



(19) REPUBLIKA HRVATSKA  
DRŽAVNI ZAVOD ZA  
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator  
dokumenta:



HR P20250154 T1

HR P20250154 T1

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

(51) MKP:

**A61P 37/00** (2006.01)  
**A61K 31/416** (2006.01)  
**A61K 31/401** (2006.01)  
**C07D 401/14** (2006.01)  
**C07D 403/14** (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 11.04.2025.

(21) Broj predmeta: P20250154T

(22) Datum podnošenja : 25.02.2015.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 22193148.8  
Datum podnošenja europske prijave patenta: 25.02.2015.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 4129407 A1  
Datum objave europske prijave patenta: 08.02.2023.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 4129407 B1  
Datum objave europskog patenta: 25.12.2024.

(31) Broj prve prijave: 201461944189 P

(32) Datum podnošenja prve prijave: 25.02.2014.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

201462022916 P 10.07.2014. US

201462046783 P 05.09.2014. US

(62) Broj i datum prvobitne prijave u slučaju podjele patenta: 15755617.6 25.2.2015. (62) Broj i datum prvobitne prijave u slučaju podjele patenta: 19206925.0 25.2.2015.

(73) Nositelj patenta:

**Achillion Pharmaceuticals, Inc., 121 Seaport Blvd., Boston, MA 02210, US**

(72) Izumitelji:

**Venkat Rao Gadhachanda, Boston, MA 02210, US**

**Qiuping Wang, Boston, MA 02210, US**

**Godwin Pais, Boston, MA 02210, US**

**Akihiro Hashimoto, Boston, MA 02210, US**

**Dawei Chen, Boston, MA 02210, US**

**Xiangzhu Wang, Boston, MA 02210, US**

**Atul Ararwal, Boston, MA 02210, US**

**Milind Deshpande, Boston, MA 02210, US**

**Jason Allan Wiles, Boston, MA 02210, US**

**Avinash S. Phadke, Boston, MA 02210, US**

(74) Zastupnik:

**PRODUCTA d.o.o., 10000 Zagreb, HR**

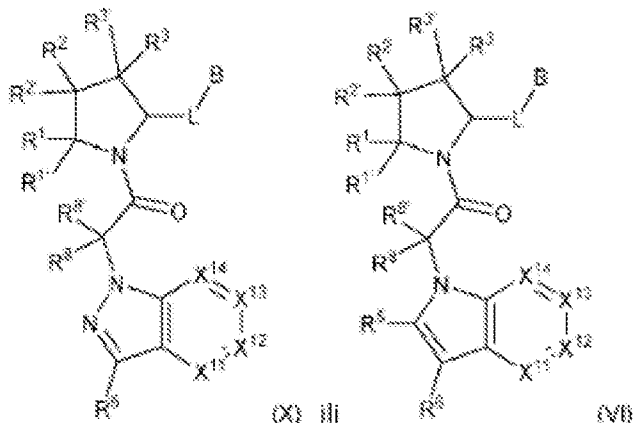
(54) Naziv izuma:

**ARILNI, HETEROARILNI I HETEROCIKLIČKI SPOJEVI ZA LIJEČENJE POREMEĆAJA  
POSREDOVANIH KOMPLEMENTOM**

HR P20250154 T1

## PATENTNI ZAHTJEVI

## 1. Spoj formule



ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, pri čemu:

$R^1$ ,  $R^{1'}$ ,  $R^2$ ,  $R^{2'}$ ,  $R^3$ , i  $R^{3'}$  su neovisno odabrani od vodika, halogena, hidroksila, nitro, cijano, amino,  $C_1$ - $C_6$ alkila,  $C_2$ - $C_6$ alkenila,  $C_2$ - $C_6$ alkinila,  $C_1$ - $C_6$ alkoksi,  $C_2$ - $C_6$ alkinila,  $C_2$ - $C_6$ alkanoila,  $C_1$ - $C_6$ tioalkila, hidroksi $C_1$ - $C_6$ alkila, amino $C_1$ - $C_6$ alkila,  $-C(O)C_4alkilNR^9R^{10}$ ,  $-C(O)OR^9$ ,  $-OC(O)R^9$ ,  $-NR^9C(O)R^{10}$ ,

$-C(O)NR^9R^{10}$ ,  $-OC(O)NR^9R^{10}$ ,  $-NR^9C(O)OR^{10}$ ,  $C_1$ - $C_2$ haloalkila, i  $C_1$ - $C_2$ haloalkoksi, gdje  $R^9$  i  $R^{10}$  neovisno su odabrani pri svakoj pojavi od vodika,  $C_1$ - $C_6$ alkila,  $(C_3$ - $C_7$ cikloalkil) $C_0$ - $C_4$ alkila,  $-C_0$ - $C_4$ alkil( $C_3$ - $C_7$ cikloalkil), i  $-O$ - $C_0$ - $C_4$ alkil( $C_3$ - $C_7$ cikloalkila);

ili  $R^1$  i  $R^2$  mogu se uzeti zajedno da tvore 3-člani karbociklički prsten, ili 4- do 6-eročlani karbociklički ili arilni prsten ili 4- do 6-eročlani heterociklički ili heteroarilni prsten koji sadrži 1 ili 2 heteroatoma neovisno odabrana između N, O, ili S;

ili  $R^2$  i  $R^3$  iz 3- do 6-eročlanog karbocikličkog ili arilnog prstena ili 3- do 6-eročlanog heterocikličkog ili heteroarilnog prstena;

ili  $R^1$  i  $R^{1'}$ , ili  $R^2$  i  $R^{2'}$ , ili  $R^3$  i  $R^{3'}$  tvore 3- do 6-eročlani karbociklički spiro prsten;

ili  $R^1$  i  $R^{1'}$ , ili  $R^3$  i  $R^{3'}$  tvore 3- do 6-eročlani heterociklički spiro prsten koji sadrži 1 ili 2 heteroatoma neovisno odabrana između N, O, ili S; ili  $R^2$  i  $R^{2'}$  tvore 3- do 6-eročlani heterociklički spiro prsten,

od kojih je svaki prsten nesupstituiran ili supstituiran s 1 ili više supstituenata neovisno odabranih iz niza koji sadrži halogen, hidroksil, cijano,  $-COOH$ ,  $C_1$ - $C_4$ alkil,  $C_2$ - $C_4$ alkenil,  $C_2$ - $C_4$ alkinil,  $C_1$ - $C_4$ alkoksi,  $C_2$ - $C_4$ alkanoil, hidroksi $C_1$ - $C_4$ alkil, (mono- i di- $C_1$ - $C_4$ alkilamino) $C_0$ - $C_4$ alkil,  $-C_0$ - $C_4$ alkil( $C_3$ - $C_7$ cikloalkil),

$-O$ - $C_0$ - $C_4$ alkil( $C_3$ - $C_7$ cikloalkil),  $C_1$ - $C_2$ haloalkil, i  $C_1$ - $C_2$ haloalkoksi;

ili  $R^1$  i  $R^{1'}$ ,  $R^2$  i  $R^{2'}$ , ili  $R^3$  i  $R^{3'}$  tvore karbonilnu skupinu;

ili  $R^1$  i  $R^2$  ili  $R^2$  i  $R^3$  tvore dvostruku vezu ugljik-ugljik;

$R^5$  i  $R^6$  su neovisno odabrani iz niza koji sadrži  $-CHO$ ,  $-C(O)NH_2$ ,  $-C(O)NH(CH_3)$ ,  $C_2$ - $C_6$ alkanoil, vodik, hidroksil, halogen, cijano, nitro,  $-SO_2NH_2$ , vinil,  $C_1$ - $C_6$ alkil,  $C_2$ - $C_6$ alkenil,  $C_1$ - $C_6$ alkoksi,  $-C_0$ - $C_4$ alkil( $C_3$ - $C_7$ cikloalkil),  $-C(O)C_0$ - $C_4$ alkil( $C_3$ - $C_7$ cikloalkil),  $-P(O)(OR^9)_2$ ,  $-OC(O)R^9$ ,  $-C(O)OR^9$ ,  $-C(O)N(CH_2CH_2R^9)(R^{10})$ ,  $-NR^9C(O)R^{10}$ , fenil, ili 5- do 6-eročlani heteroaril; i pri čemu svaki  $R^5$  i  $R^6$  osim vodika, hidroksila, cijano, i  $-COOH$  je nesupstituiran ili izborno supstituiran;

