



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20160636 T1

HR P20160636 T1

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

(51) MKP:

C07D 253/07 (2006.01)
C07D 401/04 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01)
C07D 403/04 (2006.01)
C07D 403/12 (2006.01)
C07D 405/04 (2006.01)
C07D 405/10 (2006.01)
C07D 413/04 (2006.01)
C07D 417/12 (2006.01)
C07D 487/04 (2006.01)
A61K 31/53 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 29.07.2016.

(21) Broj predmeta: P20160636T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 09.06.2016.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2011051755
Datum podnošenja međunarodne prijave: 07.02.2011.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 11704571.6
Datum podnošenja europske prijave patenta: 07.02.2011.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2011095625
Datum međunarodne objave: 11.08.2011.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2531492 A1
Datum objave europske prijave patenta: 12.12.2012.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2531492 B1
Datum objave europskog patenta: 13.04.2016.

(31) Broj prve prijave: 302060 P
381764 P

(32) Datum podnošenja prve prijave: 05.02.2010.
10.09.2010.

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

(73) Nositelj patenta:

**Heptares Therapeutics Limited, BioPark, Broadwater Road, AL7 3AX
Welwyn Garden City, Hertfordshire, GB**

(72) Izumitelji:

**Miles Stuart Congreve, Heptares Therapeutics Limited, BioPark,
Broadwater Road, AL7 3AX Welwyn Garden City, Hertfordshire, GB
Stephen Philippe Andrews, Heptares Therapeutics Limited, BioPark,
Broadwater Road, AL7 3AX Welwyn Garden City, Hertfordshire, GB
Jonathan Stephen Mason, Heptares Therapeutics Limited, BioPark,
Broadwater Road, AL7 3AX Welwyn Garden City, Hertfordshire, GB
Christine Mary Richardson, BioFocus, Chesterford Research Park,
Chesterford Park, CB10 1XL Little Chesterford Saffron Walden, GB
Giles Albert Brown, Heptares Therapeutics Limited, BioPark, Broadwater
Road, AL7 3AX Welwyn Garden City, Hertfordshire, GB
PRODUCTA d.o.o., 10000 Zagreb, HR**

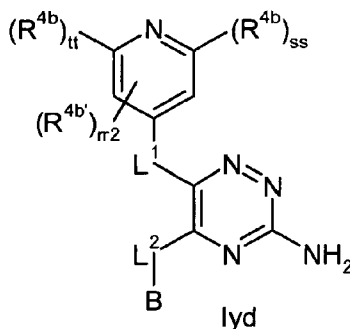
(74) Zastupnik:

(54) Naziv izuma: **DERIVATI 1,2,4-TRIAZIN-4-AMINA**

HR P20160636 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

1. Spoj s formulom lyd,



naznačen time da:

B predstavlja CY^{BB} ili Het^{BB} ;

CY^{BB} predstavlja fenil proizvoljno supstituiran s jednim ili više R^{4c} supstituenata;

Het^{BB} predstavlja 6-članu aromatsku heterocikličku skupinu koja sadrži jedan ili više N atoma, te je navedena Het^{BB} skupina proizvoljno supstituirana s jednim ili više R^{4d} supstituenata;

R^{4b} , $R^{4b'}$, R^{4c} i R^{4d} predstavljaju, svaki puta neovisno,

(a) halo,

(b) CN,

(c) C_{1-12} alkil, C_{2-12} alkenil, C_{2-12} alkinil, navedene zadnje tri skupine su proizvoljno supstituirane s jednim ili više supstituenata koji su odabrani od halo, nitro, CN, C_{1-6} alkil, C_{2-6} alkenil, C_{2-6} alkinil (navedene zadnje tri skupine su proizvoljno supstituirane s jednim ili više supstituenata koji su odabrani od OH, =O, halo, C_{1-4} alkila i C_{1-4} alkoksi), OR^{5a} , $S(O)_qR^{5b}$, $S(O)_2N(R^{5c})(R^{5d})$, $N(R^{5e})S(O)_2R^{5f}$, $N(R^{5g})(R^{5h})$, $B^1-C(G^1)-B^2-R^{5i}$, aril i Het^1 ,

(d) Cy^3 , navedena Cy^3 skupina je proizvoljno supstituirana s jednim ili više supstituenata koji su odabrani od halo, nitro, CN, C_{1-6} alkil, C_{2-6} alkenil, C_{2-6} alkinil (navedene zadnje tri skupine su proizvoljno supstituirane s jednim ili više supstituenata koji su odabrani od OH, =O, halo, C_{1-4} alkil i C_{1-4} alkoksi), OR^{6a} , $S(O)_qR^{6b}$, $S(O)_2N(R^{6c})(R^{6d})$, $N(R^{6e})S(O)_2R^{6f}$, $N(R^{6g})(R^{6h})$, $B^3-C(G^1)-B^4-R^{6i}$, aril i Het^2 ,

(e) Het^a , navedena Het^a skupina je proizvoljno supstituirana s jednim ili više supstituenata koji su odabrani od halo, nitro, CN, C_{1-6} alkil, C_{2-6} alkenil, C_{2-6} alkinil (navedene zadnje tri skupine su proizvoljno supstituirane s jednim ili više supstituenata koji su odabrani od OH, =O, halo, C_{1-4} alkil i C_{1-4} alkoksi), OR^{7a} , $S(O)_qR^{7b}$, $S(O)_2N(R^{7c})(R^{7d})$, $N(R^{7e})S(O)_2R^{7f}$, $N(R^{7g})(R^{7h})$, $B^5-C(G^1)-B^6-R^{7i}$, aril i Het^3 ,

