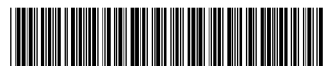




(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO



(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20120159 T1

HR P20120159 T1

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

(51) MKP:

A61K 31/416 (2006.01)
C07D 231/54 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01)
C07D 403/04 (2006.01)
C07D 403/06 (2006.01)
A61P 3/00 (2006.01)
A61P 25/00 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 31.03.2012.

(21) Broj predmeta: P20120159T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 17.02.2012.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2006036158
Datum podnošenja međunarodne prijave: 18.09.2006.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 06814802.2
Datum podnošenja europske prijave patenta: 18.09.2006.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2007038036
Datum međunarodne objave: 05.04.2007.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 1937259 A1
Datum objave europske prijave patenta: 02.07.2008.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 1937259 B1
Datum objave europskog patenta: 23.11.2011.

(31) Broj prve prijave: 720253 P

(32) Datum podnošenja prve prijave: 23.09.2005.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelji:

Janssen Pharmaceutica NV, Turnhoutseweg 30, 2340 Beerse, BE
Fina Liotta, 342 Edgewood Avenue, Westfield, 07090 NJ, US
Meng Pan, 155 Brandon Court, Neshanic Station, 08853 NJ, US
Mingde Xia, 71 Willow Road, Belle Mead, 08502 NJ, US
Michael P. Wachter, 52 North Street, Bloomsbury, 08804 NJ, US
Huajun Lu, 20 Jenna Drive, Bridgewater, 08807 NJ, US

(74) Zastupnik:

Odvjetničko društvo Vukmir i suradnici, 10000 Zagreb, HR

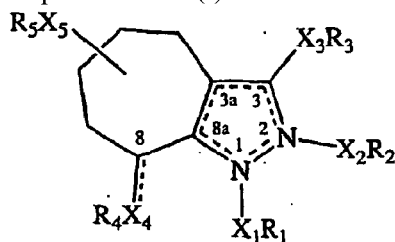
(54) Naziv izuma:

MODULATORI HEKSAHIDRO-CIKLOHEPTAPIRAZOL KANABINOIDA

HR P20120159 T1

PATENTNI ZAHTEVI

1. Spoj naznačen time da ima strukturu prema formuli (I):



ili njegova sol ili polimorf

pri čemu isprekidane linije između položaja 2-3 i položaja 3a-8a u formuli (I) predstavljaju položaje za svaku od dvije dvostruke veze prisutne kada je prisutan X_1R_1 ;

isprekidane linije između položaja 3-3a i položaja 8a-1 u formuli (I) predstavljaju položaje za svaku od dvije dvostruke veze prisutne kada je prisutan X_2R_2 ;

isprekidana linija između položaja 8 i X_4R_4 u formuli (I) predstavlja položaj za dvostruku vezu;

X_1 je odsutan ili niži alkilen;

X_2 je odsutan ili niži alkilen;

pri čemu je prisutan samo jedan od X_1R_1 i X_2R_2 ;

X_3 je odsutan, niži alkilen, niži alkiliden ili -NH-;

kada je odsutna isprekidana linija između položaja 8 i X_4R_4 , X_4 je odsutan, ili je niži alkilen;

kada je prisutna isprekidana linija između položaja 8 i X_4R_4 , X_4 je odsutan;

X_5 je odsutan ili niži alkilen;

R_1 je odabran od vodika, alkila (proizvoljno supstituiranog u jednom ili više položaja sa halogenom, hidroksi ili nižim alkoksi), nižeg alkil-sulfonila, arila, C_3 - C_{12} cikloalkila ili heterociklila, pri čemu aril, C_3 - C_{12} cikloalkil ili heterociklil je svaki proizvoljno supstituiran u jednom ili više položaja sa halogenom, aminosulfonilom, nižim alkil-aminosulfonilom, alkilom (proizvoljno supstituiranim u jednom ili više položaja sa halogenom, hidroksi ili nižim alkoksi), hidroksi ili nižim alkoksi (proizvoljno supstituiranim u jednom ili više položaja sa halogenom ili hidroksi);

