcho, Chuo-ku, 103-8426 Tokyo, JP

(72) Izumitelji:

Tsutomu Nagata, c/o Daiichi Sankyo Company, Limited 1-2-58, Hiromachi, Sinagawa-ku, 140-8710 Tokyo, JP
Masahiro Inoue, c/o Daiichi Sankyo Company, Limited 1-2-58, Hiromachi, Sinagawa-ku, 140-8710 Tokyo, JP
Yuka Ashida, c/o Daiichi Sankyo Company, Limited 1-2-58, Hiromachi, Sinagawa-ku, 140-8710 Tokyo, JP
Kengo Noguchi, c/o Daiichi Sankyo Company, Limited 1-2-58, Hiromachi, Sinagawa-ku, 140-8710 Tokyo, JP
Makoto Ono, c/o Daiichi Sankyo Company, Limited 1-16-13, Kitakasai, Edogawa-ku, 134-0081 Tokyo, JP

(74) Zastupnik:

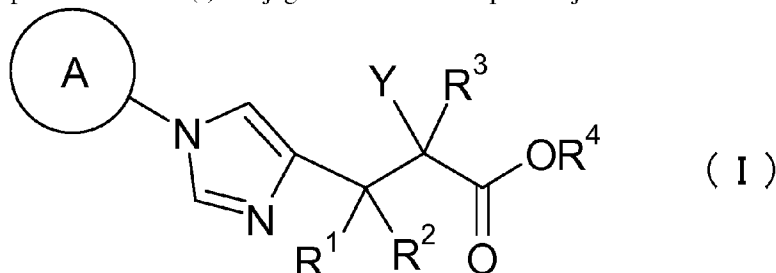
Odvjetnica Gorana Grubišić, dipl.iur., 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma: **CIKLOALKIL-SUPSTITUIRANI IMIDAZOLNI DERIVAT**

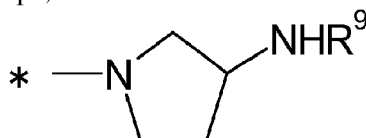
HR P20171560 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Spoj predstavljen općom formulom (I) ili njegova farmakološki prihvatljiva sol:

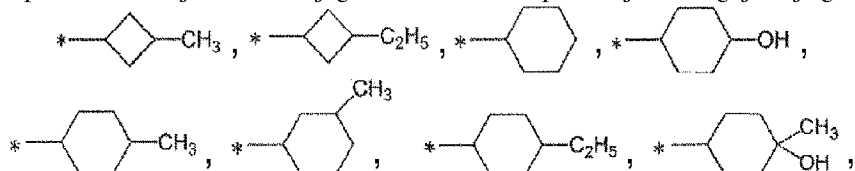


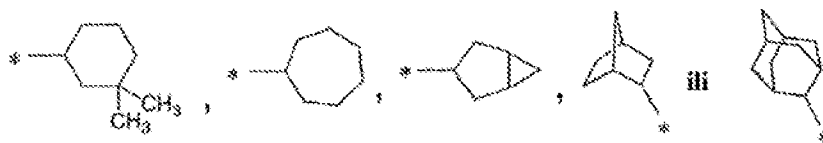
gdje A predstavlja C3 do C12 cikloalkil grupu koja može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od fluoro grupe, hidroksilne grupe, C1 do C6 alkil grupe, C1 do C6 alkoksi grupe, ariloksi grupe, i heterocikliloksi grupe; R^1 , R^2 , i R^3 svaki nezavisno predstavlja atom vodika, fluoro grupu, ili C1 do C6 alkil grupu; R^4 predstavlja atom vodika ili prolijek grupu; i Y predstavlja grupu: $-\text{CH}_2-\text{CHR}^5-\text{CH}_2-\text{NHR}^6$ u kojoj R^5 predstavlja atom vodika, C1 do C6 alkil grupu, ili C1 do C6 alkoksi grupu, i R^6 predstavlja atom vodika ili prolijek grupu; $-\text{O}-\text{CHR}^7-\text{CH}_2-\text{NHR}^8$ u kojoj R^7 predstavlja atom vodika, C1 do C6 alkil grupu, ili C1 do C6 alkoksi grupu, i R^8 predstavlja atom vodika ili prolijek grupu; ili