(f) OR^8 ,

(g) $S(O)_rR^{9a}$,

(h) $S(O)_2N(R^{9b})(R^{9c})$,

(i) $N(R^{9d})S(O)_2R^{9e}$,

(j) $N(R^{9f})(R^{9g})$,

(k) $B^7-C(G^1)-B^8-R^{9h}$,

(l) =O,

(m)=S,

$rr2$ predstavlja 0 do 2;

ss i tt neovisno predstavljaju, pri svakoj pojavi 0 ili 1, pod uvjetom da ss i tt oba ne predstavljaju 0;

L^1 i L^2 oba predstavljaju izravne veze;

G^1 predstavlja, svaki puta neovisno, O, S ili NR^{5j} ;

R^8 predstavlja, svaki puta neovisno,

H,

Cy^3 , Het^a , aril^a, C_{1-8} alkil, C_{2-8} alkenil, C_{2-8} alkinil, C_{3-8} cikloalkil, navedenih zadnjih sedam skupina su proizvoljno supstituirane s jednim ili više supstituenata koji su odabrani od halo, -CN, C_{3-6} cikloalkil, aril, Het^4 , $-C(O)OR^{10}$, $-C(O)R^{11}$, $-C(O)N(R^{N1})(R^{N2})$, $S(O)_rR^{9aa}$, $S(O)_2N(R^{9ba})(R^{9ca})$, $N(R^{9da})S(O)_2R^{9ea}$ i $N(R^{9fa})(R^{9ga})$;

Cy^3 predstavlja, svaki puta neovisno, 3- do 6-člani aromatski, potpuno zasićen ili djelomično nezasićen karbociklički prsten;

Het^a predstavlja, svaki puta neovisno, 3- do 6-člani heterociklički prsten, koji može biti aromatski, potpuno zasićen ili djelomično nezasićen i koji sadrži jedan ili više heteroatoma izabranih između O, S i N;

R^{10} i R^{11} neovisno predstavljaju

(a) H,

(b) C_{1-6} alkil proizvoljno supstituiran s jednim ili više supstituenata koji su odabrani od halo, aril, $-N(R^{N3})(R^{N4})$ i $-OR^a$,

(c) aril ili

(d) C₃₋₇ cikloalkil (navedena skupina je proizvoljno supstituirana s jednim ili više supstituenata koji su odabrani od OH, =O, halo, C₁₋₄ alkil i C₁₋₄ alkoksi);

B¹ do B⁸ neovisno predstavljaju, pri svakoj pojavi, izravnu vezu, O, S ili N(R^{N3});

svaki aril^a neovisno predstavlja C₆₋₁₄ karbocikličku aromatsku skupinu, navedena skupina može sadržavati jedan, dva ili tri prstena;

svaki aril neovisno predstavlja C₆₋₁₄ karbocikličku aromatsku skupinu, navedena skupina može sadržavati jedan, dva ili tri prstena i može biti supstituirana sa jednim ili više supstituenata koji se biraju od

halo,

C₁₋₆ alkila, navedena posljednja skupina je proizvoljno supstituirana s jednim ili više supstituenata koji su odabrani od halo, -N(R^{N4})(RN5) i -OR^a, i

-OR^a;

Het¹ do Het⁴ neovisno predstavljaju 4- do 14-člane heterocikličke skupine koje sadrže jedan ili više heteroatoma koji su odabrani od O, S i N, navedene heterocikličke skupine mogu sadržavati jedan, dva ili tri prstena i mogu biti supstituirane s jednim ili više supstituenata koji se biraju od

halo,

C₁₋₆ alkila, navedena posljednja skupina je proizvoljno supstituirana s jednim ili više supstituenata koji su odabrani od halo, -N(RN6)(RN7) i -OR^a, i

-OR^a;

R^{N1} do RN7 neovisno predstavljaju

H,

C₁₋₆ alkil ili C₃₋₆ cikloalkil, navedene zadnje dvije skupine su proizvoljno supstituirane s jednim ili više supstituenata koji su odabrani od halo i -OR^a;

R^a predstavlja, svaki puta neovisno,

(a) H;

(b) C₁₋₁₂ alkil, C₂₋₁₂ alkenil, C₂₋₁₂ alkinil, C₃₋₁₂ cikloalkil, C₄₋₁₂ cikloalkenil, navedenih zadnjih pet skupina su proizvoljno supstituirane s jednim ili više supstituenata koji su odabrani od halo, nitro, CN, C₁₋₆ alkil, C₂₋₆ alkenil, C₂₋₆ alkinil, C₃₋₈ cikloalkil (navedene zadnje četiri skupine su proizvoljno supstituirane s jednim ili više supstituenata koji su odabrani od OH, =O, halo, C₁₋₄ alkil i C₁₋₄ alkoksi), OR^{12a}, S(O)₄R^{12b}, S(O)₂N(R^{12c})(R^{12d}), N(R^{12e})S(O)₂R^{12f}, N(R^{12g})(R^{12h}), B⁹-C(G²)-B¹⁰-R¹²ⁱ, aril¹ i Het^b, i navedene C₃₋₁₂ cikloalkil ili C₄₋₁₂ cikloalkenil skupine mogu dodatno biti supstituirane s =O,

(c) S(O)₄R^{13a},

(d) S(O)₂N(R^{13b})(R^{13c}) ili

(e) C(O)-B¹¹-R^{13d};

R^{5a} do R^{5j}, R^{6a} do R⁶ⁱ, R^{7a} do R⁷ⁱ, R^{9a} do R^{9h}, R^{9aa} do R^{99a}, R^{12a} do R¹²ⁱ i R^{13a} do R^{13d} neovisno predstavljaju, pri svakoj pojavi,

(a) H,

(b) C₁₋₁₀ alkil, C₂₋₁₀ alkenil, C₂₋₁₀ alkinil navedene zadnje tri skupine su proizvoljno supstituirane s jednim ili više supstituenata koji su odabrani od halo, nitro, CN, C₁₋₆ alkil, C₂₋₆ alkenil, C₂₋₆ alkinil, C₃₋₆ cikloalkil (navedene zadnje tri skupine su proizvoljno supstituirane s jednim ili više supstituenata koji su odabrani od OH, =O, halo, C₁₋₄ alkil i C₁₋₄ alkoksi), OR^{5aa}, S(O)₄R^{5ab}, S(O)₂N(R^{5ac})(R^{5ad}), N(R^{5ae})S(O)₂R^{5af}, N(R^{5ag})(R^{5ah}), B¹²-C(G²)-B¹³-R^{5ai}, aril¹ i Het^c;