R_2 je odabran od vodika, alkila (proizvoljno supstituiranog u jednom ili više položaja sa halogenom, hidroksi ili nižim alkoksi), nižeg alkil-sulfonila, arila, C_3 - C_{12} cikloalkila ili heterociklila, pri čemu aril, C_3 - C_{12} cikloalkil ili heterociklil je svaki proizvoljno supstituiran u jednom ili više položaja sa halogenom, aminosulfonilom, nižim alkil-aminosulfonilom, alkilom (proizvoljno supstituiranim u jednom ili više položaja sa halogenom, hidroksi ili nižim alkoksi), hidroksi ili nižim alkoksi (proizvoljno supstituiranim u jednom ili više položaja sa halogenom ili hidroksi);

R_3 je -C(O)- $Z_1(R_6)$, -SO₂-NR₇- $Z_2(R_8)$ ili -C(O)-NR₉- $Z_3(R_{10})$;

kada je odsutna isprekidana linija između položaja 8 i X_4R_4 , X_4 je odsutan ili niži alkilen i R_4 je hidroksi, niži alkil, niži alkoksi, halogen, aril, C_3 - C_{12} cikloalkil ili heterociklil, pri čemu aril, C_3 - C_{12} cikloalkil ili heterociklil je svaki proizvoljno supstituiran u jednom ili više položaja sa hidroksi, okso, nižim alkilom (proizvoljno supstituiranim u jednom ili više položaja sa halogenom, hidroksi ili nižim alkoksi), nižim alkoksi (proizvoljno supstituiranim u jednom ili više položaja sa halogenom ili hidroksi) ili halogenom;

kada je prisutna isprekidana linija između položaja 8 i X_4R_4 , X_4 je odsutan i R_4 je CH-aril ili CH-heterociklil, pri čemu aril ili heterociklil je svaki proizvoljno supstituiran u jednom ili više položaja sa hidroksi, okso, nižim alkilom (proizvoljno supstituiranim u jednom ili više položaja sa halogenom, hidroksi ili nižim alkoksi), nižim alkoksi (proizvoljno supstituiranim u jednom ili više položaja sa halogenom ili hidroksi) ili halogenom;

R_5 je vodik, hidroksi, okso, halogen, amino, niži alkil-amino, alkil (proizvoljno supstituiran u jednom ili više položaja sa halogenom, hidroksi ili nižim alkoksi), niži alkoksi (proizvoljno supstituiran u jednom ili više položaja sa halogenom ili hidroksi), karboksi, karbonilalkoksi, karbamoil, karbamoilalkil, aril, ariloksi, arilalkoksi ili heterociklil;

R_6 je aril, C_3 - C_{12} cikloalkil ili heterociklil svaki proizvoljno supstituiran sa jednim ili više hidroksi, okso, halogenom, amino, nižim alkil-amino, alkilom (proizvoljno supstituiranim u jednom ili više položaja sa halogenom, hidroksi ili nižim alkoksi), nižim alkoksi (proizvoljno supstituiranim u jednom ili više položaja sa halogenom ili hidroksi), karboksi, karbonilalkoksi, karbamoil, karbamoilalkilom, arilom, ariloksi, arilalkoksi ili heterociklilom;

R_7 je vodik ili niži alkil;

R_8 je vodik, aril, C_3 - C_{12} cikloalkil ili heterociklil, pri čemu aril, C_3 - C_{12} cikloalkil ili heterociklil je svaki proizvoljno supstituiran sa jednim ili više hidroksi, okso, halogenom, amino, nižim alkil-amino, alkilom (proizvoljno supstituiranim u jednom ili više položaja sa halogenom, hidroksi ili nižim alkoksi), nižim alkoksi (proizvoljno supstituiranim u jednom ili više položaja sa halogenom ili hidroksi), karboksi, karbonilalkoksi, karbamoil, karbamoilalkilom, arilom, ariloksi, arilalkoksi ili heterociklilom;

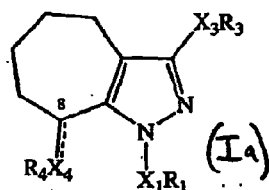
R_9 je vodik ili niži alkil;

R_{10} je vodik, aril, C_3 - C_{12} cikloalkil ili heterociklil, pri čemu aril, C_3 - C_{12} cikloalkil ili heterociklil je svaki proizvoljno supstituiran sa jednim ili više hidroksi, okso, halogenom, amino, nižim alkil-amino, alkilom (proizvoljno supstituiranim u jednom ili više položaja sa halogenom, hidroksi ili nižim alkoksi), nižim alkoksi (proizvoljno supstituiranim u jednom ili više položaja sa halogenom ili hidroksi), karboksi, karbonilalkoksi, karbamoil, karbamoilalkil, aminosulfonilom, nižim alkil-aminosulfonilom, arilom, ariloksi, arilalkoksi ili heterociklilom;