gdje R^9 predstavlja atom vodika ili prolijek grupu, i * predstavlja poziciju za supstituciju, gdje prolijek grupa predstavljena sa R^4 je [(izopropoksikarbonil)oksi]etil grupa; C1 do C6 alkil grupa koja može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od C2 do C6 alkanoloksi grupe, (C3 do C6 cikloalkil)karboniloksi grupe, i aril grupe; ili heterociklilalkil grupa koja može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od okso grupe i C1 do C6 alkil grupe; i gdje je prolijek grupa predstavljena sa R^6 , R^8 , ili R^9 je C1 do C6 alkanol grupa koja može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od amino grupe, halogeno grupe, hidroksilne grupe, karboksilne grupe, karbamoil grupe, C1 do C6 alkoksi grupe, aril grupe, i heterociklil grupe; (C1 do C6 alkoksi)karbonil grupa koja može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od C1 do C6 alkil grupe, C2 do C6 alkanoloksi grupe, (C3 do C6 cikloalkil)karboniloksi grupe, i aril grupe; ili heterociklilalkiloksikarbonil grupa koja može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od okso grupe i C1 do C6 alkil grupe.

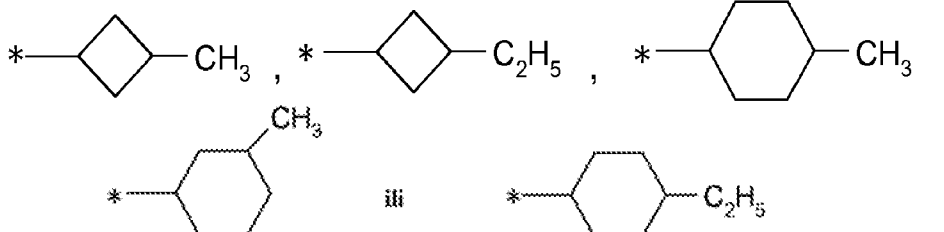
2. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 1 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje A je ciklobutil grupa, cikloheksil grupa, cikloheptil grupa, biciklo[3.1.0]heksil grupa, biciklo[2.2.1]heptil grupa, ili adamantil grupa, od kojih svaka može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od fluoro grupe, hidroksilne grupe, C1 do C6 alkil grupe, C1 do C6 alkoksi grupe, ariloksi grupe, i heterocikliloksi grupe.
3. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 2 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje A je ciklobutil grupa, cikloheksil grupa, cikloheptil grupa, biciklo[3.1.0]heksil grupa, biciklo[2.2.1]heptil grupa, ili adamantil grupa, od kojih svaka može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od hidroksilne grupe, metil grupe, i etil grupe.
4. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 2 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje A je cikloheksil grupa koja može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od fluoro grupe, hidroksilne grupe, C1 do C6 alkil grupe, C1 do C6 alkoksi grupe, ariloksi grupe, i heterocikliloksi grupe.
5. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 1 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje A je C3 do C12 cikloalkil grupa supstituirana jednom ili dvjema identičnim ili različitim C1 do C6 alkil grupama.
6. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 5 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje A je C3 do C12 cikloalkil grupa supstituirana metil grupom ili etil grupom.
7. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 5 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje A je cikloheksil grupa supstituirana jednom ili dvjema identičnim ili različitim C1 do C6 alkil grupama.
8. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 6 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje A je cikloheksil grupa supstituirana metil grupom ili etil grupom.
9. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 1 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje A je grupa:





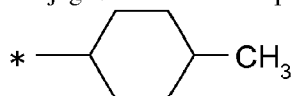
gdje * predstavlja poziciju za supstituciju.

10. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 9 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje A je grupa:



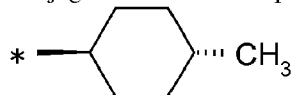
gdje * predstavlja poziciju za supstituciju.

11. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 10 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje A je grupa:



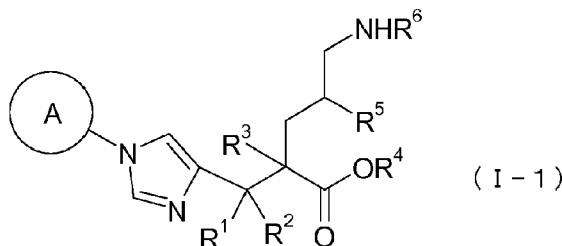
gdje * predstavlja poziciju za supstituciju.

12. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 11 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje A je grupa:



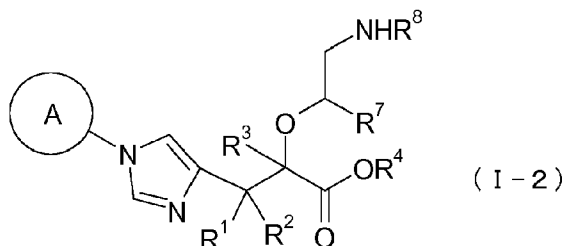
gdje * predstavlja poziciju za supstituciju.

13. Spoj u skladu sa bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 12 predstavljen općom formulom (I-1) ili njegova farmakološki prihvatljiva sol:



gdje R⁵ predstavlja atom vodika, C1 do C6 alkil grupu, ili C1 do C6 alkoksi grupu, i R⁶ predstavlja atom vodika ili grupu prolijeka kao što je definirano u Patentnom zahtjevu 1.

14. Spoj u skladu sa bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 12 predstavljen općom formulom (I-2) ili njegova farmakološki prihvatljiva sol:



gdje R⁷ predstavlja atom vodika, C1 do C6 alkil grupu, ili C1 do C6 alkoksi grupu, i R⁸ predstavlja atom vodika ili grupu prolijeka kao što je definirano u Patentnom zahtjevu 1.

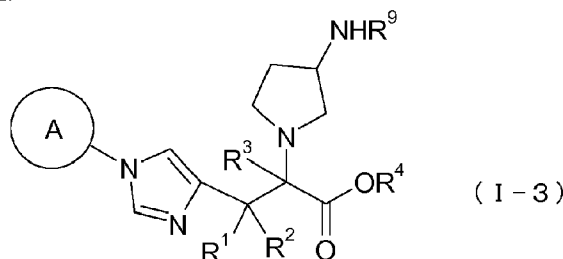
15. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 13 ili 14 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje R⁵ ili R⁷ predstavlja atom vodika.

16. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 13, 14 ili 15 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje R⁶ ili R⁸ predstavlja atom vodika.

17. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 13, 14 ili 15 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje R⁶ ili R⁸ predstavlja prolijek grupu kao što je definirano u Patentnom zahtjevu 1.

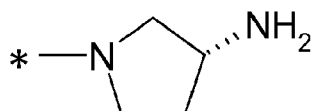
18. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 17 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje R⁶ je prolijek grupa odabrana iz grupe koja se sastoji od fenilalanil grupe, L-norleucil grupe, [(5-metil-2-okso-1,3-dioksol-4-il)metoksi]karbonil grupe, [1-(izobutiriloksi)etoksi]karbonil grupe, [1-(2,2-dimetilpropanoiloksi)etoksi]karbonil grupe, ({1-[(cikloheksilkarbonil)oksi]etoksi}karbonil grupe, i (1-acetoksietoksi)karbonil grupe.

19. Spoj u skladu sa bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 12 predstavljen općom formulom (I-3) ili njegova farmakološki prihvatljiva sol:



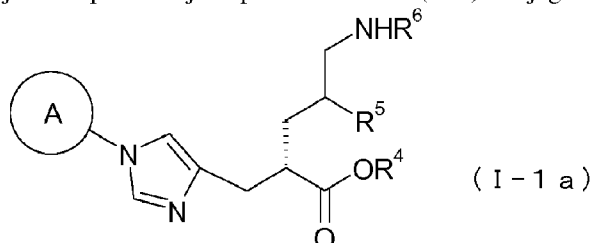
gdje R⁹ predstavlja atom vodika ili grupu proliječka kao što je definirano u Patentnom zahtjevu 1, i * predstavlja poziciju za supstituciju.

20. Spoj u skladu sa bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 12 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje Y je grupa:



gdje * predstavlja poziciju za supstituciju.

