



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20161308 T1

HR P20161308 T1

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

(51) MKP:

C07D 239/26 (2006.01)
C07D 401/06 (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01)
C07D 405/14 (2006.01)
C07D 409/14 (2006.01)
C07D 413/14 (2006.01)
C07D 471/04 (2006.01)
C07D 487/08 (2006.01)
A61K 31/505 (2006.01)
A61K 31/506 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 02.12.2016.

(21) Broj predmeta: P20161308T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 10.10.2016.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2011051061
Datum podnošenja međunarodne prijave: 26.01.2011.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 11701130.4
Datum podnošenja europske prijave patenta: 26.01.2011.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2011092198
Datum međunarodne objave: 04.08.2011.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2528903 A1
Datum objave europske prijave patenta: 05.12.2012.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2528903 B1
Datum objave europskog patenta: 20.07.2016.

(31) Broj prve prijave: 10151723

(32) Datum podnošenja prve prijave: 26.01.2010.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: EP

(73) Nositelj patenta:

**Boehringer Ingelheim International GmbH, Binger Strasse 173, 55216
Ingelheim am Rhein, DE**

(72) Izumitelji:

**Siegfried Schneider, Boehringer Ingelheim GmbH, Corporate Patents,
Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, DE
Dirk Kessler, Boehringer Ingelheim GmbH, Corporate Patents, Binger
Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, DE
Lars Anders Van Der Veen, Boehringer Ingelheim GmbH, Corporate
Patents, Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, DE
Tobias Wunberg, Boehringer Ingelheim GmbH, Corporate Patents,
Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, DE
CPZ - CENTAR ZA PATENTE d.o.o., 10000 Zagreb, HR**

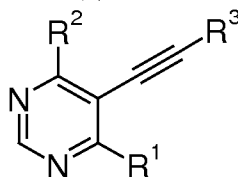
(74) Zastupnik:

(54) Naziv izuma: **5-ALKINIL-PIRIMIDINI**

HR P20161308 T1

PATENTNI ZAHTEVI

- 5 1. Spojevi, **naznačeni time**, da imaju opću formulu (1),



(1),

u kojoj

R³ označava piridil, opsijski supstituiran s jednim ili više istih ili različitih sljedećih: metil, etil, amino, metilamino, etilamino; i **R¹** označava fenil ili piridil, opsijski supstituiran s jednim ili više istih ili različitih **R⁵**; i **R²** označava C₁₋₄alkil, i svaki **R⁵** označava skupinu odabranu između **R^m** i **Rⁿ**; i svaki **R^m** međusobno neovisno označava vodik ili skupinu odabranu od sljedećih: C₁₋₆alkil, 2-6-člani heteroalkil, C₁₋₆haloalkil, C₃₋₁₀cikloalkil, C₄₋₁₆cikloalkilalkil, C₆₋₁₀aril, C₇₋₁₆arilalkil, 5-12-člani heteroaril, 6-18-člani heteroarilalkil, 3-14-člani heterocikloalkil i 4-14-člani heterocikloalkilalkil; i

R^m je opsijski supstituiran s jednim ili više istih ili različitih od **Rⁿ** i/ili **R^{o4}**; svaki **Rⁿ** označava prikladnu skupinu i odabran je međusobno neovisno između sljedećih: =O, -OR^o, C₁₋₃haloalkiloksi, -OCF₃, -OCHF₂, =S, -SR^o, =NR^o, =NOR^o, =NNR^oR^{o1}, =NN(R^s)C(O)NR^oR^{o1}, -NR^oR^{o1}, -ONR^oR^{o1}, -N(OR^o)R^{o1}, -N(R^s)NR^oR^{o1}, halogen, -CF₃, -CN, -NC, -OCN, -SCN, -NO, -NO₂, =N₂, -N₃, -S(O)R^o, -S(O)OR^o, -S(O)₂R^o, -S(O)₂OR^o, -S(O)NR^oR^{o1}, -S(O)₂NR^oR^{o1}, -OS(O)R^o, -OS(O)₂R^o, -OS(O)₂O