$R^8$  i  $R^{8'}$  su neovisno odabrani od vodika, halogena, hidroksila,  $C_1$ - $C_6$ alkila,  $-C_0$ - $C_4$ alkil( $C_3$ - $C_7$ cikloalkila),  $C_1$ - $C_6$ alkoksi, i  $(C_1$ - $C_4$ alkilamino) $C_0$ - $C_2$ alkila; ili  $R^8$  i  $R^{8'}$  su uzeti zajedno da tvore okso skupinu; ili  $R^8$  i  $R^{8'}$  mogu se uzeti zajedno s ugljikom za koji su vezani da tvore 3-člani karbociklički prsten;

$X^{11}$  je N ili  $CR^{11}$ ;

$X^{12}$  je N ili  $CR^{12}$ ;

$X^{13}$  je N ili  $CR^{13}$ ;

$X^{14}$  je N ili  $CR^{14}$ , i pri čemu ne više od dva  $X^{11}$ ,  $X^{12}$ ,  $X^{13}$ , i  $X^{14}$  su N;

jedan od  $R^{12}$  i  $R^{13}$  je H i drugi od  $R^{12}$  i  $R^{13}$  je  $R^{32}$ , pri čemu je najmanje jedan od  $R^{12}$  i  $R^{13}$  prisutan i odabran je od  $R^{32}$ ;

$R^{32}$  je odabran od arila; zasićenog ili nezasićenog heterocikla s 5-6 članova koji ima 1, 2 ili 3 heteroatoma neovisno odabrana iz niza koji sadrži N, O, i S, pri čemu je heterocikl vezan preko atoma ugljika u heterocikličkom prstenu na atom ugljika u položaju  $R^{12}$  ili  $R^{13}$ ; i 5-6 člani heteroaril koji ima 1, 2, ili 3 heteroatoma neovisno odabrana iz niza koji sadrži N, O, i S, pri čemu arilni, heterociklički ili heteroarilni prsten može biti po izboru supstituiran;

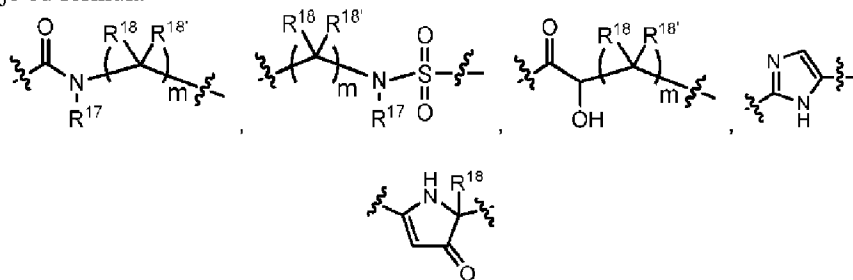
$R^{11}$  i  $R^{14}$  neovisno su odabrani pri svakoj pojavi od vodika, halogena, hidroksila, nitro, cijano,  $-O(PO)(OR^9)_2$ ,  $-(PO)(OR^9)_2$ ,  $C_1$ - $C_6$ alkila,  $C_2$ - $C_6$ alkenila,  $C_2$ - $C_6$ alkinila,  $C_2$ - $C_6$ alkanoila,  $C_1$ - $C_6$ alkoksi,  $C_1$ - $C_6$ tioalkila,  $-C_0$ - $C_4$ alkil(mono- i di- $C_1$ - $C_6$ alkilamino),  $-C_0$ - $C_4$ alkil( $C_3$ - $C_7$ cikloalkil),  $-C_0$ - $C_4$ alkoksi( $C_3$ - $C_7$ cikloalkil),  $C_1$ - $C_2$ haloalkila, i  $C_1$ - $C_2$ haloalkoksi;

$R^{21}$  i  $R^{22}$  neovisno su odabrani pri svakoj pojavi od vodika, hidroksila, cijano, amino,  $C_1$ - $C_6$ alkila,  $C_1$ - $C_6$ haloalkila,  $C_1$ - $C_6$ alkoksi,  $(C_3$ - $C_7$ cikloalkil) $C_0$ - $C_4$ alkila, (fenil) $C_0$ - $C_4$ alkila,  $-C_1$ - $C_4$ alkilOC(O)OC $_1$ - $C_6$ alkila,  $-C_1$ - $C_4$ alkilOC(O) $C_1$ - $C_6$ alkila,  $-C_1$ - $C_4$ alkilC(O)OC $_1$ - $C_6$ alkila, (4- do 7-članog heterocikloalkil) $C_0$ - $C_4$ alkila koji ima 1, 2, ili 3 heteroatoma neovisno odabrana iz niza koji sadrži N, O, i S, i (5- ili 6-eročlanog nezasićenog ili aromatskog heterocikličkog) $C_0$ - $C_4$ alkila koji ima 1, 2, ili 3 heteroatoma neovisno odabrana iz niza koji sadrži N, O, i S, i svaki  $R^{21}$  i  $R^{22}$  se može po izboru supstituirati;

$R^{23}$  je neovisno odabran pri svakoj pojavi iz niza koji sadrži  $C_1$ - $C_6$ alkil,  $C_1$ - $C_6$ haloalkil, (aril) $C_0$ - $C_4$ alkil,  $(C_3$ - $C_7$ cikloalkil) $C_0$ - $C_4$ alkil, (fenil) $C_0$ - $C_4$ alkil, (4- do 7-člani heterocikloalkil) $C_0$ - $C_4$ alkil koji ima 1, 2, ili 3 heteroatoma neovisno odabrana iz niza koji sadrži N, O, i S, i (5- ili 6- člani nezasićeni ili aromatski heterocikal) $C_0$ - $C_4$ alkil koji ima 1, 2, ili 3 heteroatoma neovisno odabrana iz niza koji sadrži N, O, i S, a svaki  $R^{23}$  se može po izboru supstituirati;

$R^{24}$  i  $R^{25}$  su uzeti zajedno s dušikom na koji su vezani da tvore 4- do 7-članu monocikličku heterocikloalkilnu skupinu, ili 6- do 10-eročlanu bicikličku heterocikličku skupinu koja ima kondenzirane, spiro ili premoštene prstenove, i svaki  $R^{24}$  i  $R^{25}$  se može po izboru supstituirati;

L odabran je od formula



ili je veza, pri čemu  $R^{17}$  je vodik,  $C_1$ - $C_6$ alkil, ili  $-C_0$ - $C_4$ alkil( $C_3$ - $C_7$ cikloalkil);  $R^{18}$  i  $R^{18'}$  su neovisno odabrani od vodika, halogena, hidroksimetila, i metila; i m je 0, 1, 2, ili 3;

B je monociklička ili biciklička karbociklička; monociklička ili biciklička karbociklička-oksi skupina; monociklička, biciklička, ili triciklička heterociklička skupina koja ima 1, 2, 3, ili 4 heteroatoma neovisno odabrana iz niza koji sadrži N, O, i S i od 4 do 7 atoma prstena po prstenu;  $C_2$ - $C_6$ alkenil;  $C_2$ - $C_6$ alkinil;  $-(C_0$ - $C_4$ alkil)(aril);  $-(C_0$ - $C_4$ alkil)(heteroaril); ili  $-(C_0$ - $C_4$ alkil)(bifenil) od kojih je svaki B nesupstituiran ili supstituiran s jednim ili više supstituenata neovisno odabranih iz niza koji sadrži  $R^{33}$  i  $R^{34}$ , i 0 ili 1 supstituenta izabranog od  $R^{35}$  i  $R^{36}$ ;

