



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20131168 T1

HR P20131168 T1

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

(51) MKP:

C07D 205/04 (2006.01)
C07D 413/12 (2006.01)
A61K 31/397 (2006.01)
A61P 1/00 (2006.01)
A61P 3/00 (2006.01)
A61P 9/00 (2006.01)
A61P 29/00 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 03.01.2014.

(21) Broj predmeta: P20131168T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 10.12.2013.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/FR2008001748
Datum podnošenja međunarodne prijave: 16.12.2008.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 08872952.0
Datum podnošenja europske prijave patenta: 16.12.2008.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2009106708
Datum međunarodne objave: 03.09.2009.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2234966 A2
Datum objave europske prijave patenta: 06.10.2010.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2234966 B1
Datum objave europskog patenta: 11.09.2013.

(31) Broj prve prijave: 0708830
0802492

(32) Datum podnošenja prve prijave: 18.12.2007.
06.05.2008.

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

(73) Nositelj patenta:

SANOFI, 54, rue La Boétie, 75008 Paris, FR

(72) Izumitelj:

**Jean-François Sabuco, c/o Sanofi-Aventis, Département Brevets, 174
avenue de France, 75013 Paris, FR**

(74) Zastupnik:

Hraste & Partneri odvjetničko društvo, 10000 Zagreb, HR

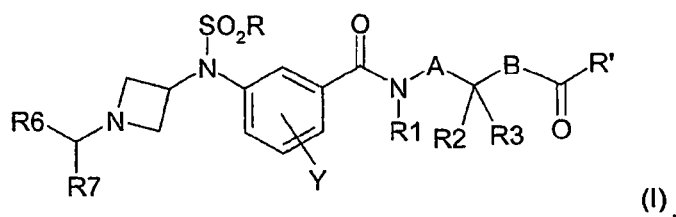
(54) Naziv izuma:

DERIVATI AZETIDINA, NJIHOVO DOBIVANJE I NJIHOVA TERAPIJSKA PRIMJENA

HR P20131168 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Spoj formule (I)



naznačen time što:

R je (C₁-C₆)alkilna ili halogen(C₁-C₆)alkilna skupina;

R' je skupina NR₄R₅ ili OR₈;

A i B, ako su prisutni, su, međusobno neovisno, jedan ili dva atoma ugljika, gdje su ti atomi ugljika supstituirani s jednim ili više vodika ili (C₁-C₆)alkilnih skupina; jedna ili više (C₁-C₆)alkilnih skupina su izborno supstituirane s jednom ili više hidroksilnih, (C₁-C₆)alkoksi, halogen(C₁-C₆)alkilnih skupina, skupina (C₁-C₆)alkilS(O)_p, NR₄R₅ ili CONR₄R₅;

A+B je najviše dva ugljika;

R₁ je atom vodika ili (C₁-C₆)alkilna skupina;

R₂ i R₃ su, međusobno neovisno, atom vodika ili (C₁-C₆)alkilna skupina; gdje je (C₁-C₆)alkilna skupina izborno supstituirana s jednom ili više hidroksilnih, (C₁-C₆)alkoksi, halogen(C₁-C₆)alkilnih skupina, skupina (C₁-C₆)alkilS(O)_p, NR₄R₅ ili CONR₄R₅;

R₄ i R₅ su, međusobno neovisno, atom vodika ili (C₁-C₆)alkilna skupina, ili, zajedno s atomom dušika koji ih nosi, tvore heterocikl tipa azetidina, pirolidina, piperidina, azepana, piperazina, homopiperazina, morfolina, tiomorfolina, tiomorfolin-S-oksida ili tiomorfolin-S-dioksida, gdje je taj heterocikl izborno supstituiran s (C₁-C₆)alkilnom skupinom;

svaki od R₆ i R₇ je fenilna skupina, izborno supstituirana s jednim ili više atoma ili skupina, koje se bira između atoma vodika, halogena, te (C₁-C₆)alkilne, halogen(C₁-C₆)alkilne, (C₁-C₆)alkoksi, halogen(C₁-C₆)alkoksi ili cijano skupine;

Y je atom vodika, halogen, ili (C₁-C₆)alkilna, halogen(C₁-C₆)alkilna, (C₁-C₆)alkoksi, halogen(C₁-C₆)alkoksi, (C₁-C₆)alkilS(O)_p ili cijano skupina;

R₈ je atom vodika, (C₁-C₆)alkilna skupina, halogen(C₁-C₆)alkilna skupina, alilna skupina ili fenil(C₁-C₆)alkilna skupina, gdje je fenilna skupina izborno supstituirana s 1 ili 2 O-metilne skupine;

p je cijeli broj, kojeg se bira između 0, 1 ili 2;

u obliku baze ili adicijske soli s kiselinom ili s bazom.