(c) C₃₋₁₀ cikloalkil, ili C₄₋₁₀ cikloalkenil (navedene zadnje dvije skupine su proizvoljno supstituirane s jednim ili više supstituenata koji su odabrani od halo, OH, =O, C₁₋₆ alkil i C₁₋₆ alkoksi),

(d) Hetd;

G² predstavlja, neovisno pri svakoj pojavi, O, S, ili NR^{5aj};

R^{5aa} do R^{5aj} neovisno predstavljaju pri svakoj pojavi,

(a) H,

(b) C₁₋₄ alkil, C₂₋₄ alkenil, C₂₋₄ alkinil navedene zadnje tri skupine su proizvoljno supstituirane s jednim ili više supstituenata koji su odabrani od halo, nitro, CN, C₁₋₄ alkil, C₂₋₄ alkenil, C₂₋₄ alkinil (navedene zadnje tri skupine su proizvoljno supstituirane s jednim ili više supstituenata koji su odabrani od OH, =O, halo, C₁₋₄ alkil i C₁₋₄ alkoksi),

(c) C₃₋₆ cikloalkil, ili C₄₋₆ cikloalkenil (navedene zadnje dvije skupine su proizvoljno supstituirane s jednim ili više supstituenata koji su odabrani od halo, OH, =O, C₁₋₄ alkil i C₁₋₄ alkoksi),

(d) Hete,

ili R^{5ag} i R^{5ah} mogu predstavljati, zajedno s atomom dušika na koji su vezani, 3- do 10-člane heterociklički prsten, koji može biti aromatski, potpuno zasićen ili djelomično nezasićen i koji dodatno može sadržavati jedan ili više heteroatoma odabranih od O, S i N, navedeni heterociklički prsten je proizvoljno supstituiran s jednim ili više supstituenata koji su odabrani od halo, nitro, CN, C₁₋₆ alkil, C₂₋₆ alkenil, C₂₋₆ alkinil (navedene zadnje tri skupine su proizvoljno supstituirane s jednim ili više supstituenata koji su odabrani od OH, =O, halo, C₁₋₄ alkil i C₁₋₄ alkoksi);

B⁹ do B¹³ neovisno predstavljaju izravnu vezu, O, S ili N(RN8);

aril¹ predstavlja, svaki puta neovisno, C₆₋₁₀ karbocikličku aromatsku skupinu, navedena skupina može sadržavati

jedan ili dva prstena i može biti supstituirana sa jednim ili više supstituenata koji se biraju od halo,

C₁₋₆ alkil, navedena posljednja skupina je proizvoljno supstituirana s jednim ili više supstituenata koji su odabrani od halo, -N(R^{N10})(R^{N11}) i C₁₋₆ alkoksi (navedeni posljednji supstituent je proizvoljno supstituiran s jednim ili više halogenih atoma), i

C₁₋₆ alkoksi (navedeni posljednji supstituent je proizvoljno supstituiran s jednim ili više halogenih atoma);
RN8, R^{N10} i R^{N11} neovisno predstavljaju

H,

C₁₋₆ alkil ili C₃₋₆ cikloalkil, navedene zadnje dvije skupine su proizvoljno supstituirane s jednim ili više halogenih atoma;

Het^b predstavlja 5- ili 6-člani heterociklički prsten koji može biti aromatski, potpuno zasićen ili djelomično nezasićen i koji sadrži jedan ili više heteroatoma izabranih između O, S i N, navedena heterociklička skupina može biti supstituirana sa jednim ili više supstituenata koji se biraju od halo, =O i C₁₋₆ alkil;

Het^c do Hete neovisno predstavljaju, 3- do 6-člani heterociklički prsten, koji može biti aromatski, potpuno zasićen ili djelomično nezasićen i koji sadrži jedan ili više heteroatoma izabranih između O, S i N, navedene Het^c do Hete skupine su proizvoljno supstituirane s jednim ili više supstituenata koji su odabrani od halo, nitro, CN, C₁₋₆ alkil, C₂₋₆ alkenil, C₂₋₆ alkinil (navedene zadnje tri skupine su proizvoljno supstituirane s jednim ili više supstituenata koji su odabrani od OH, =O, halo, C₁₋₄ alkil i C₁₋₄ alkoksi);

q i r neovisno predstavljaju pri svakoj pojavi 0, 1 ili 2; i

osim ako nije drugačije navedeno alkil, alkenil, alkinil, cikloalkil i alkilni dio alkoksi skupina mogu biti supstituirani s jednim ili više halogenih atoma;

ili njihova farmaceutska prihvatljiva sol ili solvat.

2. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time** da R^{4b} i R^{4b1} predstavljaju, svaki puta neovisno

(a) halo,

(b) CN,

(c) C₁₋₄ alkil, C₂₋₄ alkenil, C₂₋₄ alkinil, navedene zadnje tri skupine su proizvoljno supstituirane s jednim ili više supstituenata koji su odabrani od halo, nitro, CN, OR^{5a}, S(O)_qR^{5b}, S(O)₂N(R^{5c})(R^{5d}), N(R^{5e})S(O)₂R^{5f}, N(R^{5g})(R^{5h}), B¹-C(G¹)-B²-R⁵ⁱ i Het¹ (npr. jedan ili više supstituenata koji su odabrani od nitro, CN, OR^{5a}, S(O)_qR^{5b}, S(O)₂N(R^{5c})(R^{5d}), N(R^{5e})S(O)₂R^{5f}, N(R^{5g})(R^{5h}), B¹-C(G¹)-B²-R⁵ⁱ i Het¹),