$R^{33}$  je neovisno odabranih iz niza koji sadrži halogen, hidroksil,  $-COOH$ , cijano,  $C_1$ - $C_6$ alkil,  $C_2$ - $C_6$ alkanoil,  $C_1$ - $C_6$ alkoksi,  $-C_0$ - $C_4$ alkilNR $^9$ R $^{10}$ ,  $-SO_2$ R $^9$ ,  $C_1$ - $C_2$ haloalkil, i  $C_1$ - $C_2$ haloalkoksi;

$R^{34}$  je neovisno odabranih iz niza koji sadrži nitro,  $C_2$ - $C_6$ alkenil,  $C_2$ - $C_6$ alkinil,  $C_1$ - $C_6$ tioalkil,  $-JC_3$ - $C_7$ cikloalkil,  $-B(OH)_2$ ,  $-JC(O)NR^9R^{23}$ ,  $-JOSO_2OR^{21}$ ,  $-C(O)(CH_2)_{1-4}S(O)R^{21}$ ,  $-O(CH_2)_{1-4}S(O)NR^{21}R^{22}$ ,  $-JOP(O)(OR^{21})(OR^{22})$ ,  $-JP(O)(OR^{21})(OR^{22})$ ,  $-JOP(O)(OR^{21})R^{22}$ ,  $-JP(O)(OR^{21})R^{22}$ ,  $-JOP(O)R^{21}R^{22}$ ,  $-JP(O)R^{21}R^{22}$ ,  $-JSP(O)(OR^{21})(OR^{22})$ ,  $-JSP(O)(OR^{21})(R^{22})$ ,  $-JSP(O)(R^{21})(R^{22})$ ,  $-JNR^9P(O)(NHR^{21})(NHR^{22})$ ,  $-JNR^9P(O)(OR^{21})(NHR^{22})$ ,  $-JNR^9P(O)(OR^{21})(OR^{22})$ ,  $-JC(S)R^{21}$ ,  $-JNR^{21}SO_2R^{22}$ ,  $-JNR^9S(O)NR^{10}R^{22}$ ,  $-JNR^9SO_2NR^{10}R^{22}$ ,  $-JSO_2NR^9COR^{22}$ ,  $-JSO_2NR^9CONR^{21}R^{22}$ ,  $-JNR^{21}SO_2R^{22}$ ,  $-JC(O)NR^{21}SO_2R^{22}$ ,  $-JC(NH_2)NR^{22}$ ,  $-JC(NH_2)NR^9S(O)_2R^{22}$ ,  $-JOC(O)NR^{21}R^{22}$ ,  $-JNR^{21}C(O)OR^{22}$ ,  $-JNR^{21}OC(O)R^{22}$ ,  $-(CH_2)_{1-4}C(O)NR^{21}R^{22}$ ,  $-JC(O)NR^{24}R^{25}$ ,  $-JNR^9C(O)R^{21}$ ,  $-JC(O)R^{21}$ ,  $-JNR^9C(O)NR^{10}R^{22}$ ,  $-CCR^{21}$ ,  $-(CH_2)_{1-4}OC(O)R^{21}$ , i  $-JC(O)OR^{23}$ ; koji svaki  $R^{34}$  može biti nesupstituiran ili supstituiran s jednim ili više supstituenata neovisno odabranih iz niza koji sadrži halogen, hidroksil, nitro, cijano, amino, okso,  $-B(OH)_2$ ,  $-Si(CH_3)_3$ ,  $-COOH$ ,  $-CONH_2$ ,  $-P(O)(OH)_2$ ,  $C_1$ - $C_6$ alkil,  $-C_0$ - $C_4$ alkil( $C_3$ - $C_7$ cikloalkil),  $C_1$ - $C_6$ alkoksi,  $-C_0$ - $C_2$ alkil(mono- i di- $C_1$ - $C_4$ alkilamino),  $C_1$ - $C_6$ alkilester,  $C_1$ - $C_4$ alkilamino,  $C_1$ - $C_4$ hidroksilalkil,  $C_1$ - $C_2$ haloalkil, i  $C_1$ - $C_2$ haloalkoksi;

$R^{35}$  je neovisno odabranih iz niza koji sadrži naftil, naftiloksi, indanil, (4- do 7-člani heterocikloalkil) $C_0$ - $C_4$ alkil koji sadrži 1 ili 2 heteroatoma odabrana od N, O, i S, i biciklički heterocikal koji sadrži 1, 2, ili 3 heteroatoma neovisno odabrana iz niza koji sadrži N, O, i S, i koji sadrži 4- do 7- atoma u prstenu u svakom prstenu; od kojih je svaki  $R^{35}$  nesupstituiran ili supstituiran s jednim ili više supstituenata neovisno odabranih iz niza koji sadrži halogen, hidroksil, nitro, cijano,  $C_1$ - $C_6$ alkil,  $C_2$ - $C_6$ alkenil,  $C_2$ - $C_6$ alkanoil,  $C_1$ - $C_6$ alkoksi, (mono- i di- $C_1$ - $C_6$ alkilamino) $C_0$ - $C_4$ alkil,  $C_1$ - $C_6$ alkilester,  $-C_0$ - $C_4$ alkil( $C_3$ - $C_7$ cikloalkil),  $-SO_2$ R $^9$ ,  $C_1$ - $C_2$ haloalkil, i  $C_1$ - $C_2$ haloalkoksi; i

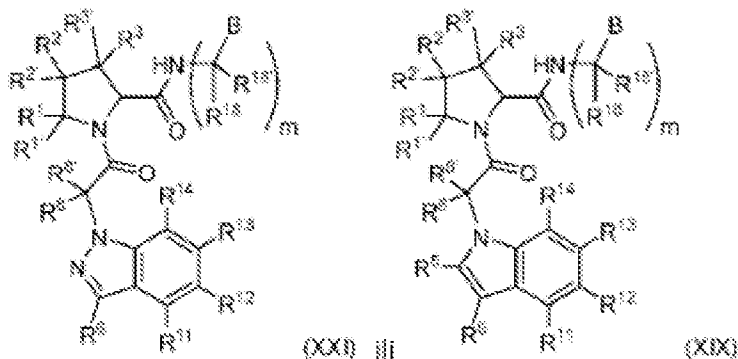
$R^{36}$  je neovisno odabranih iz niza koji sadrži tetrazolil, (fenil) $C_0$ - $C_2$ alkil, (fenil) $C_1$ - $C_2$ alkoksi, fenoksi, i 5- ili 6-eročlani heteroaril koji sadrži 1, 2, ili 3 heteroatoma neovisno odabranih iz niza koji sadrži N, O, B, i S, od kojih je svaki  $R^{36}$  nesupstituiran ili supstituiran s jednim ili više supstituenata neovisno odabranih iz niza koji sadrži halogen, hidroksil, nitro, cijano,  $C_1$ - $C_6$ alkil,  $C_2$ - $C_6$ alkenil,  $C_2$ - $C_6$ alkanoil,  $C_1$ - $C_6$ alkoksi, (mono- i di- $C_1$ - $C_6$ alkilamino) $C_0$ - $C_4$ alkil,  $C_1$ - $C_6$ alkilester,  $-C_0$ - $C_4$ alkil( $C_3$ - $C_7$ cikloalkil),  $-SO_2$ R $^9$ ,  $-OSi(CH_3)_2C(CH_3)_3$ ,  $-Si(CH_3)_2C(CH_3)_3$ ,  $C_1$ - $C_2$ haloalkil, i  $C_1$ - $C_2$ haloalkoksi; i