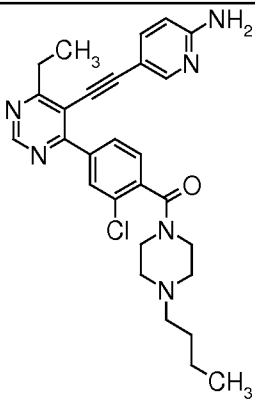
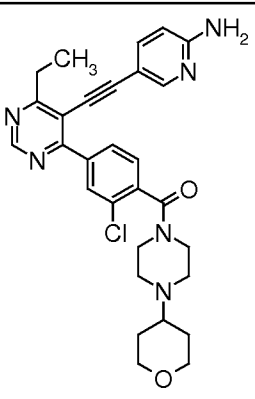
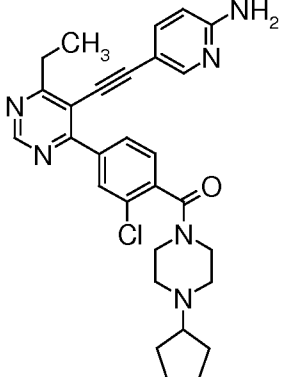
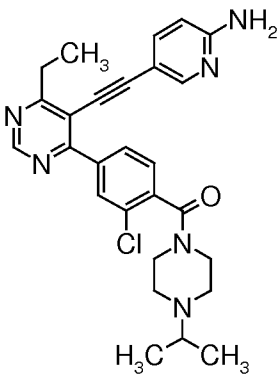
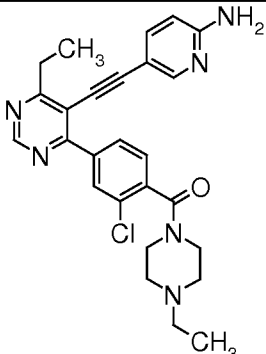
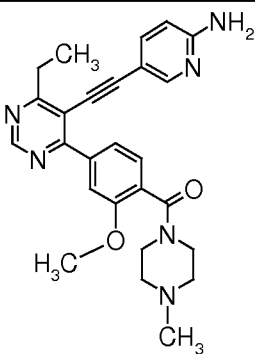
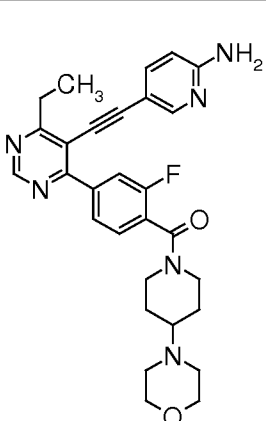
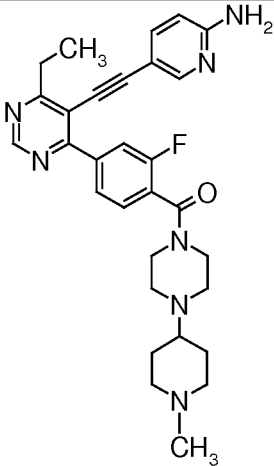
R^o, -OS(O)NR^oR^{o1}, -OS(O)₂NR^oR^{o1}, -C(O)R^o, -C(O)OR^o, -C(O)SR^o, -C(O)NR^oR^{o1}, -C(O)N(R^s)NR^oR^{o1}, -C(O)N(R^s)OR^o, -C(NR^s)NR^oR^{o1}, -C(NOH)R^o, -C(NOH)NR^oR^{o1}, -OC(O)R^o, -OC(O)OR^o, -OC(O)SR^o, -OC(O)NR^oR^{o1}, -OC(NR^s)NR^oR^{o1}, -SC(O)R^o, -SC(O)OR^o, -SC(O)NR^oR^{o1}, -SC(NR^s)NR^oR^{o1}, -N(R^s)C(O)R^o, -N[C(O)R^o][C(O)R^{o1}], -N(OR^s)C(O)R^o, -N(R^s)C(NR^{s1})R^o, -N(R^s)N(R^{s1})C(O)R^o, -N[C(O)R^{o2}][NR^oR^{o1}], -N(R^s)C(S)R^o, -N(R^s)S(O)R^o, -N(R^s)S(O)OR^o, -N(R^s)S(O)₂R^o, -N[S(O)₂R^o][S(O)₂R^{o1}], -N(R^s)S(O)₂OR^o, -N(R^s)S(O)₂NR^oR^{o1}, -N(R^s)S(O)₂NR^{o2}R^{o3}, -N(R^s)S(O)₂NR^{o1}, -N(R^s)C(O)OR^o, -N(R^s)C(O)SR^o, -N(R^s)C(O)NR^oR^{o1}, -N(R^s)C(O)NR^{s1}NR^oR^{o1}, -N(R^s)N(R^{s1})C(O)NR^oR^{o1}, -N(R^s)C(S)NR^oR^{o1}, -N[R^s)C(O)]₂R^o, -N[R^s)C(O)]₂R^{o1}, -N{[C(O)]₂R^o}{[C(O)]₂R^{o1}}, -N(R^s)C(O)]₂OR^o, -N(R^s)C(O)]₂NR^oR^{o1}, -N{[C(O)]₂OR^o}{[C(O)]₂OR^{o1}}, -N{[C(O)]₂NR^oR^{o1}}{[C(O)]₂NR^{o2}R^{o3}}, -N(R^s)C(O)]₂OR^o, -N(R^s)C(NR^{s1})OR^o, -N(R^s)C(NOH)R^o, -N(R^s)C(NR^{s1})SR^o, -N(R^s)C(NR^{s1})NR^oR^{o1} i -N=C(R^s)NR^oR^{o1}; i svaki od **R^o**, **R^{o1}**, **R^{o2}** i **R^{o3}** međusobno neovisno označava vodik ili skupinu odabranu od sljedećih: C₁₋₆alkil, 2-6-člani heteroalkil, C₁₋₆haloalkil, C₃₋₁₀cikloalkil, C₄₋₁₆cikloalkilalkil, C₆₋₁₀aril, C₇₋₁₆arilalkil, 5-12-člani heteroaril, 6-18-člani heteroarilalkil, 3-14-člani heterocikloalkil i 4-14-člani heterocikloalkilalkil, gdje **R^o** zajedno s **R^{o1}** i/ili **R^s** i/ili **R^{e1}** i/ili **R^{e2}** i/ili **R^{e3}** ili **R^{e2}** zajedno s **R^{e3}** može tvoriti 3-8-člani mono- ili biciklički heterocikloalkil-ostatak putem zajedničke uporabe C-, N- O- ili S-atoma, ili gdje **R^o** zajedno s **R^{o1}** može tvoriti 3-14-člani spirociklički heterocikloalkil-ostatak putem zajedničke uporabe C-, N-, O- ili S-atoma i gdje su **R^o**, **R^{o1}**, **R^{o2}** i **R^{o3}** neovisno opsijski supstituirani s jednim ili više istih ili različitih **R^p** i/ili **R^{q4}**; i svaki **R^p** označava prikladnu skupinu i odabran je međusobno neovisno između sljedećih: =O, -OR^q, C₁₋₃haloalkiloksi, -OCF₃, -OCHF₂, =S, -SR^q, =NR^q, =NOR^q, =NNR^qR^{q1}, =NN(R^s)C(O)NR^qR^{q1}, -NR^qR^{q1}, -ONR^qR^{q1}, -N(R^s)NR^qR^{q1}, halogen, -CF₃, -CN, -NC, -OCN, -SCN, -NO, -NO₂, =N₂, -N₃, -S(O)R^q, -S(O)OR^q, -S(O)₂R^q, -S(O)₂OR^q, -S(O)NR^qR^{q1}, -S(O)₂NR^qR^{q1}, -OS(O)R^q, -OS(O)₂R^q, -OS(O)₂OR^q, -OS(O)NR^qR^{q1}, -OS(O)₂NR^qR^{q1}, -C(O)R^q, -C(O)OR^q, -C(O)SR^q, -C(O)NR^qR^{q1}, -C(O)N(R^s)NR^qR^{q1}, -C(O)N(R^s)OR^q, -C(NR^s)NR^qR^{q1}, -C(NOH)R^q, -C(NOH)NR^qR^{q1}, -OC(O)R^q, -OC(O)OR^q, -OC(O)SR^q, -OC(O)NR^qR^{q1}, -OC(NR^s)NR^qR^{q1}, -SC(O)R^q, -SC(O)OR^q, -SC(O)NR^qR^{q1}, -SC(NR^s)NR^qR^{q1}, -N(R^s)C(O)R^q, -N[C(O)R^q][C(O)R^{q1}], -N(OR^s)C(O)R^q, -N(R^s)C(NR^{s1})R^q, -N(R^s)N(R^{s1})C(O)R^q, -N[C(O)R^{q2}][NR^qR^{q1}], -N(R^s)C(S)R^q, -N(R^s)S(O)R^q, -N(R^s)S(O)OR^q, -N(R^s)S(O)₂R^q, -N[S(O)₂R^q][S(O)₂R^{q1}], -N(R^s)S(O)₂OR^q, -N(R^s)S(O)₂NR^qR^{q1}, -N(R^s)S(O)₂NR^{q2}R^{q3}, -N(R^s)C(O)OR^q, -N(R^s)C(O)SR^q, -N(R^s)C(O)NR^qR^{q1}, -N(R^s)C(O)NR^{s1}NR^qR^{q1}, -N(R^s)N(R^{s1})C(O)NR^qR^{q1}, -N(R^s)C(S)NR^{q1}, -N[R^s)C(O)][N(R^{g1})C(O)]R^q, -N(R^s)C(O)]₂R^q, -N{[C(O)]₂R^q}{[C(O)]₂R^{q1}}, -N(R^s)C(O)]₂OR^q, -N(R^s)C(O)]₂NR^qR^{q1}, -N{[C(O)]₂OR^q}{[C(O)]₂OR^{q1}}, -N{[C(O)]₂NR^qR^{q1}}{[C(O)]₂NR^{q2}R^{q3}}, -N(R^s)C(O)][N(R^{s1})C(O)]OR^q, -N(R^s)C(NR^{s1})OR^q, -N(R^s)C(NOH)R^q, -N(R^s)C(NR^{s1})SR^q, -N(R^s)C(NR^{s1})NR^qR^{q1}, -N(R^s)C(=N-CN)NR^qR^{q1} i -N=C(R^s)NR^qR^{q1}; i svaki od **R^q**, **R^{q1}**, **R^{q2}**, **R^{q3}** i **R^{q4}** međusobno neovisno označava vodik ili skupinu odabranu od sljedećih: C₁₋₆alkil, 2-6-člani heteroalkil, C₁₋₆haloalkil, C₃₋₁₀cikloalkil, C₄₋₁₆cikloalkilalkil, C₆₋₁₀aril, C₇₋₁₆arilalkil, 5-12-člani heteroaril, 6-18-člani heteroarilalkil, 3-14-člani heterocikloalkil i 4-14-člani heterocikloalkilalkil, gdje **R^q** zajedno s **R^{q1}** i/ili **R^{q2}** i/ili **R^{q3}** i/ili **R^s** može tvoriti 3-8-člani heterocikloalkil-ostatak putem zajedničke uporabe C-, N- O- ili S-atoma, pri čemu su **R^q**, **R^{q1}**, **R^{q2}**, **R^{q3}** i **R^{q4}** opsijski neovisno supstituirani s jednim ili više istih ili različitih **R^r** i/ili **R^{s4}**; i svaki **R^r** označava prikladnu skupinu i u svakom slučaju, međusobno neovisno je odabran između sljedećih: =O, -OR^s, C₁₋₃haloalkiloksi, -OCF₃, -OCHF₂, =S, -SR^s, =NR^s, =NOR^s, =NNR^sR^{s1}, =NN(R^t)C(O)NR^sR^{s1}, -NR^sR^{s1}, -ONR^sR^{s1}, -N(R^t)NR^sR^{s1}, halogen, -CF₃, -CN, -NC, -OCN, -SCN, -NO, -NO₂, =N₂, -N₃, -S(O)R^s, -S(O)OR^s, -S(O)₂R^s, -S(O)₂OR^s, -S(O)NR^sR^{s1}, -S(O)₂NR^sR^{s1}, -OS(O)R^s, -OS(O)₂R^s, -