Z_1 i Z_2 su svaki odsutan ili alkil; te

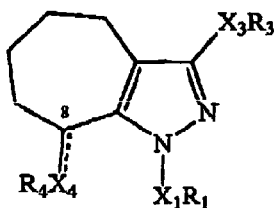
Z_3 je odsutan, $-NH-$, $-SO_2-$ ili alkil (pri čemu alkil je proizvoljno supstituiran u jednom ili više položaja sa halogenom, hidroksi, nižim alkilom, nižim alkoksi, karboksi ili karbonilalkoksi) i pri čemu izraz niži alkil znači radikal alkila sa do 4 atoma ugljika.

2. Spoj prema zahtjevu 1 ili njegova sol ili polimorf, **naznačen time** da X_1 je odsutan i R_1 je odabran od vodika, alkila, nižeg alkil-sulfonila, arila, C_3 - C_{12} cikloalkila ili heterociklila, pri čemu aril ili heterociklil je svaki proizvoljno supstituiran u jednom ili više položaja sa halogenom, aminosulfonilom ili alkilom (proizvoljno supstituiranim u jednom ili više položaja sa halogenom).
3. Spoj prema zahtjevu 1 ili njegova sol ili polimorf, **naznačen time** da R_3 je $-C(O)-Z_1(R_6)$; X_3 je odsutan ili niži alkiliden; Z_1 je odsutan ili alkil; i R_6 je heterociklil proizvoljno supstituiran sa jednim ili više hidroksi, halogenom, amino, nižim alkil-amino, alkilom (proizvoljno supstituiranim u jednom ili više položaja sa halogenom, hidroksi ili nižim alkoksi), nižim alkoksi (proizvoljno supstituiranim u jednom ili više položaja sa halogenom ili hidroksi), karboksi, karbonilalkoksi, karbamoil, karbamoil alkilom, arilom, ariloksi, arilalkoksi ili heterociklilom.
4. Spoj prema zahtjevu 1 ili njegova sol ili polimorf, **naznačen time** da R_3 je $-C(O)-R_6$; X_3 je odsutan; i R_6 je heterociklil proizvoljno supstituiran sa jednim ili više arilom ili heterociklilom.
5. Spoj prema zahtjevu 1 ili njegova sol ili polimorf, **naznačen time** da R_3 je $-SO_2-NR_7-Z_2(R_8)$; X_3 je odsutan ili niži alkiliden; R_7 je vodik ili niži alkil; Z_2 je odsutan ili alkil; i R_8 je aril, C_3 - C_{12} cikloalkil ili heterociklil.
6. Spoj prema zahtjevu 1 ili njegova sol ili polimorf, **naznačen time** da R_3 je $-SO_2-NH-Z_2(R_8)$; X_3 je odsutan ili niži alkiliden; Z_2 je odsutan ili alkil; i R_8 je aril, C_3 - C_{12} cikloalkil ili heterociklil.
7. Spoj prema zahtjevu 1 ili njegova sol ili polimorf, **naznačen time** da R_3 je $-C(O)-NR_9-Z_3(R_{10})$; X_3 je odsutan ili niži alkiliden; R_9 je vodik ili niži alkil; Z_3 je odsutan, $-SO_2-$ ili alkil (pri čemu je alkil proizvoljno supstituiran u jednom ili više položaja sa halogenom, hidroksi ili karbonilalkoksi); i R_{10} je vodik, aril, C_3 - C_{12} cikloalkil ili heterociklil, pri čemu aril, C_3 - C_{12} cikloalkil ili heterociklil je svaki proizvoljno supstituiran sa jednim ili više hidroksi, halogenom, alkilom (proizvoljno supstituiranim u jednom ili više položaja sa halogenom), alkoksi, karboksi, karbonilalkoksi, karbamoilalkilom ili aminosulfonilom.
8. Spoj prema zahtjevu 1 ili njegova sol ili polimorf, **naznačen time** da R_3 je $-C(O)-NH-Z_3(R_{10})$; X_3 je odsutan ili niži alkiliden; Z_3 je odsutan, $-SO_3$ ili alkil (pri čemu je alkil proizvoljno supstituiran u jednom ili više položaja sa halogenom, hidroksi ili karbonilalkoksi); i R_{10} je vodik, aril, C_3 - C_{12} cikloalkil ili heterociklil, pri čemu aril, C_3 - C_{12} cikloalkil ili heterociklil je svaki proizvoljno supstituiran sa jednim ili više hidroksi, halogenom, alkilom (proizvoljno supstituiranim u jednom ili više položaja sa halogenom), alkoksi, karboksi, karbonilalkoksi, karbamoilalkilom ili aminosulfonilom.
9. Spoj prema zahtjevu 1 ili njegova sol ili polimorf, **naznačen time** da R_3 je $-C(O)-NH-Z_3(R_{10})$; X_3 je odsutan ili niži alkiliden; Z_3 je odsutan, $-SO_2-$ ili alkil (pri čemu je alkil proizvoljno supstituiran u jednom ili više položaja sa halogenom, hidroksi ili karbonilalkoksi); i R_{10} je aril proizvoljno supstituiran sa jednim ili više hidroksi, halogenom, alkilom (proizvoljno supstituiranim u jednom ili više položaja sa halogenom) alkoksi ili aminosulfonilom.
10. Spoj prema zahtjevu 1 ili njegova sol ili polimorf, **naznačen time** da R_3 je $-C(O)-NH-Z_3(R_{10})$; X_3 je odsutan ili niži alkiliden; Z_3 je odsutan, $-SO_2-$ ili alkil (pri čemu je alkil proizvoljno supstituiran u jednom ili više položaja sa halogenom, hidroksi ili karbonilalkoksi); i R_{10} je vodik ili C_3 - C_{12} cikloalkil, pri čemu C_3 - C_{12} cikloalkil je proizvoljno supstituiran sa jednim ili više hidroksi, alkilom, alkoksi, karboksi, karbonilalkoksi ili karbamoilalkilom.
11. Spoj prema zahtjevu 1 ili njegova sol ili polimorf, **naznačen time** da R_3 je $-C(O)-NH-Z_3(R_{10})$; X_3 je odsutan ili niži alkiliden; Z_3 je odsutan, $-SO_2-$ ili alkil (pri čemu je alkil proizvoljno supstituiran u jednom ili više položaja sa halogenom, hidroksi ili karbonilalkoksi); i R_{10} je vodik ili heterociklil, pri čemu heterociklil je proizvoljno supstituiran sa jednim ili više karbonilalkoksi.
12. Spoj prema zahtjevu 1 ili njegova sol ili polimorf, **naznačen time** da je odsutna isprekidana linija između položaja 8 i X_4R_4 , X_4 je odsutan ili niži alkilen i R_4 je aril proizvoljno supstituiran u jednom ili više položaja sa nižim alkilom ili halogenom.
13. Spoj prema zahtjevu 1 ili njegova sol, izomer, predlijek, metabolit ili polimorf, **naznačen time** da je prisutna isprekidana linija između položaja 8 i X_4R_4 , X_4 je odsutan i R_4 je CH-aril ili CH-heterociklil, pri čemu aril ili heterociklil je svaki proizvoljno supstituiran u jednom ili više položaja sa nižim alkoksi ili halogenom.
14. Spoj prema zahtjevu 1 ili njegova sol, izomer, predlijek, metabolit ili polimorf, **naznačen time** da X_5 je odsutan i R_5 je vodik.
15. Spoj prema zahtjevu 1 **naznačen time** da ima strukturu prema formuli (Ia):