J je neovisno odabran pri svakom pojavljivanju od kovalentne veze,  $C_1$ - $C_4$ alkilena,  $-OC_1$ - $C_4$ alkilena,  $C_2$ - $C_4$ alkenilena, i  $C_2$ - $C_4$ alkinilena;

pri čemu, osim ako nije drugačije navedeno, bilo koja skupina koja je izborno supstituirana može biti neovisno supstituirana s jednim ili više sljedećih halogenom; cijano; hidroksilom; nitro; azido; alkanoilom; karboksamidom; alkilom; cikloalkilom; alkenilom; alkinilom; alkoksi; ariloksi kao što je fenoksi; alkiltio uključujući one koji imaju jednu ili više tioeterskih veza; alkilsulfamilom; alkilsulfonilne skupine uključujući one koje imaju jednu ili više sulfonilnih veza; aminoalkilne skupine uključujući skupine koje imaju jedan ili više N atoma; arilom; arilalkilom koji ima 1 do 3 odvojena ili kondenzirana prstena i od 6 do oko 14 ili 18 atoma ugljika u prstenu; arilalkoksi koji ima 1 do 3 odvojena ili kondenzirana prstena; ili zasićena, nezasićena ili aromatska heterociklička skupina koja ima 1 do 3 odvojena ili kondenzirana prstena s jednim ili više N, O ili S atoma; amino; -CHO; -COOH; -CONH<sub>2</sub>; C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkilester; (mono- i di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkilamino)C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>alkil; C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>haloalkil; hidroksiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkil; ester; karbamatom; ureom; sulfonamidom; -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkil(heterociklo); C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkil(heteroarilom); -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkil(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>cikloalkilom); -O-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkil(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>cikloalkilom); B(OH)<sub>2</sub>; fosfatom; fosfonatom; i C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>haloalkoksi,

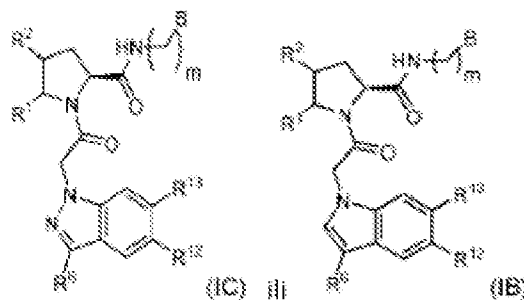
za upotrebu u liječenju poremećaja posredovanog komplementom faktora D kod ljudskog subjekta, pri čemu je poremećaj odabran iz niza koji čine upalni učinci sepse; sindrom sistemskog upalnog odgovora (SIRS); ishemijska/reperfuzijska ozljeda (I/R ozljeda); psorijaza; miastenija gravis; sistemski eritematozni lupus (SLE); paroksizmalna noćna hemoglobinurija (PNH); nasljedni angioedem; multipla skleroza; trauma; ozljeda od opeklina; sindrom kapilarnog curenja; pretilost; dijabetes; Alzheimerova demencija; moždani udar; shizofrenija; epilepsija; makularna degeneracija povezana sa starenjem; glaukom; dijabetička retinopatija; astma; alergija; sindrom akutnog respiratornog distresa (ARDS); atipični hemolitički uremijski sindrom (aHUS); hemolitički uremijski sindrom (HUS); cistična fibroza; infarkt miokarda; lupus nefritidi; Crohnova bolest; reumatoidni artritis; ateroskleroza; odbacivanje transplantata; gubitak fetusa; reakcije biomaterijala; C3 glomerulonefritis; aneurizma abdominalne aorte; optički neuromijelitis (NMO); vaskulitis; neurološki poremećaj; Guillain Barreov sindrom; traumatska ozljeda mozga; Parkinsonova bolest; poremećaj neodgovarajuće ili nepoželjne aktivacije komplementa; komplikacija hemodijalize; hiperakutno odbacivanje alografta; odbacivanje ksenografta; toksičnost izazvana interleukinom-2 tijekom terapije IL-2; upalni poremećaj; upala autoimunih bolesti; sindrom respiratornog distresa kod odraslih; toplinska ozljeda; miokarditis; postishemično reperfuzijsko stanje; balonska angioplastika; post-pump sindrom u kardiopulmonalnoj prenosnici ili bubrežnoj prenosnici; hemodijaliza; ishemijska bubrega; reperfuzija mezenterične arterije nakon rekonstrukcije aorte; poremećaj imunološkog kompleksa; autoimuna bolest; SLE nefritis; proliferativni nefritis; fibroza jetre; hemolitička anemija; regeneracija tkiva; neuralna regeneracija; dispneja; hemoptiza; kronična opstruktivna plućna bolest (KOPB); emfizem; plućna embolija i infarkt; upala pluća; bolest koju izaziva fibrogena prašina; plućna fibroza; bolest koju izaziva organska prašina; kemijska ozljeda; ozljeda od dima; toplinska ozljeda; bronhokonstrikcija; pneumonitis izazvan preosjetljivošću; a parazitska bolest; Goodpastureov sindrom; plućni vaskulitis; Pauci-imuni vaskulitis; upala povezana s imunološkim kompleksom; uveitis; antifosfolipidni sindrom; artritis; autoimuna bolest srca; upalne bolesti crijeva; Barraquer-Simonsov sindrom; hemodijaliza; sistemski lupus; eritematozni lupus; transplantacija; bolest središnjeg živčanog sustava ili neurodegenerativno stanje; glomerulonefritis; kožna bolest s mjehurićima; očni ožiljni pemfigoid; MPGN II; makularna degeneracija kod odraslih; dijabetička retinopatija; retinitis pigmentosa; makularni edem; Behcetov uveitis; multifokalni koroiditis; Vogt-Koyanagi-Harada sindrom; intermedijarni uveitis; birdshot retino-koroiditis; simpatička oftalmija; očni dikatricijalni pemfigoid; očni pemfigus; neareritička ishemijska optička neuropatija; postoperativna upala; okluzija vene mrežnice; degeneracija mrežnice, oftalmološka bolest, poželjno geografska atrofija; respiratorna bolest; i kardiovaskularna bolest.

2. Spoj za upotrebu prema zahtjevu 1, naznačen time što X<sup>12</sup> je CR<sup>12</sup> i X<sup>13</sup> je OR<sup>13</sup>.
3. Spoj za upotrebu prema zahtjevu 1 formule:



naznačen time što m je 0 ili 1;  
ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

4. Spoj za upotrebu prema zahtjevu 1 formule:



ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

5. Spoj za upotrebu prema bilo kojem od zahtjeva 1-4, naznačen time što:

a)  $R^1$ ,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  i  $R^3$ , ako su prisutni, su svi vodik i  $R^2$  je fluor; ili

b)  $R^1$  i  $R^2$  uzeti zajedno tvore 3- do 6-eročlanu cikloalkilnu skupinu i  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  i  $R^3$ , gdje su prisutni, su svi vodik.

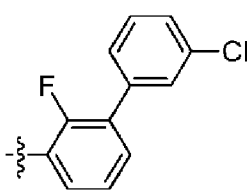
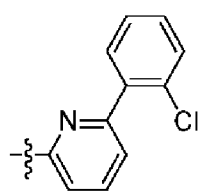
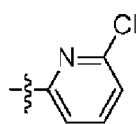
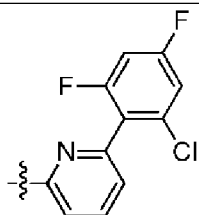
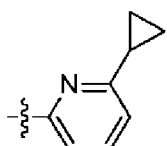
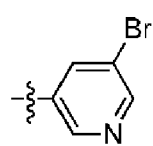
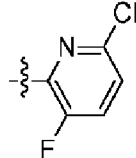
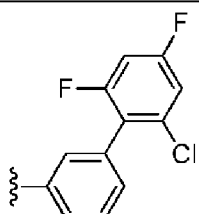
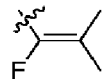
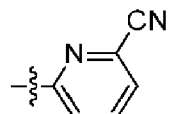
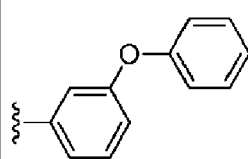
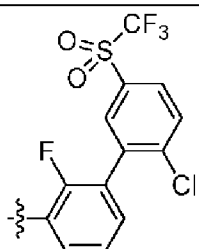
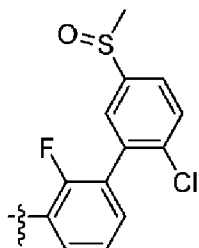
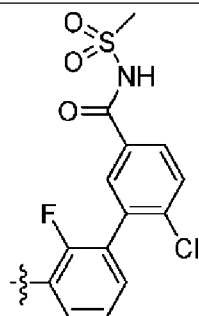
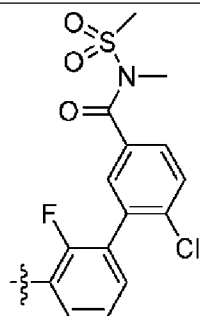
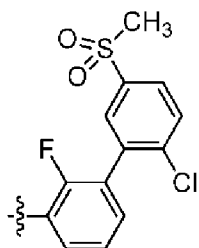
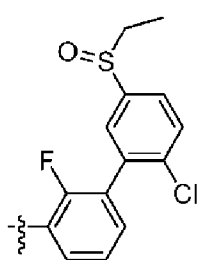
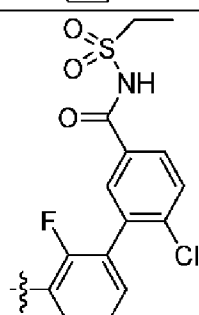
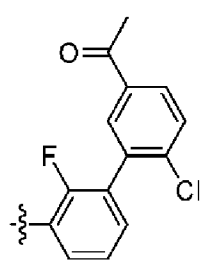
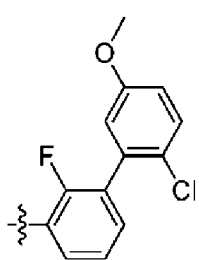
6. Spoj za upotrebu prema bilo kojem od zahtjeva 1-5, naznačen time što  $R^{12}$  je izborno supstituirani heteroaril.