(d) Cy³, navedena Cy³ skupina je proizvoljno supstituirana s jednim ili više supstituenata koji su odabrani od nitro, CN, OR^{6a}, S(O)_qR^{6b}, S(O)₂N(R^{6c})(R^{6d}), N(R^{6e})S(O)₂R^{6f}, N(R^{6g})(R^{6h}), B³-C(G¹)-B⁴-R⁶ⁱ i Het²,

(e) Het^a, navedena Het^a skupina je proizvoljno supstituirana s jednim ili više supstituenata koji su odabrani od halo, nitro, CN, OR^{7a}, S(O)_qR^{7b}, S(O)₂N(R^{7c})(R^{7d}), N(R^{7e})S(O)₂R^{7f}, N(R^{7g})(R^{7h}), B⁵-C(G¹)-B⁶-R⁷ⁱ i Het³,

(f) OR⁸,

(g) S(O)_rR^{9a},

(h) S(O)₂N(R^{9b})(R^{9c}),

(i) N(R^{9d})S(O)₂R^{9e},

(j) N(R^{9f})(R^{9g}) ili

(k) B⁷-C(G¹)-B⁸-R^{9h},

pri čemu R^{5a} do R⁵ⁱ, R^{5a} do R⁶ⁱ, R^{7a} do R⁷ⁱ, R⁸, R^{9a} do R⁹ⁿ, Cy³, Het¹ do Het³, Het^a, B¹ do B⁸, G¹, q i r su kako je definirano u zahtjevu 1.

3. Spoj prema zahtjevu 1 ili zahtjevu 2, **naznačen time** da:

R^{4b1} i R^{4b} predstavljaju, svaki puta neovisno, ciklopropil, jodo, bromo, kloro, fluoro, etil, metil, d3-metil, izo-propil, -C=CH, fenil, CF₃, CHF₂, CH₂F, CH₂CF₃, CF₂CF₃, CN, =O, OH, OCH(CH₃)₂, OCH₃, OCH₂CH₃, OCH₂F, OCHF₂, OCH₂CF₃, OCF₃, (CH₂)₃OH, CH₂OH ili CH₂OCH₃, CH(CH₃)OH, C(CH₃)₃OH, CH₂CH₂OH, NH₂, N(CH₃)₂, N(H)CH₂CH₃, N(H)C(O)CH₃, C(O)CH₃, C(O)N(CH₃)₂, S(O)₂CH₃, S(O)CH₃, SCH₃, S(O)₂CF₃, azetidin, morfolin ili dioksolan.

4. Spoj u skladu s bilo kojim od zahtjeva 1 do 3, **naznačen time** da:

(A)

(1) R^{4b} predstavlja, svaki puta neovisno, OH, OCH(CH₃)₂, OCH₃, OCH₂CH₃, OCH₂F, OCHF₂, OCH₂CH₃, OCH₂CF₃, OCH₃, OCF₃, (CH₂)₃OH, CH₂OH ili CH₂OCH₃, NH₂, NHCH(CH₃)₂, NHCH₃, NHCH₂CH₃, NHCH₂CH₃, NH(CH(CH₃)₂)₂, NH(CH₃)₂, NH(CH₂CH₃)₂ ili NH(CH₂CH₃)₂;

(2) zbroj ss i tt je 1; i

(3) rr2 je 0; ili

(B)

(1) R^{4b} predstavlja, svaki puta neovisno, CH₂F ili, naročito, ciklopropil, kloro, fluoro, etil, metil, CF₃, CHF₂, CH₂CF₃, CF₂CF₃, OH, OCH(CH₃)₂, OCH₃, OCH₂CH₃, OCH₂F, OCHF₂, OCH₂CH₃, OCH₂CF₃, OCH₃, OCF₃, (CH₂)₃OH, CH₂OH ili CH₂OCH₃;

(2) ss i tt su oba 1; i

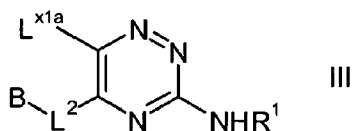
(3) rr2 je 0.

5. Spoj u skladu s bilo kojim od zahtjeva 1 do 4, **naznačen time** da spoj s formulom lyd je izabran sa popisa koji sadrži:

(lxiii) 6-(2-kloropiridin-4-il)-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
 (lxxvi) 6-(2-kloro-6-metilpiridin-4-il)-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
 (lxxix) 6-(2-metoksi-6-(trifluorometil)piridin-4-il)-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
 (lxxxvi) 6-(2-metoksipiridin-4-il)-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
 5 (xcvi) 6-(2,6-dimetoksipiridin-4-il)-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
 (xcvii) 6-(2,6-dimetilpiridin-4-il)-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
 (xcviii) 5-fenil-6-(2-(trifluorometil)piridin-4-il)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (xcix) 6-(2-ciklopropilpiridin-4-il)-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
 (cii) 6-(2,6-dikloropiridin-4-il)-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
 10 (cix) 6-(2-kloro-6-metilpiridin-4-il)-5-(3-fluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (cxiii) 6-(2-kloropiridin-4-il)-5-(4-fluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (cxiv) 6-(2-kloro-6-metilpiridin-4-il)-5-(4-fluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (cxvii) 5-(4-klorofenil)-6-(2-kloropiridin-4-il)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (cxviii) 6-(2-kloro-6-metilpiridin-4-il)-5-(4-klorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
 15 (cxxi) 5-(3-klorofenil)-6-(2-kloropiridin-4-il)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (cxxxii) 6-(2-kloro-6-metilpiridin-4-il)-5-(3-klorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (cxxxiv) 4-(3-amino-6-(2-kloro-6-metilpiridin-4-il)-1,2,4-triazin-5-il)benzonitril;
 (cxxxvi) 5-(3-kloro-5-fluorofenil)-6-(2-kloro-6-metilpiridin-4-il)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (cxxxix) 6-(2-kloro-6-metilpiridin-4-il)-5-(3,5-difluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
 20 (cxxxii) 5-(3-kloro-4-fluorofenil)-6-(2-kloro-6-metilpiridin-4-il)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (cxxxiii) 5-(3-kloro-4-fluorofenil)-6-(2-kloropiridin-4-il)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (cxxxvi) 6-(2-kloro-6-metilpiridin-4-il)-5-(3,4-difluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (cxxxvii) 6-(2-kloropiridin-4-il)-5-(3,4-difluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (cxl) 6-(2-kloro-6-metilpiridin-4-il)-5-(4-(metoksimetil)fenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
 25 (cxli) 6-(2,6-dimetilpiridin-4-il)-5-(4-fluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (clvii) 4-(3-amino-6-(2-kloropiridin-4-il)-1,2,4-triazin-5-il)benzonitril;
 (clix) 6-(2-kloropiridin-4-il)-5-(4-(metoksimetil)fenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (ccviii) 5-(3-kloro-5-fluorofenil)-6-(2-kloropiridin-4-il)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (ccix) 6-(2-kloropiridin-4-il)-5-(3,5-difluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
 30 (ccxi) 6-(2-kloro-6-metilpiridin-4-il)-5-(4-(difluorometoksi)fenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (ccxii) 6-(2-kloropiridin-4-il)-5-(4-(difluorometoksi)fenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (ccxvii) 5-(3-kloro-5-fluorofenil)-6-(2,6-dimetilpiridin-4-il)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (ccxviii) 5-(3,5-difluorofenil)-6-(2,6-dimetilpiridin-4-il)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (ccxix) 5-(3,4-difluorofenil)-6-(2,6-dimetilpiridin-4-il)-1,2,4-triazin-3-amin;
 35 (ccxx) 5-(3-kloro-4-fluorofenil)-6-(2,6-dimetilpiridin-4-il)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (ccxxi) 5-(4-(difluorometoksi)fenil)-6-(2,6-dimetilpiridin-4-il)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (ccxxii) 6-(2,6-dimetilpiridin-4-il)-5-(3-fluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (ccxxiii) 5-(4-klorofenil)-6-(2,6-dimetilpiridin-4-il)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (ccxxiv) 4-(3-amino-6-(2,6-dimetilpiridin-4-il)-1,2,4-triazin-5-il)benzonitril;
 40 (ccxxv) 5-(3-klorofenil)-6-(2,6-dimetilpiridin-4-il)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (ccxxvi) 6-(2,6-dimetilpiridin-4-il)-5-(4-(metoksimetil)fenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (ccxxxix) 5-(3-fluorofenil)-6-(2-kloropiridin-4-il)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (ccxli) 6-[2-kloro-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-5-(3,4-difluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (ccxlii) 6-[2-kloro-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-5-(3,5-difluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
 45 (ccxliii) 6-[2-(etilamino)-6-metilpiridin-4-il]-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
 (ccxliv) 6-[2-kloro-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-5-(3-fluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (ccxlv) 6-[2-kloro-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-5-(4-fluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (ccxlvii) 6-[2-(etil(metil)amino)-6-metilpiridin-4-il]-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
 (ccxlviii) 6-[2-(dimetilamino)-6-metilpiridin-4-il]-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
 50 (ccxlviii) 1-[6-(2,6-d6-dimetilpiridin-4-il)-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
 (ccclix) 6-[2-d3-metil-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
 (cccl) 5-(4-fluorofenil)-6-[2-d3-metil-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-1,2,4-triazin-3-amin;
 (cccli) 6-(2,6-dimetilpiridin-4-il)-5-(2-fluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (ccclii) 6-(2-kloro-6-metilpiridin-4-il)-5-(2-fluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
 55 (cccliii) 6-(2,6-dimetilpiridin-4-il)-5-(4-metoksifenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (cccliv) 6-(2-kloro-6-metilpiridin-4-il)-5-(4-metoksifenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (ccclv) 6-[2-(difluorometil)-6-metilpiridin-4-il]-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
 (ccclvi) 6-[2-kloro-6-(difluorometil)piridin-4-il]-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
 (ccclvii) 6-[2-kloro-6-(fluorometil)piridin-4-il]-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
 60 (ccclviii) 6-[2-(difluorometil)-6-metilpiridin-4-il]-5-(4-fluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
 (ccclix) 6-[2,6-bis(fluorometil)piridin-4-il]-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
 (ccclx) 6-[2-(fluorometil)-6-metilpiridin-4-il]-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;