ili njegova sol ili polimorf pri čemu X_1 je odsutan ili niži alkilen; X_3 je odsutan ili niži alkiliden; X_4 je odsutan ili je niži alkilen kada je odsutna isprekidana linija između položaja 8 i X_4R_4 ; X_4 je odsutan kada je prisutna isprekidana linija između položaja 8 i X_4R_4 ; R_1 je odabran od vodika, alkila, nižeg alkil-sulfonila, arila, C_3 - C_{12} cikloalkila ili heterociklila, pri čemu arila ili heterociklil je svaki proizvoljno supstituiran u jednom ili više položaja sa halogenom, aminosulfonilom ili alkilom (proizvoljno supstituiranim u jednom ili više položaja sa halogenom); R_3 je $-C(O)-(R_6)$, $-SO_2-NH-Z_2(R_8)$ ili $-C(O)-NH-Z_3(R_{10})$; kada je odsutna isprekidana linija između položaja 8 i X_4R_4 , R_4 je aril, pri čemu aril je proizvoljno supstituiran u jednom ili više položaja sa nižim alkilom ili halogenom; kada je prisutna isprekidana linija između položaja 8 i X_4R_4 , R_4 je CH-aril ili CH-heterociklil, pri čemu aril ili heterociklil je svaki proizvoljno supstituiran u jednom ili više položaja sa nižim alkoksi ili halogenom; R_6 je heterociklil proizvoljno supstituiran sa jednim ili više arilom ili heterociklilom; Z_1 je odsutan ili alkil, R_8 je aril, C_3 - C_{12} cikloalkil ili heterociklil; Z_3 je odsutan, $-SO_2-OR$ alkil (pri čemu je alkil proizvoljno supstituiran u jednom ili više položaja sa halogenom, hidroksi ili karbonilalkoksi); i R_{10} je vodik, aril, C_3 - C_{12} cikloalkil ili heterociklil, pri čemu aril, C_3 - C_{12} cikloalkil ili heterociklil je svaki proizvoljno supstituiran sa jednim ili više hidroksi, halogenom, alkilom (proizvoljno supstituiranim u jednom ili više položaja sa halogenom), karboksi, karbonilalkoksi, karbamoilalkilom ili aminosulfonilom.