21. Spoj u skladu sa bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 20 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje su R¹, R², i R³ svi atomi vodika.
22. Spoj u skladu sa bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 21 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje je R⁴ atom vodika.
23. Spoj u skladu sa bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 21 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje je R⁴ proliječ grupa kao što je definirano u Patentnom zahtjevu 1.
24. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 23 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje je proliječ grupa predstavljena sa R⁴ benzil grupa ili [(izopropoksikarbonil)oksi]etil grupa.
25. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 13 ili 14 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje A je ciklobutil grupa, cikloheksil grupa, cikloheptil grupa, biciklo[3.1.0]heksil grupa, biciklo[2.2.1]heptil grupa, ili adamantil grupa, od kojih svaka može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od hidroksilne grupe, metil grupe, i etil grupe; R¹, R², i R³ su svi atomi vodika; R⁴ je atom vodika; C1 do C6 alkil grupa koja može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od C2 do C6 alkanoiloksi grupe, (C3 do C6 cikloalkil)karboniloksi grupe, i aril grupe; ili heterociklilalkil grupa koja može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od okso grupe i C1 do C6 alkil grupe; R⁵ ili R⁷ je atom vodika; i R⁶ ili R⁸ je atom vodika; C1 do C6 alkanoil grupa koja može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od amino grupe, halogeno grupe, hidroksilne grupe, karboksilne grupe, karbamoil grupe, C1 do C6 alkoksi grupe, aril grupe, i heterociklil grupe; (C1 do C6 alkoksi)karbonil grupa koja može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od C1 do C6 alkil grupe, C2 do C6 alkanoiloksi grupe, (C3 do C6 cikloalkil)karboniloksi grupe, i aril grupe; ili heterociklilalkiloksikarbonil grupa koja može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od okso grupe i C1 do C6 alkil grupe.
26. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 13 ili 14 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje A je cikloheksil grupa supstituirana jednom ili dvjema identičnim ili različitim C1 do C6 alkil grupama; R¹, R², i R³ su svi atomi vodika; R⁴ je atom vodika, benzil grupa, ili [(izopropoksikarbonil)oksi]etil grupa; R⁵ ili R⁷ je atom vodika; i R⁶ ili R⁸ je atom vodika, ili R⁶ je fenilalanil grupa, L-norleucil grupa, [(5-metil-2-okso-1,3-dioksol-4-il)metoksi]karbonil grupa, [1-(izobutiriloksi)etoksi]karbonil grupa, [1-(2,2-dimetilpropanoiloksi)etoksi]karbonil grupa, ({1-[(cikloheksilkarbonil)oksi]etoksi}karbonil) grupa, ili (1-acetoksietoksi)karbonil grupa.
27. Spoj prema patentnom zahtjevu 13 predstavljen općom formulom (I-1a) ili njegova farmakološki prihvatljiva sol:



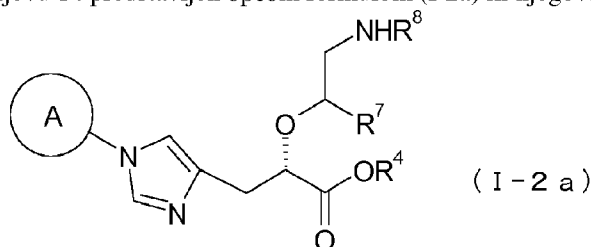
gdje A predstavlja ciklobutil grupu, cikloheksil grupu, cikloheptil grupu, biciklo[3.1.0]heksil grupu, biciklo[2.2.1]heptil grupu, ili adamantil grupu, od kojih svaka može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od hidroksilne grupe, metil grupe, i etil grupe; R⁴ predstavlja atom vodika; [(izopropoksikarbonil)oksi]etil grupa; C1 do C6 alkil grupa koja može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od C2 do C6 alkanoiloksi grupe, (C3 do C6 cikloalkil)karboniloksi grupe, i aril grupe; ili heterociklilalkil grupa koja može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od okso grupe i C1 do C6 alkil grupe; R⁵ predstavlja atom vodika, C1 do C6 alkil grupu, ili C1 do C6 alkoksi grupu; i R⁶

predstavlja atom vodika; C1 do C6 alkanoil grupa koja može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od amino grupe, halogen grupe, hidroksilne grupe, karboksilne grupe, karbamoil grupe, C1 do C6 alkoksi grupe, aril grupe, i heterociklil grupe; (C1 do C6 alkoksi)karbonil grupa koja može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od C1 do C6 alkil grupe, C2 do C6 alkanoiloksi grupe, (C3 do C6 cikloalkil)karboniloksi grupe, i aril grupe; ili heterociklilalkiloksikarbonil grupa koja može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od okso grupe i C1 do C6 alkil grupe.

28. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 27 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje je A cikloheksil grupa supstituirana jednom ili dvjema identičnim ili različitim C1 do C6 alkil grupama; R^1 , R^2 , i R^3 su svi atom vodika; R^4 je atom vodika, benzil grupa, ili [(izopropoksikarbonil)oksi]etil grupa; R^5 je atom vodika; i R^6 je atom vodika, fenilalanil grupa, L-norleucil grupa, [(5-metil-2-okso-1,3-dioksol-4-il)metoksi]karbonil grupa, [1-(izobutiriloksi)etoksi]karbonil grupa, [1-(2,2-dimetilpropanoiloksi)etoksi]karbonil grupa, ({1-[(cikloheksilkarbonil)oksi]etoksi}karbonil) grupa, ili (1-acetoksietoksi)karbonil grupa.

29. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 28 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje A je cikloheksil grupa supstituirana metil grupom ili etil grupom; i svaki od R^4 , R^5 , i R^6 je atom vodika.

30. Spoj prema patentnom zahtjevu 14 predstavljen općom formulom (I-2a) ili njegova farmakološki prihvatljiva sol:



gdje A predstavlja ciklobutil grupu, cikloheksil grupu, cikloheptil grupu, biciklo[3.1.0]heksil grupu, biciklo[2.2.1]heptil grupu, ili adamantil grupu, od kojih svaka može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od hidroksilne grupe, metil grupe, i etil grupe; R^4 predstavlja [(izopropoksikarbonil)oksi]etil grupu; atom vodika; C1 do C6 alkil grupa koja može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od C2 do C6 alkanoiloksi grupe, (C3 do C6 cikloalkil)karboniloksi grupe, i aril grupe; ili heterociklilalkil grupa koja može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od okso grupe i C1 do C6 alkil grupe; R^7 predstavlja atom vodika, C1 do C6 alkil grupu, ili C1 do C6 alkoksi grupu; i R^8 predstavlja atom vodika ili grupu proljeka kao što je definirano u Patentnom zahtjevu 1.

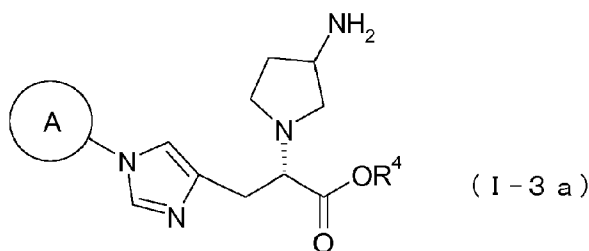
31. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 30 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje je A cikloheksil grupa supstituirana jednom ili dvjema identičnim ili različitim C1 do C6 alkil grupama; R^1 , R^2 , i R^3 su svi atomi vodika; R^4 je atom vodika, benzil grupa, ili [(izopropoksikarbonil)oksi]etil grupa; R^7 je atom vodika; i R^8 je atom vodika, C1 do C6 alkanoil grupa koja može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od amino grupe, halogen grupe, hidroksilne grupe, karboksilne grupe, karbamoil grupe, C1 do C6 alkoksi grupe, aril grupe, i heterociklil grupe, (C1 do C6 alkoksi)karbonil grupa koja može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od C1 do C6 alkil grupe, C2 do C6 alkanoiloksi grupe, (C3 do C6 cikloalkil) karboniloksi grupe, i aril grupe, ili heterociklilalkiloksikarbonil grupa koja može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od okso grupe i C1 do C6 alkil grupe.

32. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 31 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje A je cikloheksil grupa supstituirana metil grupom ili etil grupom; i R^4 , R^7 , i R^8 su svi atom vodika.

33. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 19 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje je A ciklobutil grupa, cikloheksil grupa, cikloheptil grupa, biciklo[3.1.0]heksil grupa, biciklo[2.2.1]heptil grupa, ili adamantil grupa, od kojih svaka može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od hidroksilne grupe, metil grupe, i etil grupe; R^1 , R^2 , i R^3 su svi atomi vodika; R^4 je atom vodika; C1 do C6 alkil grupa koja može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od C2 do C6 alkanoiloksi grupe, (C3 do C6 cikloalkil)karboniloksi grupe, i aril grupe; ili heterociklilalkil grupa koja može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od okso grupe i C1 do C6 alkil grupe; i R^9 je atom vodika; C1 do C6 alkanoil grupa koja može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od amino grupe, halogeno grupe, hidroksilne grupe, karboksilne grupe, karbamoil grupe, C1 do C6 alkoksi grupe, aril grupe, i heterociklil grupe; (C1 do C6 alkoksi)karbonil grupa koja može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od C1 do C6 alkil grupe, C2 do C6 alkanoiloksi grupe, (C3 do C6 cikloalkil)karboniloksi grupe, i aril grupe; ili heterociklilalkiloksikarbonil grupa koja može biti supstituirana jednom do tri identične ili različite grupe odabrane od okso grupe i C1 do C6 alkil grupe.

34. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 19 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje A je cikloheksil grupa supstituirana jednom ili dvjema identičnim ili različitim C1 do C6 alkil grupama; R^1 , R^2 , i R^3 su svi atomi vodika; R^4 je atom vodika, benzil grupa, ili [(izopropoksikarbonil)oksi]etil grupa; i R^9 je atom vodika.

35. Spoj prema patentnom zahtjevu 33 ili 34 predstavljen općom formulom (I-3a) ili njegova farmakološki prihvatljiva sol:



36. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 35 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje A je cikloheksil grupa supstituirana metil grupom ili etil grupom; i R⁴ je atom vodika.

37. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 1 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje je spoj odabrano iz grupe koja se sastoji od

5-amino-2-[(1-cikloheksil-1H-imidazol-4-il)metil]valerične kiseline,
 5-amino-2-{[1-(4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil}valerične kiseline,
 5-amino-2-{[1-(4-etilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil}valerične kiseline,
 5-amino-2-{[1-(3-etilciklobutil)-1H-imidazol-4-il]metil}valerične kiseline,
 5-amino-2-{[1-(3-metilciklobutil)-1H-imidazol-4-il]metil}valerične kiseline,
 5-amino-2-([1-(1R,3S,5S)-biciklo[3.1.0]heksan-3-il]-1H-imidazol-4-il)metil]valerične kiseline,
 5-amino-2-{[1-(4-hidroksi cikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil}valerične kiseline,
 5-amino-2-{[1-(4-hidroksi -4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil}valerične kiseline,
 5-amino-2-{[1-(3-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil}valerične kiseline,
 5-amino-2-[(1-cikloheptil-1H-imidazol-4-il)metil]valerične kiseline,
 5-amino-2-([1-[exo-biciklo[2.2.1]hept-2-il]-1H-imidazol-4-il]metil]valerične kiseline,
 5-amino-2-([1-[endo-biciklo[2.2.1]hept-2-il]-1H-imidazol-4-il]metil]valerične kiseline,
 2-[(1-adamantan-2-il-1H-imidazol-4-il)metil]-5-aminovaleijanske kiseline,
 5-amino-2-{[1-(4-fenoksicikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil}valerične kiseline,
 Benzil 5-amino-2-{[1-(4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil}valerata,
 2-{[1-(4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil}-5-(L-fenilalanilamino)valerične kiseline,
 2-{[1-(4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil}-5-(L-norleucilamino)valerične kiseline,
 2-{[1-(4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil}-5-([5-metil-2-okso-1,3-dioksol-4-il]metoksi)karbonil]amino)valerične kiseline,
 5-([1-(izobutiriloksi)etoksi]karbonil]amino)-2-{[1-(4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil}valerične kiseline,
 1-[(izopropoksikarbonil)oksi]etil 5-([1-(izobutiriloksi)etoksi]karbonil]amino)-2-{[1-(4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil}valerata,
 5-([1-(2,2-dimetilpropanoiloksi)etoksi]karbonil]amino)-2-{[1-(4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil}valerične kiseline,
 5-([1-[(cikloheksilkarbonil)oksi]etoksi]karbonil]amino)-2-{[1-(4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil}valerične kiseline,
 2-(2-aminoetoksi)-3-[1-(4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]propionske kiseline,
 2-[(1R)-2-amino-1-metiletoksi]-3-[1-(4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]propionske kiseline, i
 2-[(3S)-3-aminopirolidin-1-il]-3-[1-(4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]propionske kiseline.

38. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 1 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje je spoj odabrano iz grupe koja se sastoji od:

(2S)-2-{[1-(trans-4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil}-5-([5-metil-2-okso-1,3-dioksol-4-il]metoksi)karbonil]amino)valerične kiseline,
 (2S)-5-([1-(izobutiriloksi)etoksi]karbonil]amino)-2-{[1-(trans-4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil}valerične kiseline,
 1-[(izopropoksikarbonil)oksi]etil(2S)-5-([1-(izobutiriloksi)etoksi]karbonil]amino)-2-{[1-(trans-4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil}valerata,
 (2S)-5-([1-(2,2-dimetilpropanoiloksi)etoksi]karbonil]amino)-2-{[1-(trans-4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil}valerične kiseline,
 (2S)-5-([1-[(cikloheksilkarbonil)oksi]etoksi]karbonil]amino)-2-{[1-(trans-4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil}valerične kiseline,
 (2S)-5-([1-(Acetoksietoksi)karbonil]amino)-2-{[1-(trans-4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil}valerične kiseline,
 (2S)-2-{[1-(trans-4-Metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil}-5-([2-metilpropanoil]oksi)metoksi]karbonil]amino)valerične kiseline,
 (2S)-5-([1-[(2,2-Dimetilpropanoil)oksi]metiloksi]karbonil]amino)-2-{[1-(trans-4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil}valerične kiseline,