- (cclxi) 6-(2-kloro-6-metilpiridin-4-il)-5-(2,5-difluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
(cclxii) 6-[2-kloro-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-5-(2-fluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
(cclxiii) 6-[2-kloro-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-5-(2,5-difluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
(cclxiv) 6-[2-ciklopropil-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
5 (cclxv) 6-[2-etil-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
(cclxvi) 6-(2-ciklopropil-6-metilpiridin-4-il)-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
(cclxvii) 5-(2-fluorofenil)-6-[2-metil-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-1,2,4-triazin-3-amin;
(cclxviii) 5-(3-fluorofenil)-6-[2-metil-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-1,2,4-triazin-3-amin;
(cclxix) 5-(4-fluorofenil)-6-[2-metil-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-1,2,4-triazin-3-amin;
10 (cclxx) 5-(2,5-difluorofenil)-6-[2-metil-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-1,2,4-triazin-3-amin;
(cclxxi) 5-(3,4-difluorofenil)-6-[2-metil-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-1,2,4-triazin-3-amin;
(cclxxii) 5-(3,5-difluorofenil)-6-[2-metil-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-1,2,4-triazin-3-amin;
(cclxxiii) 6-[2-(azetidin-1-il)-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-5-(4-fluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
(cclxxiv) 6-[2-metil-6-(morfolin-4-il)piridin-4-il]-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
15 (cclxxv) 6-(2-kloro-6-metilpiridin-4-il)-5-(4-etilfenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
(cclxxvi) 5-(2,5-difluorofenil)-6-(2,6-dimetilpiridin-4-il)-1,2,4-triazin-3-amin;
(cclxxvii) 6-(2,6-dimetilpiridin-4-il)-5-(4-metilfenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
(cclxxviii) 6-[2-(difluorometil)-6-metilpiridin-4-il]-5-(3-fluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
(cclxxix) 6-[2-(difluorometil)-6-metilpiridin-4-il]-5-(2-fluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
20 (cclxxxii) 6-[2-kloro-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
(cclxxxiii) 6-[2,6-bis(trifluorometil)piridin-4-il]-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
(cclxxxv) 6-[2-metil-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
(cclxxxvii) 6-[2-(dimetilamino)piridin-4-il]-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
(cclxxxviii) 6-(2-bromo-6-metilpiridin-4-il)-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
25 (cclxxxix) 6-(2,6-dimetil-1-oksipiridin-4-il)-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
(ccxc) 4-(3-amino-5-fenil-1,2,4-triazin-6-il)-6-metilpiridin-2-karbonitril;
(ccxcv) 6-[2-bromo-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
(ccc) 6-(2-metil-6-d3-metilpiridin-4-il)-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
(cccii) 6-[2-(azetidin-1-il)-6-metilpiridin-4-il]-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
30 (ccci) 6-[2-(azetidin-1-il)-6-metilpiridin-4-il]-5-(4-fluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin; i
(ccciv) 6-[2-(azetidin-1-il)-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin.
6. Spoj u skladu s bilo kojim od zahtjeva 1 do 5, **naznačen time** da spoj s formulom lyd je odabran iz skupa koji čine:
- 6-(2-kloropiridin-4-il)-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
6-(2-kloro-6-metilpiridin-4-il)-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
35 6-(2-metoksipiridin-4-il)-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
6-(2,6-dimetilpiridin-4-il)-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
5-fenil-6-(2-(trifluorometil)piridin-4-il)-1,2,4-triazin-3-amin;
6-(2-ciklopropilpiridin-4-il)-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
6-(2,6-dikloropiridin-4-il)-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
40 6-(2-kloro-6-metilpiridin-4-il)-5-(3-fluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
5-(4-klorofenil)-6-(2-kloropiridin-4-il)-1,2,4-triazin-3-amin;
5-(3-klorofenil)-6-(2-kloropiridin-4-il)-1,2,4-triazin-3-amin;
5-(3-kloro-4-fluorofenil)-6-(2-kloropiridin-4-il)-1,2,4-triazin-3-amin;
6-(2,6-dimetilpiridin-4-il)-5-(4-fluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
45 5-(3,5-difluorofenil)-6-(2,6-dimetilpiridin-4-il)-1,2,4-triazin-3-amin;
6-(2,6-dimetilpiridin-4-il)-5-(3-fluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
5-(4-klorofenil)-6-(2,6-dimetilpiridin-4-il)-1,2,4-triazin-3-amin;
5-(3-fluorofenil)-6-(2-kloropiridin-4-il)-1,2,4-triazin-3-amin;
6-[2-kloro-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-5-(4-fluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
50 6-[2-d3-metil-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
6-(2-kloro-6-metilpiridin-4-il)-5-(2-fluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
6-[2-kloro-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-5-(2-fluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
6-[2-kloro-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-5-(2,5-difluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;
6-(2-ciklopropil-6-metilpiridin-4-il)-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
55 5-(2-fluorofenil)-6-[2-metil-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-1,2,4-triazin-3-amin;
5-(3-fluorofenil)-6-[2-metil-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-1,2,4-triazin-3-amin;
5-(4-fluorofenil)-6-[2-metil-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-1,2,4-triazin-3-amin;
5-(3,5-difluorofenil)-6-[2-metil-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-1,2,4-triazin-3-amin;
6-[2-kloro-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
60 6-[2-bromo-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
6-[2-(azetidin-1-il)-6-metilpiridin-4-il]-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
6-(2-kloro-6-metilpiridin-4-il)-5-(4-fluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin;