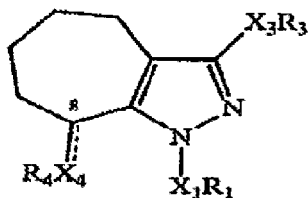
16. Spoj prema zahtjevu 1 **naznačen time** da ima strukturu prema formuli (Ia):



(Ia)

ili njegova sol ili polimorf pri čemu X_1 je odsutan ili niži alkilen; X_3 je odsutan ili niži alkiliden; X_4 je odsutan i prisutna je isprekidana linija između položaja 8 i X_4R_4 , R_1 je odabran od vodika, alkila, nižeg alkil-sulfonila, arila, C_9 - C_{12} cikloalkila ili heterociklila, pri čemu aril ili heterociklil su svaki proizvoljno supstituirani u jednom ili više položaja sa halogenom, aminosulfonilom ili alkilom, proizvoljno supstituiranim u jednom ili više položaja sa halogenom; R_4 je CH-aril, pri čemu aril je proizvoljno supstituiran u jednom ili više položaja sa nižim alkoksi ili halogenom; R_6 je heterociklil proizvoljno supstituiran sa jednim ili više arilom ili heterociklilom; Z_2 je odsutan ili alkil; R_8 je aril, C_3 - C_{12} cikloalkil ili heterociklil; Z_3 je odsutan, $-SO_2-$ ili alkil pri čemu je alkil proizvoljno supstituiran u jednom ili više položaja sa halogenom, hidroksi ili karbonilalkoksi; i R_{10} je vodik, aril, C_3 - C_{12} cikloalkil ili heterociklil, pri čemu aril, C_3 - C_{12} cikloalkil ili heterociklil su svaki proizvoljno supstituirani sa jednim ili više hidroksi, halogenom, alkilom, proizvoljno supstituiranim u jednom ili više položaja sa halogenom, karboksi, karbonilalkoksi, karbamoilalkilom ili aminosulfonilom.

17. Spoj prema zahtjevu 1 **naznačen time** da ima strukturu prema formuli (Ia):



(Ia)

ili njegova sol ili polimorf pri čemu X_1 je odsutan i R_1 je odabran od vodika, alkila, nižeg alkil-sulfonila, arila, C_3 - C_{12} cikloalkila ili heterociklila, pri čemu aril ili heterociklil su svaki proizvoljno supstituirani u jednom ili više položaja sa halogenom, aminosulfonilom ili alkilom proizvoljno supstituiranim u jednom ili više položaja sa halogenom; R_3 je $-C(O)-NH-Z_4(R_{10})$; X_3 je odsutan ili niži alkiliden; Z_3 je odsutan, $-SO_2-$ ili alkil (pri čemu je alkil proizvoljno supstituiran u jednom ili više položaja sa halogenom, hidroksi ili karbonilalkoksi); R_{10} je vodik ili heterociklil, pri čemu heterociklil je proizvoljno supstituiran sa jednim ili više karbonilalkoksi-, prisutna je

isprekidana linija između položaja 8 i X_4R_4 , X_4 je odsutan i R_4 je CH-aril ili CH-heterociklil, pri čemu aril ili heterociklil su svaki proizvoljno supstituirani u jednom ili više položaja sa nižim alkoksi ili halogenom.