2. Spoj formule (I) u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time što:**

R' je NR₄R₅ ili OR₈;

R je metil;

A i B, ako su prisutni, su, međusobno neovisno, -CH₂-;

R₁ je atom vodika;

R₂ i R₃ su, međusobno neovisno, atom vodika ili (C₁-C₆)alkilna skupina; gdje je (C₁-C₆)alkilna skupina izborno supstituirana s a hidroksilna skupina;

R₄ i R₅ su, međusobno neovisno, atom vodika ili metil, ili, zajedno s atomom dušika koji ih nosi, tvore morfolin;

svaki od R6 i R7 je fenilna skupina, izborna supstituirana s jednim ili više atoma ili skupina, koje se bira između halogena, te (C₁-C₆)alkilne, halogen(C₁-C₆)alkilne, (C₁-C₆)alkoksi, halogen(C₁-C₆)alkoksi ili cijano skupine, u *para*-položaju;

R8 je atom vodika ili (C₁-C₆)alkilna skupina;

Y je vodik, halogen, (C₁-C₆)alkoksi skupina; (C₁-C₆)alkilna skupina; cijano; ili halogen;

u obliku enantiomera ili diastereoizomera ili smjesa tih oblika;

u obliku baze ili adicijske soli s kiselinom ili s bazom.

3. Spoj formule (I) u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što:
R' je NR4R5 ili OR8;

R je metil;

A i B, ako su prisutni, su, međusobno neovisno, -CH₂-;

R1 je atom vodika;

R2 i R3 su, međusobno neovisno, atom vodika ili (C₁-C₆)alkilna skupina; gdje je (C₁-C₆)alkilna skupina izborna supstituirana s hidroksilnom skupinom;

R4 i R5 su, međusobno neovisno, atom vodika ili metil, ili, zajedno s atomom dušika koji ih nosi, tvore morfolin;

svaki od R6 i R7 je fenilna skupina supstituiran s atomom klora, fluora ili broma ili sa skupinom Me, OMe, CN, CF₃ ili OCF₃, u *para*-položaju;

R8 je atom vodika ili (C₁-C₆)alkilna skupina;

Y je vodik, halogen, (C₁-C₆)alkoksi skupina; (C₁-C₆)alkilna skupina; cijano; ili halogen(C₁-C₆)alkilna skupina;

u obliku enantiomera ili diastereoizomera ili smjesa tih oblika;

u obliku baze ili adicijske soli s kiselinom ili s bazom.

4. Spoj formule (I) u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što:
R' je NR4R5 ili OR8;

R je metil;

A i B, ako su prisutni, su, međusobno neovisno, -CH₂-;

R1 je atom vodika;

R2 i R3 su, međusobno neovisno, atom vodika ili (C₁-C₆)alkilna skupina; gdje je (C₁-C₆)alkilna skupina izborna supstituirana s hidroksilnom skupinom;

R4 i R5 su, međusobno neovisno, atom vodika ili metil, ili, zajedno s atomom dušika koji ih nosi, tvore morfolin;

svaki od R6 i R7 je fenilna skupina, izborna supstituirana s jednim ili više atoma ili skupina, koje se bira između halogena, te (C₁-C₆)alkilne, halogen(C₁-C₆)alkilne, (C₁-C₆)alkoksi, halogen(C₁-C₆)alkoksi ili cijano skupine, u *para*-položaju;

R8 je atom vodika ili (C₁-C₆)alkilna skupina;

Y je vodik, atom klora, fluora ili broma ili sa skupinom Me, OMe, CN ili CF₃;

u obliku enantiomera ili diastereoizomera ili smjesa tih oblika;

u obliku baze ili adicijske soli s kiselinom ili s bazom.