(2S)-5-([[(Cikloheksilkarbonil)oksi]metoksi]karbonil)amino]-2-[[1-(trans-4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil]valerične kiseline,

(2S)-5-([[(Acetiloksi)metoksi]karbonil]amino)-2-[[1-(trans-4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil]valerične kiseline,

i

(2S)-5-([[(1R)-1-(Izobutiriloksi)etoksi]karbonil]amino)-2-[[1-(trans-4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil]valerične kiseline.

39. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 1 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol, gdje je spoj (2S)-5-([[(1R)-1-(Izobutiriloksi)etoksi]karbonil]amino)-2-[[1-(trans-4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil]valerična kiselina.

40. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 1, gdje je spoj 5-amino-2-[[1-(4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil]valerična kiselina ili njena farmakološki prihvatljiva sol.

41. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 1, gdje je spoj 5-amino-2-[[1-(trans-4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil]valerična kiselina ili njegova farmakološki prihvatljiva sol.

42. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 1, gdje je spoj (2S)-5-amino-2-[[1-(trans-4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil]valerična kiselina ili njegova farmakološki prihvatljiva sol.

43. Farmakološki prihvatljiva sol spoja u skladu sa bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 42, gdje je farmakološki prihvatljiva sol p-toluensulfonat ili benzensulfonat.

44. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 1, gdje spoj je (2S)-5-amino-2-[[1-(trans-4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil]valerična kiselina.

45. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 1, gdje spoj je benzensulfonat (2S)-5-amino-2-[[1-(trans-4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil]valerične kiseline.

46. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 1, gdje spoj je p-toluensulfonat (2S)-5-amino-2-[[1-(trans-4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil]valerične kiseline.

47. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 1, gdje spoj je anhidrat p-toluensulfonata (2S)-5-amino-2-[[1-(trans-4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil]valerične kiseline.

48. Anhidrat p-toluensulfonata (2S)-5-amino-2-[[1-(trans-4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil]valerične kiseline prema patentnom zahtjevu 47, koji je u kristalnom obliku koji pokazuje glavne vrhove na interplanarnim rastojanjima d od 23.9, 11.9, 4.5, 4.3, i 3.6 angstroma pri difrakciji X-zraka u prahu dobivenoj Ka zračenjem bakra.

49. Spoj u skladu sa patentnim zahtjevom 1, gdje je spoj p-toluensulfonat monohidrat (2S)-5-amino-2-[[1-(trans-4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil]valerične kiseline.

50. Monohidrat p-toluensulfonata (2S)-5-amino-2-[[1-(trans-4-metilcikloheksil)-1H-imidazol-4-il]metil]valerične kiseline prema patentnom zahtjevu 49, koji je u kristalnom obliku koji pokazuje glavne vrhove na interplanarnim rastojanjima d od 22.9, 5.0, 4.9, 4.7, i 4.0 angstroma pri difrakciji X-zraka u prahu dobivenoj Ka zračenjem bakra.

51. Spoj u skladu sa bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 50 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol za primjenu kao farmaceutski lijek.

52. Spoj u skladu sa bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 50 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol za primjenu u liječenju ili prevenciji tromboze ili embolije ili njihovih posljedica uključujući: akutni koronarni sindrom kao što su infarkt miokarda i angina pectoris (stabilna angina i nestabilna angina); vensku tromboemboliju kao što su duboka venska tromboza i plućna embolija; trombozu ili emboliju koje se dešavaju u kardiovaskularnom sistemu nakon kirurških operacija kao što su revaskularizacija krvnih žila, angioplastika, ugradnja stenta, i operacija prenosnice; trombozu ili emboliju nakon operacija zamjene umjetnog zgloba kao što su operacija zamjene zgloba koljena i operacija zamjene zgloba kuka; intravaskularno oboljenje povezano sa inflamacijom kao što su sepsa i sindrom diseminirane intravaskularne koagulacije (DIC); oboljenje izvedeno iz ili povezano sa perifernim vaskularnim poremećajem kao što je periferna arterijska okluzija (PAO), arterioskleroza, i dijabetes melitus; oboljenje povezano sa tumorom kao što su solidni rak i rak krvi; i poremećaja organa povezanog sa trombom ili embolijom kao što su plućna embolija, cerebralni infarkt, i bubrežni infarkt.