- 5-(4-fluorofenil)-6-[2-d3-metil-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-1,2,4-triazin-3-amin;
 6-[2-(difluorometil)-6-metilpiridin-4-il]-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
 6-[2-kloro-6-(difluorometil)piridin-4-il]-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
 6-[2-kloro-6-(fluorometil)piridin-4-il]-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
 5 6-[2-(fluorometil)-6-metilpiridin-4-il]-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin;
 6-[2-metil-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin; i
 6-(2-bromo-6-metilpiridin-4-il)-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin.
7. Spoj **naznačen time** da je izabran iz skupine koju čine:
 6-(2-kloro-6-metilpiridin-4-il)-5-(4-fluorofenil)-1,2,4-triazin-3-amin i
 10 6-[2-metil-6-(trifluorometil)piridin-4-il]-5-fenil-1,2,4-triazin-3-amin,
 ili njihova farmaceutski prihvatljiva sol ili solvat.
8. Spoj u skladu s bilo kojim od zahtjeva 1 do 7, **naznačen time** da:
 B predstavlja ^{CYBB} ili Het^{BB} skupinu, navedena skupina je ili nesupstituirana ili je supstituirana s jednim ili više
 supstituenata koji se biraju od fluoro, CN, OR⁸ ili C₁₋₆ alkil proizvoljno supstituiran s jednim ili više supstituenata
 15 koji su odabrani od halo i OR^{5a}, pri čemu R^{5a} i R⁸ su kako je definirano u zahtjevu 1
 proizvoljno pri čemu B predstavlja ^{CYBB} ili Het^{BB} skupinu, navedena skupina je ili nesupstituirana ili je supstituirana
 s fluoro na 4-položaju u odnosu na točku vezanja na triazinski prsten.
9. Spoj s formulom lyd kako je definirano u bilo kojem od zahtjeva 1 do 7 **naznačen time** da je za uporabu za
 liječenje stanja ili poremećaja koji se može poboljšati inhibicijom A1 receptora ili A2a receptora pri čemu stanje ili
 20 poremećaj su odabrani od: zastoja srca; zatajenja bubrega; edema; raka; dijabetesa; proljeva; makularne
 degeneracije; depresije; bolesti kognitivnih funkcija; neurodegenerativne bolesti; poremećaja povezanog s
 pozornošću; ekstra piramidalnog sindroma; poremećaja abnormalnih pokreta; ciroze; fibroze jetre; masne jetre;
 dermalne fibroze; poremećaja spavanja; moždanog udara; ozljede mozga ili neuroupale; te ovisničkog ponašanja.
10. Uporaba spoja s formulom lyd kako je definirano u bilo kojem od zahtjeva 1 do 7 **naznačena time** da je za
 25 proizvodnju lijeka za liječenje stanja ili poremećaja koji se može poboljšati inhibicijom A1 receptora ili A2a
 receptora pri čemu stanje ili poremećaj je odabrano od: zastoja srca; zatajenja bubrega; edema; raka; dijabetesa;
 proljeva; makularne degeneracije; depresije; bolesti kognitivnih funkcija; neurodegenerativne bolesti; poremećaja
 povezanog s pozornošću; ekstra piramidalnog sindroma; poremećaja abnormalnih pokreta; ciroze; fibroze jetre;
 30 masne jetre; dermalne fibroze; poremećaja spavanja; moždanog udara; ozljede mozga ili neuroupale; te ovisničkog
 ponašanja.
11. Uporaba prema zahtjevu 10, ili spoj za uporabu prema zahtjevu 9, **naznačeni time** da stanje ili poremećaj koji
 poboljšava inhibicijom A2a receptora i je odabrano od depresije; bolesti kognitivnih funkcija; neurodegenerativne
 bolesti; poremećaja povezanog s pozornošću; ekstra piramidalnog sindroma; poremećaja abnormalnih pokreta;
 35 ciroze; fibroze jetre; masne jetre; dermalne fibroze; poremećaja spavanja; moždanog udara; ozljede mozga ili
 neuroupale; te ovisničkog ponašanja.
12. Uporaba prema zahtjevu 10 ili zahtjevu 11, ili spoj za uporabu prema zahtjevu 9 ili zahtjevu 11, **naznačeni time** da
 stanje ili poremećaj je migrena.
13. Uporaba prema zahtjevu 10 ili zahtjevu 11, ili spoj za uporabu prema zahtjevu 9 ili zahtjevu 11, **naznačeni time** da
 40 neurodegenerativna bolest je Parkinsonova bolest, Huntingtonova bolest, Alzheimerova bolest ili amiotrofična
 lateralna skleroza.
14. Uporaba, ili spoj za uporabu prema zahtjevu 13, **naznačeni time** da stanje ili poremećaj koji se može poboljšati
 inhibicijom A2a receptor je Parkinsonova bolest.
15. Uporaba prema zahtjevu 10 ili zahtjevu 11, ili spoj za uporabu prema zahtjevu 9 ili zahtjevu 11, **naznačeni time** da
 stanje ili poremećaj koji se može poboljšati inhibicijom A2a receptor je ovisno ponašanje ili ADHD.
- 45 16. Spoj za uporabu prema zahtjevu 9 ili zahtjevu 11, ili uporaba prema zahtjevu 10 ili zahtjevu 11, **naznačeni time** da
 stanje ili poremećaj koji se može poboljšati inhibicijom A1 receptor je ublažavanje oštećenja bubrega uzrokovanog
 akutnim zatajenjem bubrega, edem, zatajenje srca, kronična bolest bubrega i/ili ciroza.
17. Spoj s formulom lyd kako je definirano u bilo kojem od zahtjeva 1 do 7 **naznačena time** da je za uporabu za
 50 ublažavanje oštećenja bubrega uzrokovanog akutnim zatajenjem bubrega, edema, zatajenja srca, kronične bolesti
 bubrega i/ili ciroze.
18. Uporaba spoja s formulom lyd kako je definirano u bilo kojem od zahtjeva 1 do 7 **naznačen time** da je za
 proizvodnju lijeka za ublažavanje oštećenja bubrega uzrokovanog akutnim zatajenjem bubrega, edema, zatajenja
 srca, kronične bolesti bubrega i/ili ciroze.
19. Spoj s formulom lyd kako je zatraženo u bilo kojem od zahtjeva 1 do 7 **naznačen time** da je za uporabu u medicini.
- 55 20. Farmaceutska formulacija **naznačena time** da sadrži spoj s formulom lyd kako je definirano u bilo kojem od
 zahtjeva 1 do 7 u smjesi sa farmaceutski prihvatljivim pomoćnim sredstvom, sredstvom za razrjeđivanje ili
 nosačem.
21. Postupak za pripremu spoja s formulom lyd kako je definirano u bilo kojem od zahtjeva 1 do 7, **naznačen time** da
 60 postupak sadrži:
 (i)
 (a) reakciju spoja s formulom III,

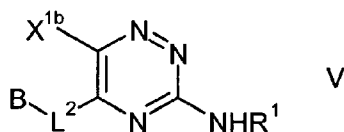


pri čemu L^{x1a} predstavlja halogenid metala, -Sn(R^{x1})₃, derivat alkil-ciklotriBOROKSANA, -B(OH)₂, -B(OR^{x1})₂, ili organosilan, pri čemu svaki ovdje navedeni R^{x1} neovisno predstavlja C₁₋₆ alkil skupinu, ili, u slučaju -B(OR^{x1})₂, dvije R^{x1} skupine mogu biti povezane zajedno tako da tvore 4- do 6-članu cikličku skupinu, L² predstavlja izravnu vezu, R¹ predstavlja H, i B je kako je definirano u zahtjevu 1, sa spojem s formulom IV,



pri čemu X^{1a} predstavlja pogodnu izlaznu skupinu, i A predstavlja potrebnu supstituiranu piridin-4-il skupinu kako je definirano u zahtjevu 1;