5. Spoj formule (I) u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što:
R' je NR4R5 ili OR8;

R je metil;

A i B, ako su prisutni, su, međusobno neovisno, -CH₂-;

R1 je atom vodika;

R2 i R3 su, međusobno neovisno, atom vodika ili (C₁-C₆)alkilna skupina; gdje je (C₁-C₆)alkilna skupina izborno supstituirana s a hidroksilna skupina;

R4 i R5 su, međusobno neovisno, atom vodika ili metil ili, zajedno s atomom dušika koji ih nosi, tvore morfolin;

svaki od R6 i R7 je fenilna skupina supstituiran s atomom klora, fluora ili broma ili sa skupinom Me, OMe, CN, CF₃ ili OCF₃, u *para*-položaju;

R8 je atom vodika ili (C₁-C₆)alkilna skupina;

Y je vodik, atom klora, fluora ili broma ili sa skupinom Me, OMe, CN ili CF₃;

u obliku enantiomera ili diastereoizomera ili smjesa tih oblika;

u obliku baze ili adicijske soli s kiselinom ili s bazom.

6. Spoj formule (I) u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što ga se bira između:

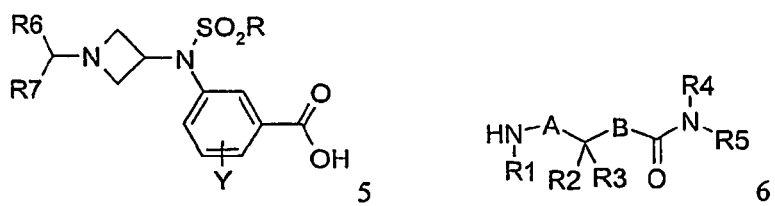
- 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoiletil)benzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-karbamoilmetil-5-fluorbenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoiletil)-5-fluorbenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*R*)-1-karbamoiletil)-5-fluorbenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*R*)-1-karbamoiletil)benzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoil-2-hidroksietil)benzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-(2-karbamoiletil)benzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-(2-morfolin-4-il-2-oksoetil)benzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-metilkarbamoiletil)benzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoilpropil)benzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoil-3-metilbutil)benzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoil-2-metilpropil)-5-fluorbenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoil-2-hidroksietil)-5-fluorbenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoilpropil)-5-fluorbenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-(metilkarbamoilmetil)benzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-(karbamoilmetil)benzamida
tert-butilnog estera (*S*)-2-[3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)benzoilamino]propionske kiseline
 (*S*)-2-[3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)benzoilamino]propionske kiseline
tert-butilnog estera 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)benzoilaminooctene kiseline
tert-butilnog estera 4-[3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-fluorbenzoilamino]maslačne kiseline
tert-butilnog estera (*S*)-2-[3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-fluorbenzoilamino]propionske kiseline
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoiletil)-5-metoksibenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-dimetilkarbamoiletil)benzamida
tert-butilnog estera 4-[3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)benzoilamino]maslačne kiseline
 (*S*)-2-[3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-fluorbenzoilamino]propionske kiseline i njezine sol s natrijem
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-fluor-*N*-((*S*)-1-metilkarbamoiletil)benzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((1*S*,2*R*)-1-karbamoil-2-hidroksipropil)benzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-(3-karbamoilpropil)-5-fluorbenzamida
 [3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)benzoilamino]octene kiseline
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoiletil)-2-fluorbenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-metilkarbamoiletil)-2-fluorbenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoiletil)-6-fluorbenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoilpropil)-6-fluorbenzamida