- $\text{OS(O)}_2\text{OR}^s$, $-\text{OS(O)NR}^s\text{R}^{s1}$, $-\text{OS(O)}_2\text{NR}^s\text{R}^{s1}$, $-\text{C(O)R}^s$, $-\text{C(O)OR}^s$, $-\text{C(O)SR}^s$, $-\text{C(O)NR}^s\text{R}^{s1}$, $-\text{C(O)N(R}^t\text{)NR}^s\text{R}^{s1}$, $-\text{C(O)N(R}^t\text{)OR}^s$, $-\text{C(NR}^t\text{)NR}^s\text{R}^{s1}$, $-\text{C(NOH)R}^s$, $-\text{C(NOH)NR}^s\text{R}^{s1}$, $-\text{OC(O)R}^s$, $-\text{OC(O)OR}^s$, $-\text{OC(O)SR}^s$, $-\text{OC(O)NR}^s\text{R}^{s1}$, $-\text{OC(NR}^t\text{)NR}^s\text{R}^{s1}$, $-\text{SC(O)R}^s$, $-\text{SC(O)OR}^s$, $-\text{SC(O)NR}^s\text{R}^{s1}$, $-\text{SC(NR}^t\text{)NR}^s\text{R}^{s1}$, $-\text{N(R}^t\text{)C(O)R}^s$, $-\text{N[C(O)R}^s\text{][C(O)R}^{s1}]$, $-\text{N(OR}^t\text{)C(O)R}^s$, $-\text{N(R}^t\text{)C(NR}^{t1}\text{)R}^s$, $-\text{N(R}^t\text{)N(R}^{t1}\text{)C(O)R}^s$, $-\text{N[C(O)R}^{g2}\text{]NR}^s\text{R}^{s1}$, $-\text{N(R}^t\text{)C(S)R}^s$, $-\text{N(R}^t\text{)S(O)R}^s$, $-\text{N(R}^t\text{)S(O)OR}^s$, $-\text{N(R}^t\text{)S(O)}_2\text{R}^s$, $-\text{N[S(O)}_2\text{R}^s\text{][S(O)}_2\text{R}^{s1}]$, $-\text{N(R}^t\text{)S(O)}_2\text{OR}^s$, $-\text{N(R}^t\text{)S(O)}_2\text{NR}^s\text{R}^{s1}$, $-\text{N(R}^t\text{)[S(O)}_2\text{]}_2\text{R}^s$, $-\text{N(R}^t\text{)C(O)OR}^s$, $-\text{N(R}^t\text{)C(O)SR}^s$, $-\text{N(R}^t\text{)C(O)NR}^s\text{R}^{s1}$, $-\text{N(R}^t\text{)C(O)NR}^{t1}\text{NR}^s\text{R}^{s1}$, $-\text{N(R}^t\text{)N(R}^{t1}\text{)C(O)NR}^s\text{R}^{s1}$, $-\text{N(R}^t\text{)C(S)NR}^s\text{R}^{s1}$, $-\text{[N(R}^t\text{)C(O)][N(R}^{h1}\text{)C(O)]R}^s$, $-\text{N(R}^t\text{)[C(O)]}_2\text{R}^s$, $-\text{N}\{[\text{C(O)}]_2\text{R}^s\}\{[\text{C(O)}]_2\text{R}^{s1}\}$, $-\text{N(R}^t\text{)[C(O)]}_2\text{OR}^s$, $-\text{N(R}^t\text{)[C(O)]}_2\text{NR}^s\text{R}^{s1}$, $-\text{N}\{[\text{C(O)}]_2\text{OR}^s\}\{[\text{C(O)}]_2\text{OR}^{s1}\}$, $-\text{N}\{[\text{C(O)}]_2\text{NR}^s\text{R}^{s1}\}\{[\text{C(O)}]_2\text{NR}^{s2}\text{R}^{s3}\}$, $-\text{[N(R}^t\text{)C(O)][N(R}^{t1}\text{)C(O)]OR}^s$, $-\text{N(R}^t\text{)C(NR}^{t1}\text{)OR}^s$, $-\text{N(R}^t\text{)C(NOH)R}^s$, $-\text{N(R}^t\text{)C(NR}^{t1}\text{)SR}^s$, $-\text{N(R}^t\text{)C(NR}^{t1}\text{)NR}^s\text{R}^{s1}$, $-\text{N(R}^t\text{)C(=N-CN)NR}^s\text{R}^{s1}$ i $-\text{N=C(R}^t\text{)NR}^s\text{R}^{s1}$; i svaki od R^s , R^{s1} , R^{s2} , R^{s3} i R^{s4} međusobno neovisno označava vodik ili skupinu odabranu od sljedećih: C_{1-6} alkil, 2-6-člani heteroalkil, C_{1-6} haloalkil, C_{3-10} cikloalkil, C_{4-16} cikloalkilalkil, C_{6-10} aril, C_{7-16} arilalkil, 5-12-člani heteroaril, 6-18-člani heteroarilalkil, 3-14-člani heterocikloalkil i 4-14-člani heterocikloalkilalkil, gdje R^s zajedno s R^{s1} i/ili R^{s2} i/ili R^{s3} i/ili R^{s4} može tvoriti 3-8-člani heterocikloalkil-ostatak putem zajedničke uporabe C-, N- O- ili S-atoma, R^s , R^{s1} , R^{s2} , R^{s3} i R^{s4} su neovisno opcijski supstituirani s jednim ili više istih ili različitih R^{t2} ; i svaki od R^t , R^{t1} i R^{t2} međusobno neovisno je odabran između sljedećih: vodik, C_{1-6} alkil, 2-6-člani heteroalkil, C_{1-6} haloalkil, C_{3-10} cikloalkil, C_{4-16} cikloalkilalkil, C_{6-10} aril, C_{7-16} arilalkil, 5-12-člani heteroaril, 6-18-člani heteroarilalkil, 3-14-člani heterocikloalkil i 4-14-člani heterocikloalkilalkil, gdje R^t zajedno s R^{t1} može tvoriti 3-8-člani heterocikloalkil-ostatak putem zajedničke uporabe C-, N-, O- ili S-atoma, opcijski u obliku tautomera, racemata, enantiomera, diastereomera, i njihovih mješavina, i opcijski u obliku njihovih farmakološki prihvatljivih soli.
2. Spojevi prema zahtjevu 1, **naznačeni time, da R^2 označava $-\text{CH}_3$ ili $-\text{C}_2\text{H}_5$.**
3. Spojevi prema bilo kojem od zahtjeva 1 ili 2, **naznačeni time, da R^5 označava skupinu odabranu između R^m , R^n ; i svaki R^m međusobno neovisno označava vodik ili skupinu odabranu između sljedećih: C_{1-4} alkil, C_{4-6} cikloalkil, metoksietil, ciklopropilmetil, fenil, nafil, benzil, 5-6-člani heteroaril, 4-6-člani heterocikloalkil, pri čemu je R^m opcijski neovisno supstituiran s jednim ili više istih ili različitih R^n i/ili R^{o4} ; i svaki R^n označava prikladnu skupinu i odabran je međusobno neovisno između sljedećih: $=\text{O}$, $-\text{OH}$, $-\text{OCH}_3$, $-\text{OC}_2\text{H}_5$, $-\text{OCF}_3$, $-\text{OCHF}_2$, $-\text{SCH}_3$, $=\text{NOH}$, $=\text{NOCH}_3$, $-\text{NR}^o\text{R}^{o1}$, $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$, $-\text{CF}_3$, $-\text{CN}$, $-\text{NO}_2$, $-\text{N}_3$, $-\text{S(O)R}^o$, $-\text{S(O)}_2\text{R}^o$, $-\text{C(O)R}^o$, $-\text{C(O)OR}^o$, $-\text{C(O)NR}^o\text{R}^{o1}$, $-\text{OC(O)R}^o$, $-\text{OC(O)OR}^o$, $-\text{OC(O)NR}^o\text{R}^{o1}$, $-\text{N(R}^s\text{)C(O)R}^o$, $-\text{N(R}^s\text{)S(O)R}^o$, $-\text{N(R}^s\text{)S(O)}_2\text{R}^o$, $-\text{N(R}^s\text{)S(O)}_2\text{NR}^o\text{R}^{o1}$, $-\text{N(R}^s\text{)C(O)OR}^o$, $-\text{N(R}^s\text{)C(O)NR}^o\text{R}^{o1}$; i svaki od R^o , R^{o1} i R^{o4} međusobno neovisno označava vodik ili skupinu odabranu između sljedećih: C_{1-4} alkil, 2-6-člani heteroalkil, C_{3-6} cikloalkil, C_{4-10} cikloalkilalkil, fenil, benzil, 5-6-člani heteroaril, C_{4-6} heterocikloalkil, gdje R^o zajedno s R^{o1} i/ili R^s može tvoriti 3-8-člani heterocikloalkil-ostatak putem zajedničke uporabe C-, N- O- ili S-atoma, pri čemu su R^o , R^{o1} i R^{o4} opcijski neovisno supstituirani s jednim ili više istih ili različitih R^p i/ili R^{q4} ; i svaki R^p označava prikladnu skupinu i odabran je međusobno neovisno od sljedećih: $=\text{O}$, $-\text{OH}$, metoksi, etoksi, izopropoksi, $-\text{OCF}_3$, $-\text{OCHF}_2$, $-\text{SCH}_3$, amino, metilamino, dimetilamino, etilamino, izopropilamino, morfolin, piperidin, pirolidin, piperazin, N-metilpiperazin, acetyl, metilsulfonil, etilsulfonil, izopropilsulfonil, metoksikarbonil, etoksikarbonil, $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$, $-\text{CF}_3$, $-\text{CN}$, $-\text{S(O)}_2\text{C}_2\text{H}_5$, $-\text{S(O)}_2\text{CH}_3$; i svaki R^{q4} označava prikladnu skupinu i odabran je međusobno neovisno između sljedećih: C_{1-4} alkil, 4-6-člani heteroalkil, C_{4-6} cikloalkil, C_{4-7} cikloalkilalkil, fenil, benzil, 5-6-člani heteroaril, 6-8-člani heteroarilalkil, 4-6-člani heterocikloalkil i 4-7-člani heterocikloalkilalkil; i svaki R^s međusobno neovisno označava vodik ili skupinu odabranu između sljedećih: C_{1-4} alkil, 2-6-člani heteroalkil, C_{3-8} cikloalkil, C_{4-10} cikloalkilalkil, fenil, benzil, 5-6-člani heteroaril, 6-12-člani heteroarilalkil, 3-8-člani heterocikloalkil i 4-10-člani heterocikloalkilalkil.**
4. Spojevi prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 3, **naznačeni time, da R^{q4} označava prikladnu skupinu i odabran je međusobno neovisno između sljedećih: metil, etil, 1-propil, 2-propil, 1-butyl, tert-butyl, oksetanil, tetrahidrofuranyl, tetrahidropiranyl, ciklobutil, ciklopentil, cikloheksil, ciklopropilmetil, metoksietil, fenil, benzil, piridil, pirimidinil, piridazinil, imidazolil, pirazolil, tiazolil.**
5. Spojevi prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 4, **naznačeni time, da R^5 označava skupinu odabranu od R^n ; i svaki R^n označava prikladnu skupinu i odabran je međusobno neovisno između sljedećih: metoksi, etoksi, $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{C(O)R}^o$, $-\text{C(O)NR}^o\text{R}^{o1}$; i svaki od R^o i R^{o1} međusobno neovisno označava vodik ili skupinu odabranu od sljedećih: metil, etil, prop-2-il, prop-1-il, metoksietil, ciklopropil, ciklobutil, ciklopentil, cikloheksil, ciklopropilmetil, morfolin, piperidin, pirolidin, piperazin, ili gdje R^o i R^{o1} tvore ciklički amin, odabran od sljedećih: morfolin, piperazin, homomorfolin, homopiperazin, piperidin, pirolidin, pri čemu su R^o i R^{o1} neovisno opcijski supstituirani s jednim ili više istih ili različitih R^p i/ili R^{q4} ; i svaki R^p označava prikladnu skupinu i odabran je međusobno neovisno između sljedećih: $=\text{O}$, $-\text{OH}$, metoksi, etoksi, izopropoksi, amino, metilamino, dimetilamino, etilamino, izopropilamino, acetyl, metilsulfonil, etilsulfonil, izopropilsulfonil, metoksikarbonil, etoksikarbonil, $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{Br}$, $-\text{CF}_3$, $-\text{CN}$; i svaki R^{q4} označava prikladnu skupinu i odabran je međusobno neovisno između sljedećih: metil, etil, 1-propil, 2-propil, 1-butyl, 2-butyl, tert-butyl, morfolinil, piperidinil, pirolidinil, piperazinil, N-metilpiperazinil, oksetanil, tetrahidrofuranyl, tetrahidropiranyl, tetrahidrotiofenil, 1,1-diokso-tetrahidrotiofenil, ciklopropil, ciklobutil, ciklopentil, cikloheksil, ciklopropilmetil, metoksietil, fenil, benzil, piridil, pirimidinil, piridazinil, imidazolil, pirazolil, tiazolil.**
6. Spojevi prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 5, **naznačeni time, da R^1 označava piridil, i gdje su R^5 i R^5 odabrani između sljedećih: metil, etil, n-propil, izopropil, ciklopropil, metoksi, $-\text{CF}_3$.**