7. Spoj za upotrebu prema bilo kojem od zahtjeva 1-6, naznačen time što osim ako nije drugačije navedeno, bilo koja skupina koja je izborno supstituirana može biti neovisno supstituirana s jednim ili više halogenom, hidroksilom, amino, cijano, -CHO, -COOH, -CONH<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkilom, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>alkenilom, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>alkinilom, -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkoksi, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>alkanoilom, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkilesterom, (mono- i di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkilamino)C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>alkilom, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>haloalkil, hidroksiC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkilom, esterom, karbamatom, ureom, sulfonamidom, -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkil(heterociklo), C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkil(heteroaril), -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkil(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>cikloalkil), -O-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkil(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>cikloalkil), B(OH)<sub>2</sub>, fosfatom, fosfonatom, i C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>haloalkoksi.

8. Spoj za upotrebu prema bilo kojem od zahtjeva 1-7, naznačen time što B je fenil ili piridinil supstituiran s 1, 2 ili 3 supstituenta odabrana između klora, broma, hidroksila, -SCF<sub>3</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>alkila, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>alkoksi, trifluorometila, fenila i trifluorometoksi.

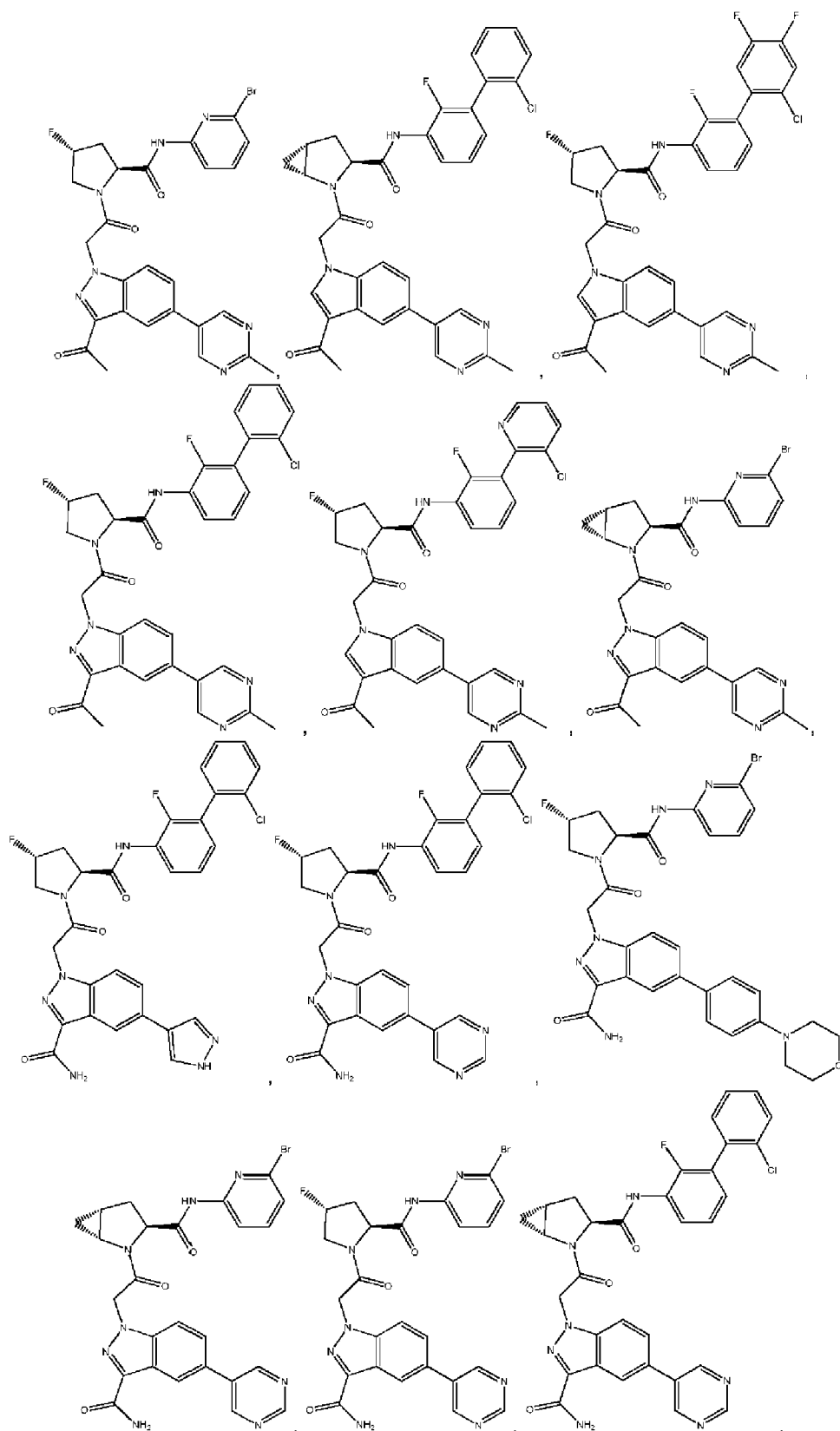
9. Spoj za upotrebu prema zahtjevu 1, naznačen time što je B odabran između:

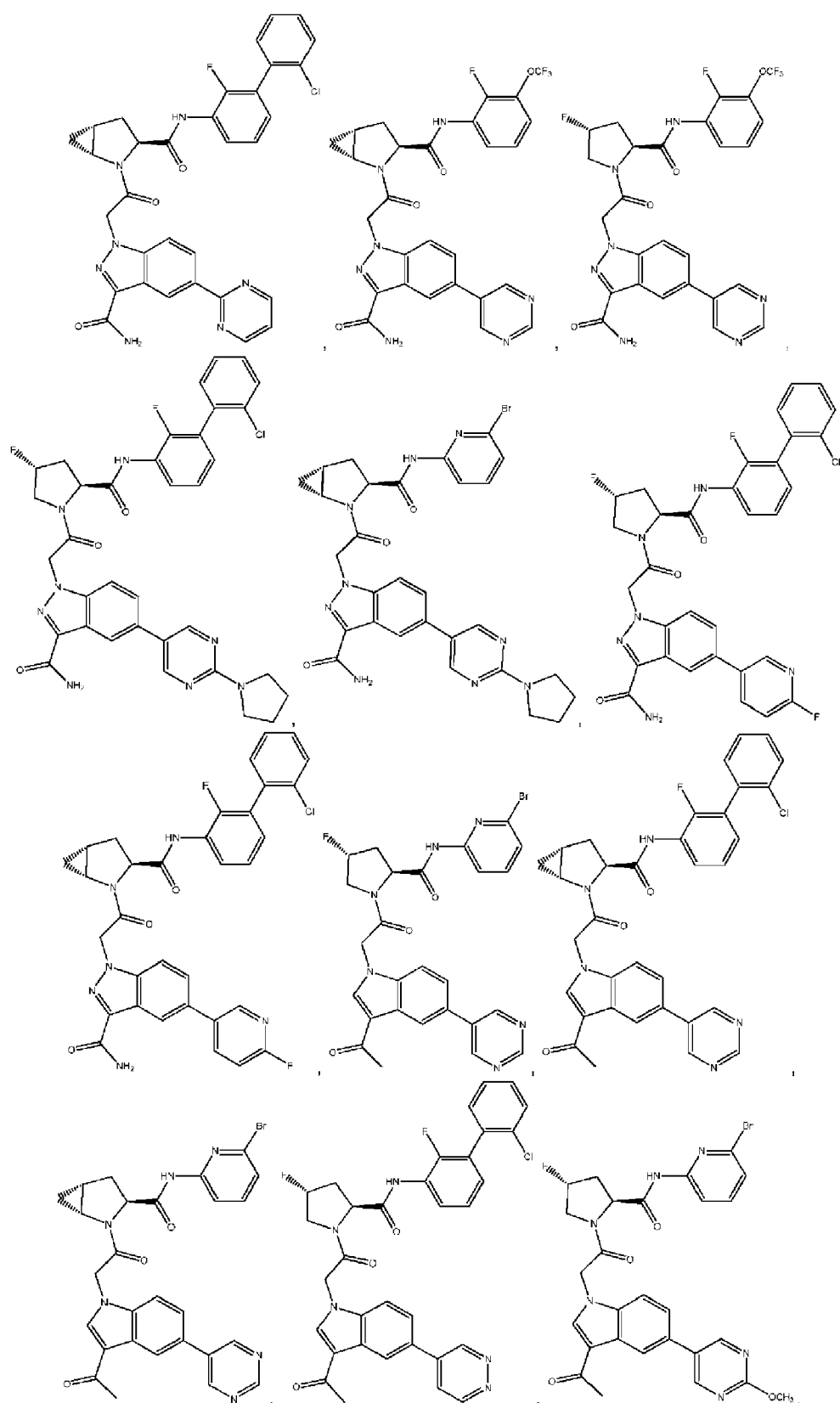
|  |  |  |  |
|--|--|--|--|
|  |  |  |  |
|  |  |  |  |
|  |  |  |  |
|  |  |  |  |

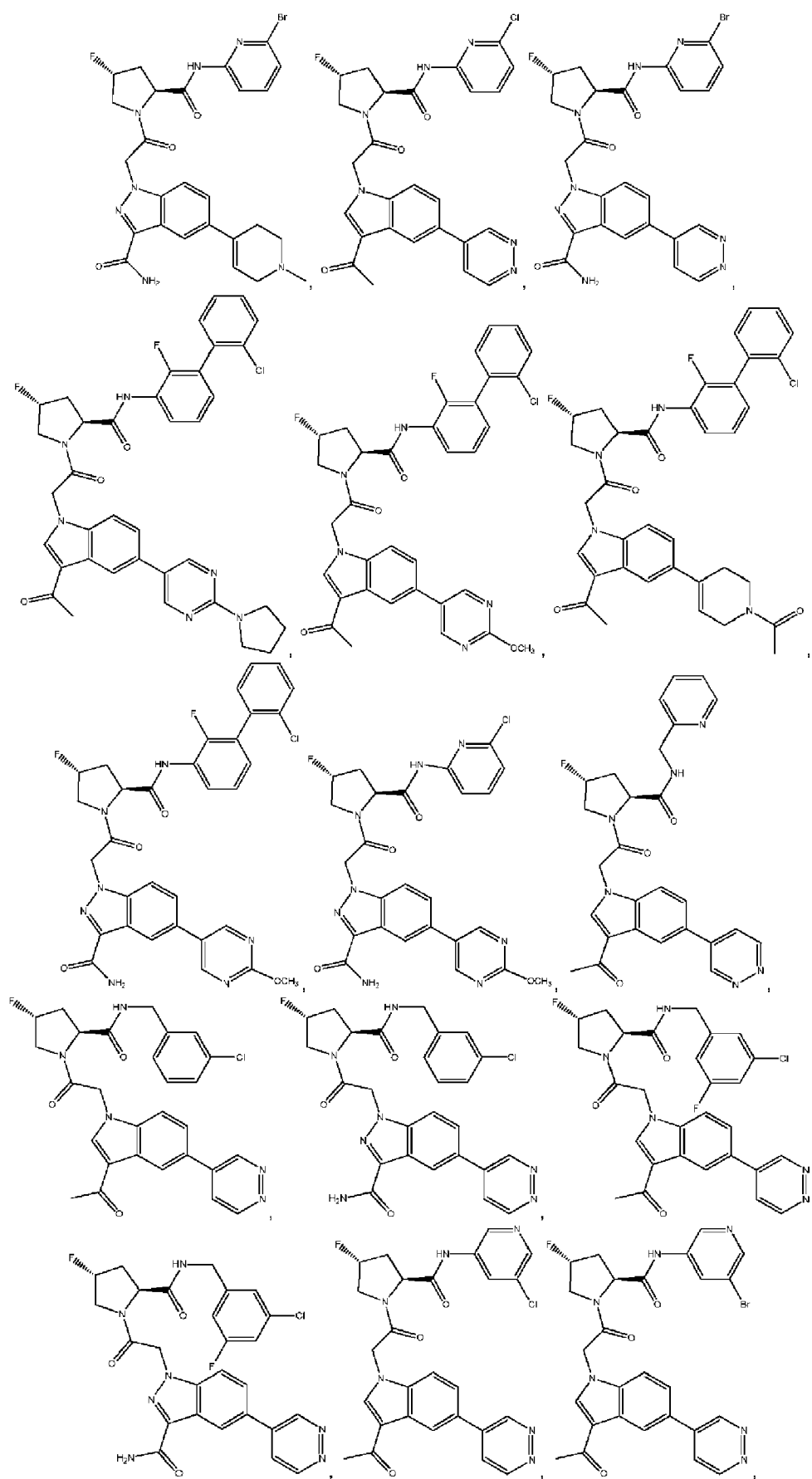
|                                                                                     |                                                                                     |                                                                                      |                                                                                       |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|
|    |    |    |    |
|    |    |    |    |
|    |    |    |    |
|   |   |   |   |
|  |  |  |  |