- 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoil-2-metilpropil)-6-fluorbenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-metilkarbamoiletil)-6-fluorbenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoilpropil)-4-fluorbenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-karbamoilmetil-5-metilbenzamida
 5 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoiletil)-5-metilbenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoilpropil)-5-metilbenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoil-2-metilpropil)-5-metilbenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-metilkarbamoiletil)-5-metilbenzamida
 10 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoil-2-hidroksietil)-5-metilbenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoiletil)-5-klorbenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoilpropil)-5-klorbenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoil-2-metilpropil)-5-klorbenzamida
 15 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-metilkarbamoiletil)-5-klorbenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoil-2-hidroksietil)-5-klorbenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoiletil)-5-brombenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoilpropil)-5-brombenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoil-2-metilpropil)-5-brombenzamida
 20 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-metilkarbamoiletil)-5-brombenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoil-2-hidroksietil)-5-brombenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-karbamoilmetil-5-trifluormetilbenzamida
 25 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoiletil)-5-trifluormetilbenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoilpropil)-5-trifluormetilbenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoil-2-metilpropil)-5-trifluormetilbenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-metilkarbamoiletil)-5-trifluormetilbenzamida
 30 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoil-2-hidroksietil)-5-trifluormetilbenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoiletil)-5-cijanobenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoilpropil)-5-cijanobenzamida
 35 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoil-2-metilpropil)-5-cijanobenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-metilkarbamoiletil)-5-cijanobenzamida
 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoil-2-hidroksietil)-5-cijanobenzamida
 40 (S)-2-[3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-6-fluorbenzoilamino]propionske kiseline i
 njezine soli s trifluorocetnom kiselinom
 (S)-2-[3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-metilbenzoilamino]propionske kiseline i
 njezine soli s trifluorocetnom kiselinom
 (S)-2-[3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-klorbenzoilamino]propionske kiseline i
 45 njezine soli s trifluorocetnom kiselinom
 (S)-2-[3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-brombenzoilamino]propionske kiseline i
 njezine soli s trifluorocetnom kiselinom
 (S)-2-[3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-3-trifluormetilbenzoilamino]propionske
 kiseline i njezine soli s trifluorocetnom kiselinom
 50 (S)-2-[3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-cijanobenzoilamino]propionske kiseline i
 njezine soli s trifluorocetnom kiselinom
 3-({1-[bis(4-bromfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoiletil)-5-fluorbenzamida
 3-({1-[bis(4-trifluormetilfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoiletil)-5-fluorbenzamida
 3-({1-[bis(4-cijanofenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoiletil)-5-fluorbenzamida
 55 3-({1-[bis(4-metoksifenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoiletil)-5-fluorbenzamida
 3-({1-[bis(4-fluorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoiletil)-5-fluorbenzamida
 metilnog estera (S)-2-[3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-fluorbenzoilamino]propionske kiseline
 3-({1-[bis(4-metilfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-karbamoilpropil)-5-fluorbenzamida
 60 3-({1-[bis(4-bromfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-*N*-((*S*)-1-metilkarbamoiletil)-5-fluorbenzamida
 (S)-2-[3-({1-[bis(4-bromfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-fluorbenzoilamino]propionske kiseline

etilnog estera (S)-2-[3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il}metansulfonilamino)-5-fluorbenzoilamino]propionske kiseline
 3-({1-[bis(4-trifluorometoksifenil)metil]azetidin-3-il}metansulfonilamino)-N-((S)-1-karbamoilpropil)-5-fluorbenzamida

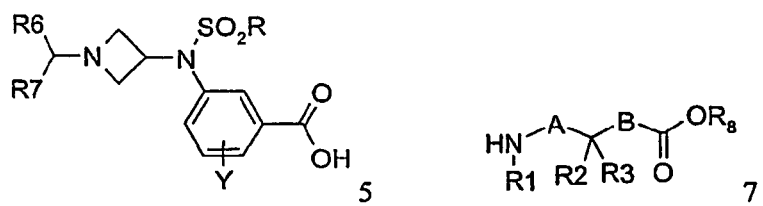
njihovih optičkih izomera i njihovih farmaceutski prihvatljivih soli.