7. Spojevi prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 5, **naznačeni time, da R^1 označava fenil**, i gdje su R^5 i R^5 odabrani od R^n ; i svaki R^n označava prikladnu skupinu i odabran je međusobno neovisno od sljedećih: metil, metoksi, etoksi, -F, -Cl, -C(O) R^o , -C(O)NR o R o1 ; i svaki od R^o i R^{o1} međusobno neovisno označava vodik ili skupinu opcijski supstituiranu s jednim ili više istih ili različitih R^p i/ili R^{q4} , odabranih između sljedećih: metil, etil, prop-2-il, prop-1-il, metoksietil, ciklopropil, ciklobutil, ciklopentil, cikloheksil, ciklopropilmetil, morfolin, piperidin, pirolidin, piperazin, ili gdje R^o i R^{o1} tvore ciklički amin, odabran od sljedećih: morfolin, piperazin, homomorfolin, homopiperazin, piperidin, pirolidin, opcijski supstituiran s jednim ili više istih ili različitih R^p i/ili R^{q4} ; i svaki R^p označava prikladnu skupinu i odabran je međusobno neovisno od sljedećih: =O, -OH, metoksi, etoksi, izopropoksi, amino, metilamino, dimetilamino, etilamino, izopropilamino, acetyl, metilsulfonil, etilsulfonil, izopropilsulfonil, metoksikarbonil, etoksikarbonil, -F, -Cl, -Br, -CF₃, -CN; i svaki R^{q4} označava prikladnu skupinu i odabran je međusobno neovisno od sljedećih: metil, etil, 1-propil, 2-propil, 1-butil, 2-butil, tert-butil, morfolinil, piperidinil, pirolidinil, piperazinil, N-metilpiperazinil, oksetanil, tetrahydrofuranil, tetrahidropiranil, tetrahidrotiofenil, 1,1-dioekso-tetrahidrotiofenil, ciklopropil, ciklobutil, ciklopentil, cikloheksil, ciklopropilmetil, metoksietil, fenil, benzil, piridil, pirimidinil, piridazinil, imidazolil, pirazolil, tiazolil.