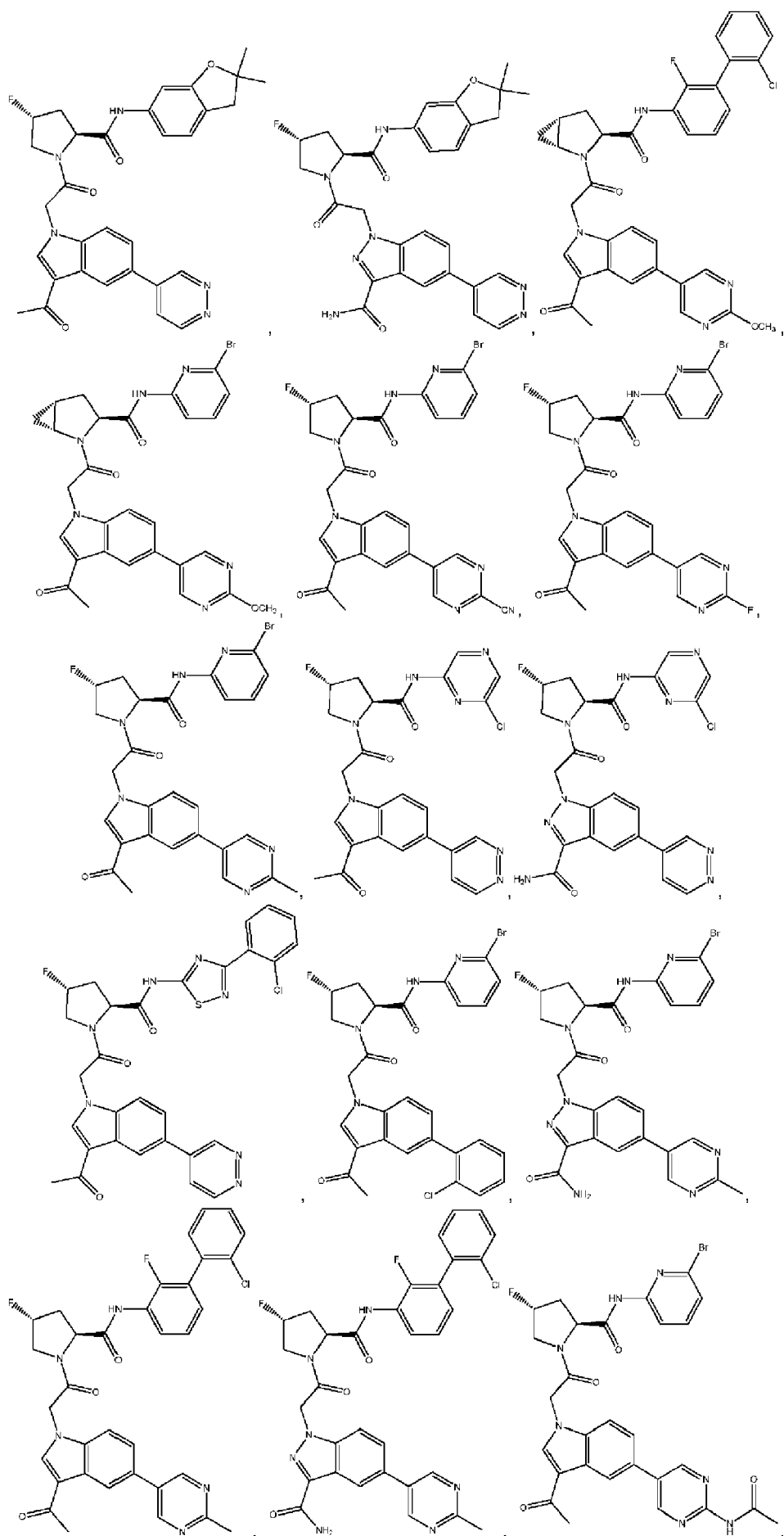
|  |  |  |  |
|--|--|--|--|
|  |  |  |  |
|  |  |  |  |
|  |  |  |  |
|  |  |  |  |
|  |  |  |  |
|  |  |  |  |

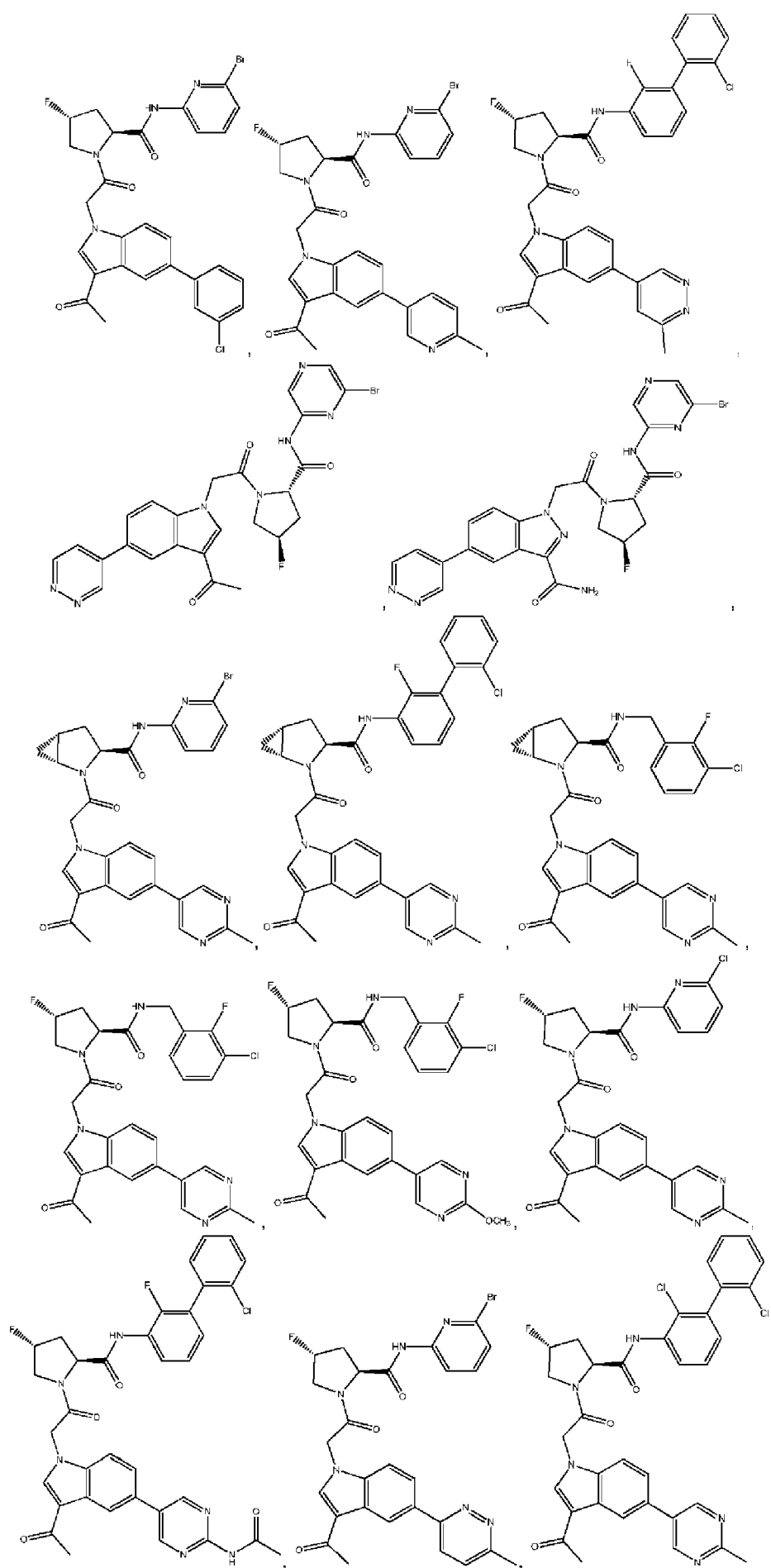
10. Spoj za upotrebu prema zahtjevu 1, naznačen time što je spoj odabran između:

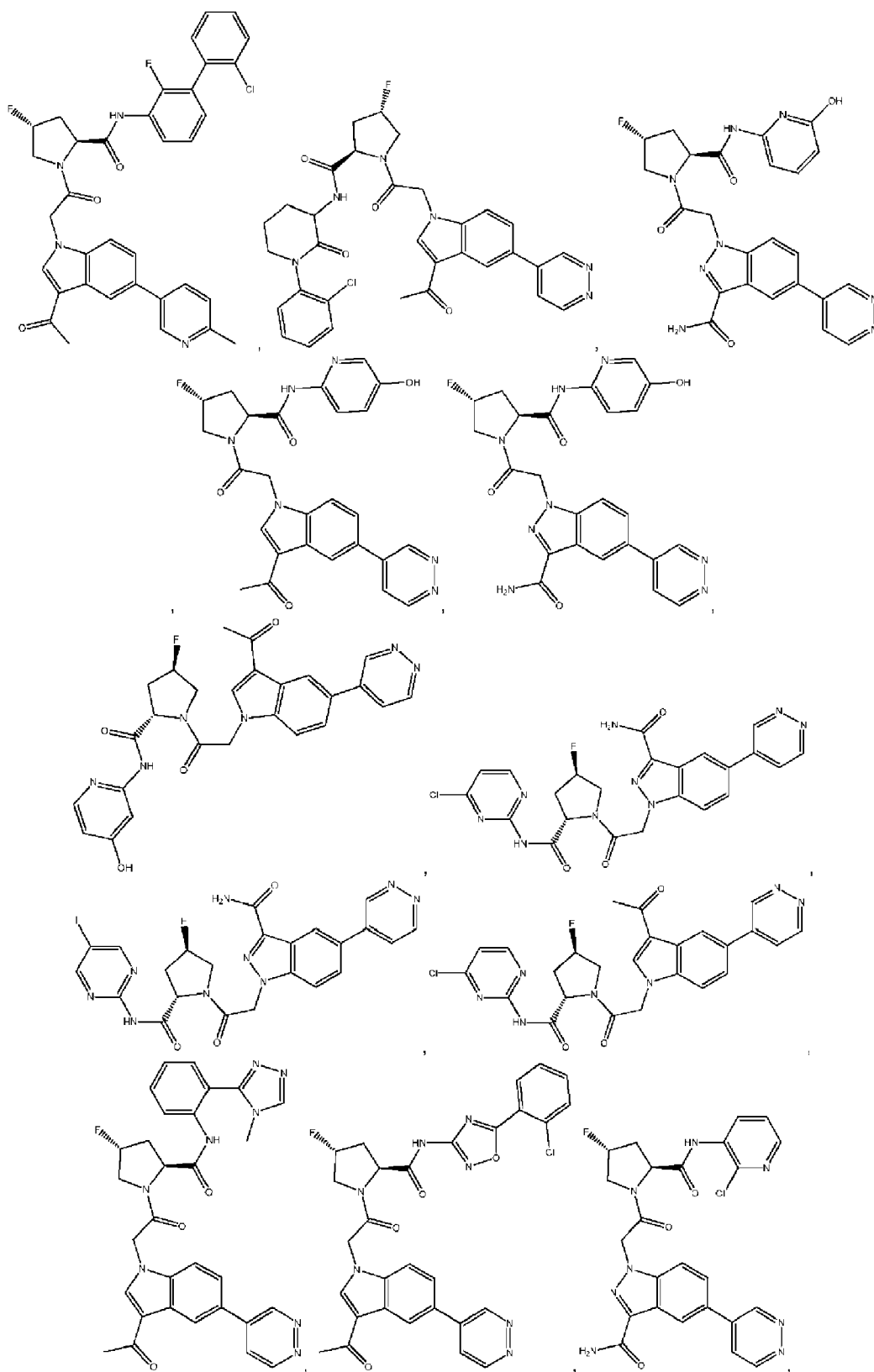


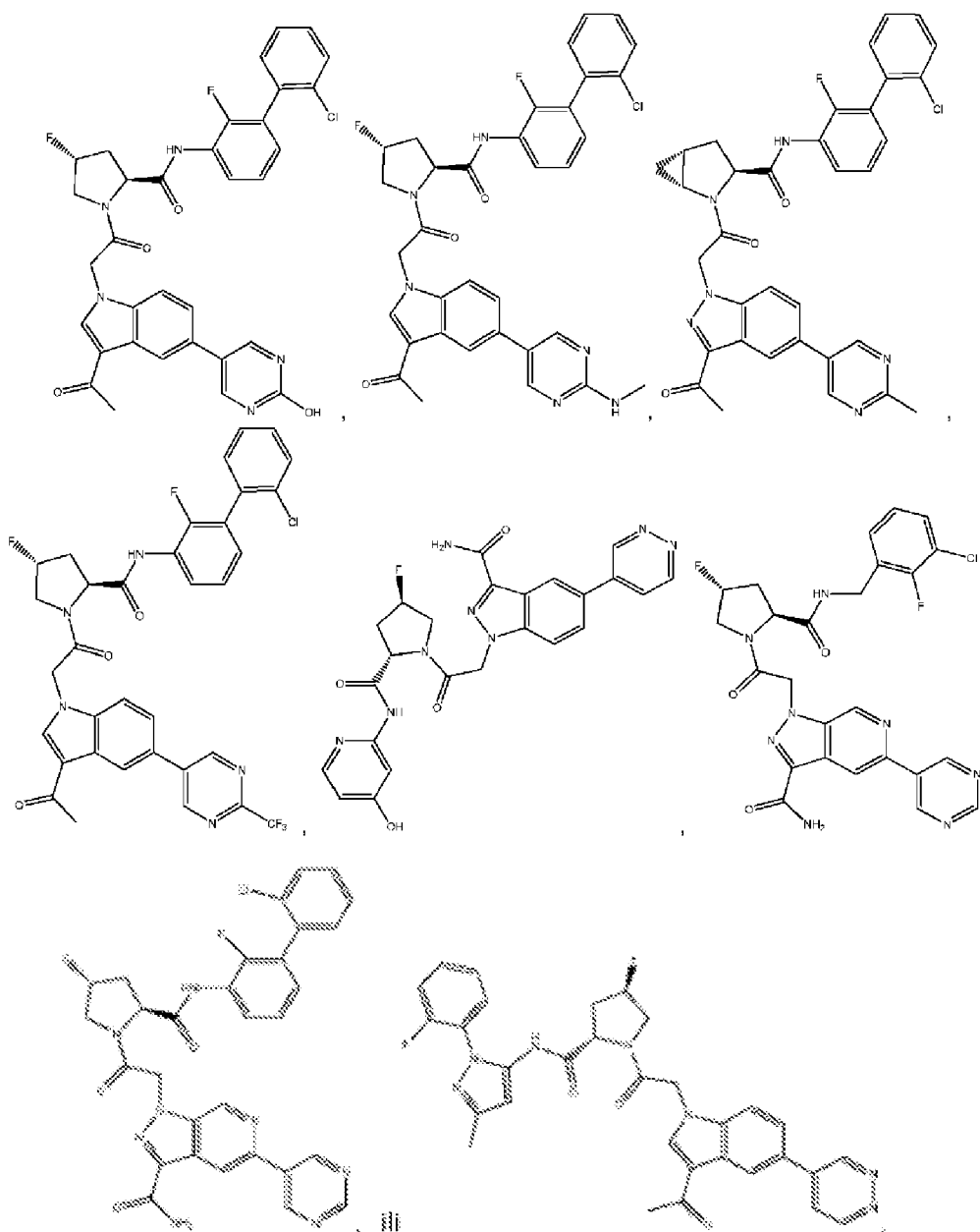






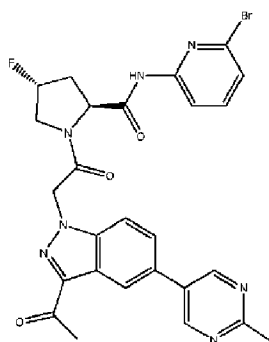






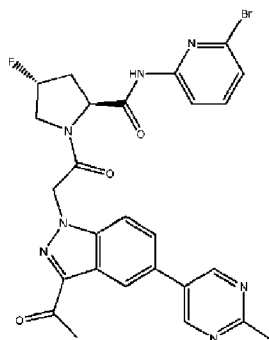
ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

- 5 11. Spoj za upotrebu prema bilo kojem od zahtjeva 1-10, naznačen time što je poremećaj makularna degeneracija povezana sa starenjem.
12. Spoj za upotrebu prema bilo kojem od zahtjeva 1-10, naznačen time što je poremećaj multipla skleroza ili reumatoidni artritis.
13. Spoj za upotrebu prema bilo kojem od zahtjeva 1-10, naznačen time što je poremećaj aneurizma abdominalne aorte.
- 10 14. Spoj za upotrebu prema bilo kojem od zahtjeva 1-10, naznačen time što je poremećaj miastenija gravis.
15. Spoj za upotrebu prema bilo kojem od zahtjeva 1-10, naznačen time što je poremećaj optički neuromijelitis.
16. Spoj za upotrebu prema zahtjevu 1, naznačen time što je poremećaj geografska atrofija.
17. Spoj za upotrebu prema zahtjevu 16, naznačen time što je spoj:



ili njegova farmaceutska prihvatljiva sol.

18. Spoj:



ili njegova farmaceutska prihvatljiva sol, za upotrebu kao lijek.

5