7. Medikament, **naznačen time** što sadrži spoj formule (I) u skladu s u patentnim zahtjevima 1 do 6.
8. Farmaceutski pripravak, **naznačen time** što sadrži spoj formule (I) u skladu s u patentnim zahtjevima 1 do 6.
9. Upotreba spoja formule (I), u skladu s u patentnim zahtjevima 1 do 6, **naznačena time** što je spoj namijenjen pripravi medikamenta za liječenje ili sprječavanje psihijatrijskih poremećaja, ovisnosti i ustezanja od tvari, ustezanje od duhana, kognitivnih i poremećaja pažljivosti, te akutnih i kroničnih neurodegenerativnih bolesti.
10. Upotreba spoja formule (I), u skladu s u patentnim zahtjevima 1 do 6, **naznačena time** što je spoj namijenjen pripravi medikamenta za liječenje ili sprječavanje metaboličkih poremećaja, poremećaja želje, poremećaja teka, pretilosti, dijabetesa, metaboličkog sindroma, dislipidemije i apneje u snu.
11. Upotreba spoja formule (I), u skladu s u patentnim zahtjevima 1 do 6, **naznačena time** što je spoj namijenjen pripravi medikamenta za liječenje ili sprječavanje boli, neuropatske boli i neuropatske boli uzrokovane lijekovima protiv raka.
12. Upotreba spoja formule (I), u skladu s u patentnim zahtjevima 1 do 6, **naznačena time** što je spoj namijenjen pripravi medikamenta za liječenje ili sprječavanje gastrointestinalnih poremećaja, povraćanja, vrieda, proljevnih poremećaja, poremećaja mokraćnog mjehura i mokraćnog sustava, poremećaja endokrinog podrijetla, kardiovaskularnih poremećaja, hipotenzije, hemoragijskog šoka, septičnog šoka, bolesti jetre, kronične ciroza jetre, fibroze, nealkoholnog steatohepatitisa (NASH), steatohepatitisa i steatoze jetre, bez obzira na etiologiju tih stanja (alkohol, medikament, kemijski produkt, autoimuna bolest, pretilost, dijabetes, urođena metabolička bolest).
13. Upotreba spoja formule (I), u skladu s u patentnim zahtjevima 1 do 6, **naznačena time** što je spoj namijenjen pripravi medikamenta za liječenje ili sprječavanje bolesti imunosnog sustava, reumatoidnog artritisa, demijelinacije, multiple skleroze i upalnih bolesti.
14. Upotreba spoja formule (I), u skladu s u patentnim zahtjevima 1 do 6, **naznačena time** što je spoj namijenjen pripravi medikamenta za liječenje ili sprječavanje Alzheimerove bolesti, Parkinsonove bolesti, shizofrenije i kognitivnih poremećaja povezanih sa shizofrenijom, s dijabetesom, s pretilošću ili s metaboličkim sindromom.
15. Upotreba spoja formule (I), u skladu s u patentnim zahtjevima 1 do 6, **naznačena time** što je spoj namijenjen pripravi medikamenta za liječenje ili sprječavanje astme, kroničnih opstruktivnih plućnih bolesti, Raynaudovog sindroma, glaukoma i poremećaja plodnosti.
16. Upotreba spoja formule (I), u skladu s u patentnim zahtjevima 1 do 6, **naznačena time** što je spoj namijenjen pripravi medikamenta za liječenje ili sprječavanje zaraznih i virusnih bolesti, poput encefalitisa, cerebralnih inzulta, Guillain-Barréovog sindroma, osteoporoze i apneje u snu, te kod kemoterapije raka.
17. Postupak dobivanja spojeva formule (I), u kojima je R' NR4R5



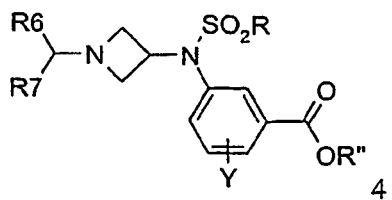
naznačen time što kiselinski derivat 5 i amino derivat 6 reagiraju u inertnom otapalu, u prisutnosti kondenzacijskog sredstva i izborna aditiva za sprječavanje racemizacije, gdje se produkt izdvaja i izborno uz pomoć kiseline prevodi u adicijsku sol.

18. Postupak dobivanja spojeva formule (I), u kojima je R' OR8



naznačen time što kiselinski derivat 5 i amino derivat 7 reagiraju u inertnom otapalu, u prisutnosti kondenzacijskog sredstva i izborna aditiva za sprječavanje racemizacije, gdje se produkt izdvaja i izborno uz pomoć kiseline prevodi u adicijsku sol.