8. Spojevi prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 7, **naznačeni time, da su odabrani od sljedećih:**

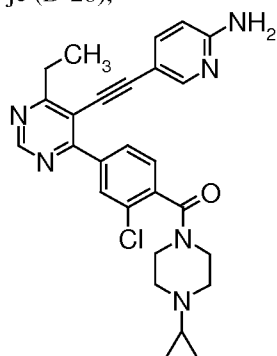
Br.	Struktura	Br.	Struktura
D-8		D-13	
D-15		D-20	
D-21		D-28	

Br.	Struktura	Br.	Struktura
D-29		D-31	
D-38		D-42	
D-45		D-58	
D-63		D-64	

Br.	Struktura	Br.	Struktura
D-70		D-78	
D-83		D-84	
D-95		D-96	
D-106		D-121	

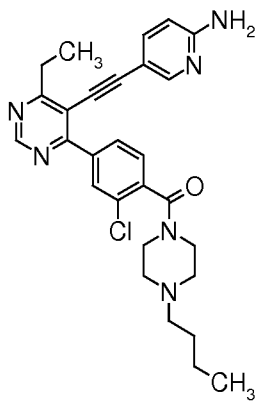
Br.	Struktura	Br.	Struktura
D-122		D-151	
D-79		D-236	
D-237		D-239	

9. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time, da je** (D-28),



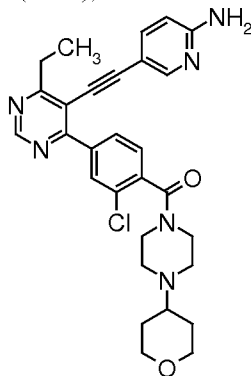
opcijski u obliku tautomera, racemata, enantiomera, diastereomera, i njihovih mješavina, i opcijski u obliku njihovih farmakološki prihvatljivih soli.

5 10. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time, da je** (D-29),



opcijski u obliku tautomera, racemata, enantiomera, diastereomera, i njihovih mješavina, i opcijski u obliku njihovih farmakološki prihvatljivih soli.

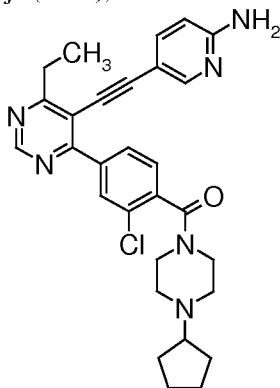
11. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time, da je** (D-31),



5

opcijski u obliku tautomera, racemata, enantiomera, diastereomera, i njihovih mješavina, i opcijski u obliku njihovih farmakološki prihvatljivih soli.

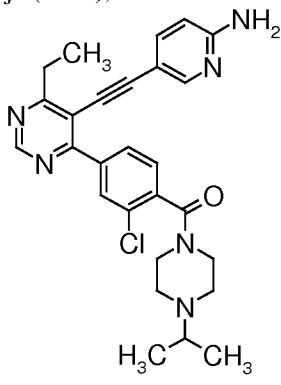
12. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time, da je** (D-38),



10

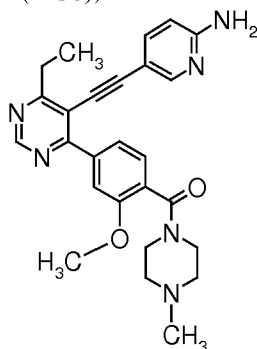
opcijski u obliku tautomera, racemata, enantiomera, diastereomera, i njihovih mješavina, i opcijski u obliku njihovih farmakološki prihvatljivih soli.

13. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time, da je** (D-42),



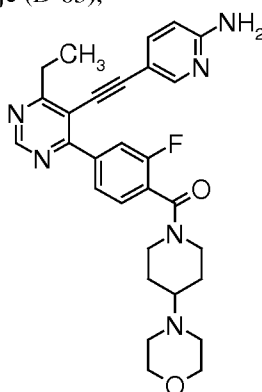
opcijski u obliku tautomera, racemata, enantiomera, diastereomera, i njihovih mješavina, i opcijski u obliku njihovih farmakološki prihvatljivih soli.

14. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time, da** je (D-58),



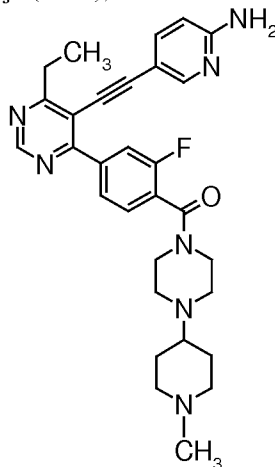
opcijski u obliku tautomera, racemata, enantiomera, diastereomera, i njihovih mješavina, i opcijski u obliku njihovih farmakološki prihvatljivih soli.

15. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time, da** je (D-63),



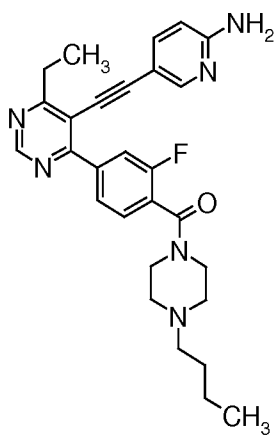
opcijski u obliku tautomera, racemata, enantiomera, diastereomera, i njihovih mješavina, i opcijski u obliku njihovih farmakološki prihvatljivih soli.

16. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time, da** je (D-64),



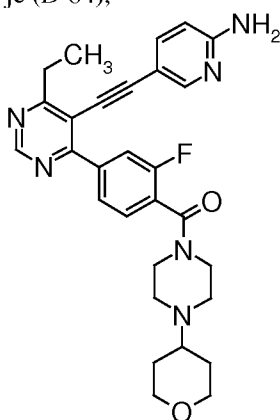
opcijski u obliku tautomera, racemata, enantiomera, diastereomera, i njihovih mješavina, i opcijski u obliku njihovih farmakološki prihvatljivih soli.

17. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time, da** je (D-83),



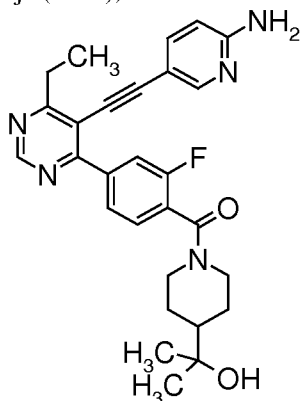
opcijski u obliku tautomera, racemata, enantiomera, diastereomera, i njihovih mješavina, i opcijski u obliku njihovih farmakološki prihvatljivih soli.

18. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time, da** je (D-84),



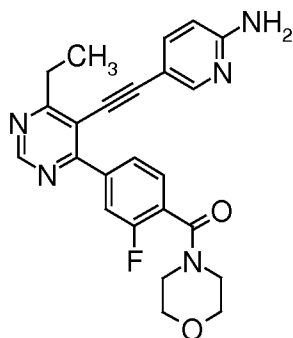
opcijski u obliku tautomera, racemata, enantiomera, diastereomera, i njihovih mješavina, i opcijski u obliku njihovih farmakološki prihvatljivih soli.

19. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time, da** je (D-79),



opcijski u obliku tautomera, racemata, enantiomera, diastereomera, i njihovih mješavina, i opcijski u obliku njihovih farmakološki prihvatljivih soli.

20. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time, da** je (D-239),



opcijski u obliku tautomera, racemata, enantiomera, diastereomera, i njihovih mješavina, i opcijski u obliku njihovih farmakološki prihvatljivih soli.

21. Spojevi ili njihove farmakološki učinkovite soli, prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 20, **naznačeni/naznačene time, da se upotrebljavaju kao lijekovi.**
22. Spojevi ili njihove farmakološki učinkovite soli, prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 20, **naznačeni/naznačene time, da se upotrebljavaju u proizvodnji lijeka s antiproliferativnim djelovanjem.**
23. Farmaceutski pripravci, **naznačeni time, da** kao djelotvornu tvar, sadrže jedan ili više spojeva opće formule (1) prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 20, ili njihove farmakološki učinkovite soli, opcijski u kombinaciji s uobičajenim pomoćnim sredstvima i/ili nosačima.
24. Spojevi opće formule (1) prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 20, **naznačeni time, da** se upotrebljavaju u liječenju i/ili prevenciji raka, infekcija, upalnih i autoimunih bolesti.
25. Uporaba spojeva opće formule (1) prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 20, **naznačena time, da** je za proizvodnju lijeka za liječenje i/ili prevenciju raka, infekcija, upalnih i autoimunih bolesti.
26. Farmaceutski pripravak, **naznačen time, da** obuhvaća spoj opće formule (1) prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 20 i najmanje jedan drugačiji citostatik ili citotoksičnu djelotvornu tvar različitu od formule (1), opcijski u obliku tautomera, racemata, enantiomera, diastereomera i njihovih mješavina, kao i opcijski u obliku njegovih farmakološki prihvatljivih soli.