(b) reakciju spoja s formulom V,



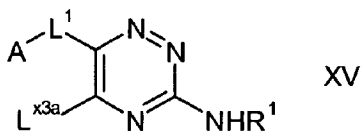
pri čemu X^{1b} predstavlja pogodnu izlaznu skupinu, L² predstavlja izravnu vezu, R¹ predstavlja H, i B je kako je definirano u zahtjevu 1, sa spojem s formulom VI,



pri čemu L^{x1b} predstavlja halogenid metala, -Sn(R^{x1})₃, derivat alkil-ciklotriBOROKSANA, -B(OH)₂, -B(OR^{x1})₂, ili organosilan, pri čemu je svaki R^{x1} kako je gore definirano, te A predstavlja potrebnu supstituiranu piridin-4-il skupinu kako je definirano u zahtjevu 1;

(ii)

(a) reakciju spoja s formulom XV,

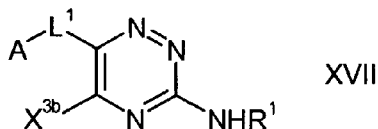


pri čemu L^{x3a} predstavlja halogenid metala, -Sn(R^{x1})₃, derivat alkil-ciklotriBOROKSANA, -B(OH)₂, -B(OR^{x1})₂, ili organosilan, u kojoj je svaki R^{x1} kako je gore definirano, L¹ predstavlja izravnu vezu, R¹ predstavlja H, i A predstavlja potrebnu supstituiranu piridin-4-il skupinu kako je definirano u zahtjevu 1, sa spojem s formulom XVI,



pri čemu X^{3a} predstavlja pogodnu izlaznu skupinu i B je kako je definirano u zahtjevu 1;

(b) reakciju spoja s formulom XVII,

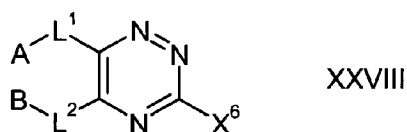


pri čemu X^{3b} predstavlja pogodnu izlaznu skupinu, L¹ predstavlja izravnu vezu, R¹ predstavlja H, i A predstavlja potrebnu supstituiranu piridin-4-il skupinu kako je definirano u zahtjevu 1, sa spojem s formulom XVIII,



pri čemu L^{x3b} predstavlja halogenid metala, -Sn(R^{x1})₃, derivat alkil-ciklotriBOROKSANA, -B(OH)₂, -B(OR^{x1})₂, ili

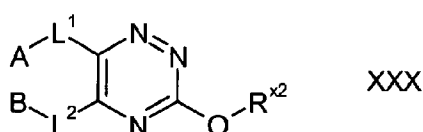
organosilan, u kojoj je svaki R^{x1} kako je gore definirano, i B je kako je definirano u zahtjevu 1;
(iii) reakciju spoja s formulom XXVIII,



pri čemu X^6 predstavlja pogodnu izlaznu skupinu tako da L^1 i L^2 predstavljaju izravne veze, A predstavlja potrebnu supstituiranu piridin-4-il skupinu kako je definirano u zahtjevu 1, i B je kako je definirano u zahtjevu 1, sa spojem s formulom XXIX,



pri čemu R^1 je H;
(iv) reakciju spoja s formulom XXX,



pri čemu R^{x2} predstavlja pogodnu izlaznu skupinu, L^1 i L^2 predstavljaju izravne veze, A predstavlja potrebnu supstituiranu piridin-4-il skupinu kako je definirano u zahtjevu 1, i B je kako je definirano u zahtjevu 1, ili njegov zaštićeni derivat, sa spojem s formulom XXIX, pri čemu R^1 je H;

(v) reakciju spoja s formulom XXXI,

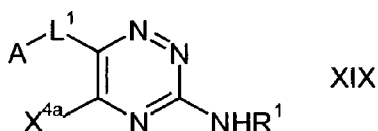


pri čemu A predstavlja potrebnu supstituiranu piridin-4-il skupinu kako je definirano u zahtjevu 1, i B je kako je definirano u zahtjevu 1, sa spojem s formulom XXXII,



pri čemu R^1 je H;

(vii) za spojeve s formulom lyd u kojoj B predstavlja Het^{BB} skupinu koja sadrži dušik koji je vezan preko dušikovog atoma u sklopu sustava prstena, reakciju spoja s formulom XIX,



pri čemu X^{4a} predstavlja pogodnu izlaznu skupinu, L^1 predstavlja izravnu vezu, R^1 predstavlja H, i A predstavlja potrebnu supstituiranu piridin-4-il skupinu kako je definirano u zahtjevu 1, sa spojem s formulom XXXIV,



pri čemu Het^{B1} ima isto značenje kao Het^{BB} kako je definirano iznad, osim što je Het^{B1} heterocikal koji sadrži dušik koji je vezan na H-atom prikazan za spoj s formulom XXXIV preko dušikovog atoma u heterociklu; te

(ix) za spojeve s formulom lyd u kojoj jedan od R^{4b} , R^{4c} i R^{4d} predstavlja -OH, reakciju spoja s formulom lyd u kojoj jedan od R^{4b} , R^{4c} i R^{4d} predstavlja $-OR^{4y}$, pri čemu R^{4y} predstavlja C_{1-6} alkil, C_{2-6} alkenil, C_{2-6} alkinil ili C_{3-6} cikloalkil, navedene skupine su proizvoljno supstituirane s jednim ili više supstituenata koji su odabrani od halo, C_{1-4} alkila i arila, sa sredstvom za dealkiliranje.