19. Postupak dobivanja spojeva formule (I), u kojima je R' OR8, gdje je R8 H, **naznačen time** što se spojeve dobiva hidrolizom funkcionalne skupine OR8, gdje je R8 (C₁-C₆)alkilna skupina, halogen(C₁-C₆)alkilna skupina, alilna skupina ili fenil(C₁-C₆)alkilna skupina, gdje je fenilna skupina izborno supstituirana s 1 ili 2 O-metilne skupine; gdje se tako hidrolizirani produkt izdvaja i izborno uz pomoć baze prevodi u adicijsku sol.
20. Postupak dobivanja spojeva formule (I), u kojima je R' NR4R5, **naznačen time** što se spojevi dobivaju reakcijom spoja formule (I), u kojem je R' OR8, gdje je R8 H s amino derivatom HNR4R5 u inernom otapalu, u prisutnosti kondenzacijskog sredstva i izborno aditiva za sprječavanje racemizacije, gdje se produkt izdvaja i izborno uz pomoć kiseline prevodi u adicijsku sol.
21. Postupak dobivanja spojeva formule 5, za koje su Y, R, R6 i R7 definirani kao u patentnom zahtjevu 1, **naznačen time** što se spojevi dobivaju hidrolizom esterske funkcionalne skupine u spojevima formule 4, za koje su Y, R, R6 i R7 definirani kao u patentnom zahtjevu 1, a R'' je (C₁-C₆)alkilna skupina, halogen(C₁-C₆)alkilna skupina, alilna skupina ili fenil(C₁-C₆)alkilna skupina, gdje je fenilna skupina izborno supstituirana s 1 ili 2 O-metilne skupine



22. Međuprodukti, **naznačeni time** što su namijenjeni sintezi spojeva formule (I)
- metilnog estera 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-fluorbenzojeve kiseline
 - metilnog estera 3-({1-[bis(4-fluorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-fluorbenzojeve kiseline
 - 3-({1-[bis(4-fluorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-fluorbenzojeve kiseline
 - etilnog estera 3-({1-[bis(4-bromfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-fluorbenzojeve kiseline
 - 3-({1-[bis(4-bromfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-fluorbenzojeve kiseline
 - etilnog estera 3-({1-[bis(4-trifluormetilfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-fluorbenzojeve kiseline
 - 3-({1-[bis(4-trifluormetilfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-fluorbenzojeve kiseline
 - etilnog estera 3-({1-[bis(4-metoksifenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-fluorbenzojeve kiseline
 - 3-({1-[bis(4-metoksifenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-fluorbenzojeve kiseline
 - metilnog estera 3-({1-[bis(4-metilfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-fluorbenzojeve kiseline
 - 3-({1-[bis(4-metilfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-fluorbenzojeve kiseline
 - etilnog estera 3-({1-[bis(4-cijanofenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-fluorbenzojeve kiseline
 - 3-({1-[bis(4-cijanofenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-fluorbenzojeve kiseline
 - metilnog estera 3-({1-[bis(4-trifluormetoksifenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-fluorbenzojeve kiseline
 - 3-({1-[bis(4-trifluormetoksifenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-fluorbenzojeve kiseline
 - metilnog estera 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-2-fluorbenzojeve kiseline
 - 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-2-fluorbenzojeve kiseline
 - etilnog estera 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-4-fluorbenzojeve kiseline
 - 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-4-fluorbenzojeve kiseline
 - metilnog estera 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-6-fluorbenzojeve kiseline
 - 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-6-fluorbenzojeve kiseline
 - metilnog estera 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-metoksibenzojeve kiseline
 - 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-metoksibenzojeve kiseline
 - alilnog estera 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-metilbenzojeve kiseline
 - 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-metilbenzojeve kiseline
 - metilnog estera 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-klorbenzojeve kiseline
 - 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-klorbenzojeve kiseline
 - metilnog estera 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-brombenzojeve kiseline
 - 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-brombenzojeve kiseline
 - metilnog estera 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-trifluormetilbenzojeve kiseline
 - 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-trifluormetilbenzojeve kiseline
 - metilnog estera 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-cijanobenzojeve kiseline
 - 3-({1-[bis(4-klorfenil)metil]azetidin-3-il} metansulfonilamino)-5-cijanobenzojeve kiseline.