53. Spoj u skladu sa bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 50 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol za primjenu u liječenju ili prevenciji tromboze ili embolije uključujući: oboljenje prouzrokovano kontaktom sa stranom supstancom u tijelu, gdje strana supstanca uključuje medicinsko sredstvo kao što je zglobna proteza koja se koristi pri zamjeni zgloba, vaskularni kateter, krvna proteza, krvni stent, i prostetski zalistak; i oboljenje prouzrokovano kontaktom između krvi i medicinskog sredstva van tijela, gdje medicinsko sredstvo uključuje zračnu pumpu koja se koristi pri srčanim operacijama i medicinsko sredstvo koje se koristi pri hemodijalizi.

54. Spoj u skladu sa bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 50 ili njegova farmakološki prihvatljivu sol za primjenu u liječenju ili prevenciji oboljenja povezanih sa trombozom ili embolijom ili praćena nagomilavanjem fibrina ili fibrozom koja uključuju: plućna oboljenja kao što su plućna hipertenzija, sindrom adultnog respiratornog distresa, plućna fibroza, i kronična tromboembolična plućna hipertenzija; bubrežno oboljenje kao što su glomerulonefritis (uključujući akutni glomerulonefritis, kronični glomerulonefritis, nefrotski nefritis, i brzo progresivni glomerulonefritis), bubrežni infarkt, i dijabetički nefritis; oboljenje jetre kao što je hepatična fibroza, hepatitis, i ciroza jetre; očno oboljenje povezano sa nagomilavanjem fibrina u oku; disfunkcija organa nakon transplantacije organa ili resekcije; mikrocirkulatorni poremećaj prouzrokovan mikrotrombom, uključujući trombotsku mikroangiopatiju; i oboljenje ili simptome povezane sa migracijom stanica raka ili metastazom.

55. Spoj u skladu sa bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 50 za primjenu u liječenju infarkta miokarda, angine pektoris, akutnog koronarnog sindroma, cerebralnog infarkta, duboke venske tromboze, plućne embolije, periferne arterijske okluzije, sepse, sindroma diseminirane intravaskularne koagulacije, ili plućne fibroze.
56. Farmaceutska kompozicija koja sadrži spoj u skladu sa bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 50 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol i farmakološki prihvatljivi nosač.
57. Primjena spoja u skladu sa bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 50 ili njegova farmakološki prihvatljiva sol u proizvodnji medikamenta za liječenje infarkta miokarda, angine pektoris, akutnog koronarnog sindroma, cerebralnog infarkta, duboke venske tromboze, plućne embolije, periferne arterijske okluzije, sepse, sindroma diseminirane intravaskularne koagulacije, ili plućne fibroze.
58. Spoj ili njegova farmakološki prihvatljiva sol za primjenu prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 51 do 55, gdje je spoj ili njegovu farmakološki prihvatljivu sol formulirano za injekciju.
59. Farmaceutska kompozicija za injekciju koja sadrži spoj u skladu sa bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 50 ili njegovu farmakološki prihvatljivu sol i farmakološki prihvatljivi nosač.
60. Primjena farmaceutske kompozicije za injekciju koja sadrži spoj u skladu sa bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 50 ili njegovu farmakološki prihvatljivu sol kao aktivni sastojak u proizvodnji medikamenta za liječenje infarkta miokarda, angine pektoris, akutnog koronarnog sindroma, cerebralnog infarkta, duboke venske tromboze, plućne embolije, periferne arterijske okluzije, sepse, sindroma diseminirane intravaskularne koagulacije, ili plućne fibroze.
61. Farmaceutska kompozicija koja sadrži spoj u skladu sa bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 50 ili njegovu farmakološki prihvatljivu sol i jedan ili dva ili više lijekova odabranih od antikoagulansa, antitrombocitnog lijeka, enzima povezanog sa fibrinolizom, antitumorskog lijeka, anti-inflamatornog lijeka, antifibrotskog lijeka, hipotenzivnog lijeka, anti-plućno hipertenzivnog lijeka, i imunosupresivnog lijeka kao aktivne sastojke.