18. Spoj prema zahtjevu 1 ili njegova sol ili polimorf **naznačen time** da je odabran od:

(1,3,3-trimetil-biciklo[2,2,1]hept-2-il)-amin 1-(4-metoksi-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline
 (1,3,3-trimetil-biciklo[2,2,1]hept-2-il)-amid 1-(4-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 (1,3,3-trimetil-biciklo[2,2,1]hept-2-il)-amid 1-benzil-1,4,5,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 (1,3,3-trimetil-biciklo[2,2,1]hept-2-il)-amid 1-cikloheksil-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 (adamantan-1-ilmetil)-amid 1-cikloheksil-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 (adamantan-1-il-etil)-amid 1-cikloheksil-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 (1,3,3-trimetil-biciklo[2,2,1]hept-2-il)-amid 1-ciklopentil-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 (adamantan-1-ilmetil)-amid 1-ciklopentil-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 (1-adamantan-1-il-etil)-amid 1-ciklopentil-1,4,5,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 (adamantan-1-ilmetil)-amid 1-ciklobutil-1-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 etil ester 2-[(1-cikloheksil-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karbamoil)-amino]-biciklo[2,2,1]heptan-2-karboksilne kiseline,
 (1-adamantan-1-il-etil)-amid, 1-benzil-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline
 (adamantan-1-ilmetil)-amid 1-benzil-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 [(1S)-1 cikloheksil-etil]-amid 1-benzil-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 [(1R)-1 cikloheksil-etil]-amid 1-benzil-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 etil ester (2S,3R)-3-{(2E)-3-[1-(4-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro- cikloheptapirazol-3-il]-akriloilamino}-biciklo[2,2,1]heptan-2-karboksilne kiseline,
 etil ester (2S,3R)-3-[(1-benzil-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karbonil)-amino]-biciklo[2,2,1]heptan-2-karboksilne kiseline,
 etil ester (2R,3S)-3[(1benzil-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karbonil)-amino]-biciklo[2,2,1]heptan-2-karboksilne kiseline,
 tert-butil ester (2S,3R)-3-[(1-benzil-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karbonil)-amino]-biciklo[2,2,1]heptan-2-karboksilne kiseline,
 etil ester 3-[(1-benzil-1,4,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karbonil)-amino] biciklo[2,2,1]heptan-2-karboksilne kiseline,
 [(2S)-1,3,3-trimetil-biciklo[2,2,1]hept-2-il]-amid 8-(4-kloro-benzil)-1-cikloheksil-1,4,3,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 [(1S)-1-fenil-etil]-amin (2E)-2-[8-(3-kloro-benzil)-1-(2,4-dikloro-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro cikloheptapirazol-3-il]-etansulfonske kiseline,
 [(2S)-1,3,3-trimetil-biciklo[20201]hept-2-il]-amid 8-(3-kloro-benzil)-1-cikloheksil-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 [(1S)-1-fenil]-etil]-amid 8-(3-kloro-benzil)-1-cikloheksil-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 [(2S)-1,2,3-trimetil-biciklo[2,2,1]hept-2-il]-amid 8-(3-kloro-benzil)-1-(2,4-dikloro-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 adamantan-2-ilamid 8-(4-kloro-benzil)-1-cikloheksil-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol karboksilne kiseline,
 adamantan-1-ilamid 8-(3-kloro-benzil)-1-cikloheksil-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol karboksilne kiseline,
 adamantan-1-ilamid 8-(3-kloro-benzil)-1-(2,4-dikloro-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 ciklobutilamid 8-(4-kloro-benzil)-1-(2,4-dikloro-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 4-trifluorometil-benzilamid 8-(4-kloro-benzil)-1-(2,4-dikloro-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 piperidin-1-ilamid 8-(4-kloro-benzil)-1-(2,4-dikloro-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 ciklobutilamid 1,8-bis-(4-kloro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 [(2S)-1,3,3-trimetil-biciklo[2,2,1]hept-2-il]-amid 8-(2-kloro-benzil)-1-metil-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol karboksilne kiseline
 ciklobutilamid 1-(2,4-dikloro-fenil)-8-(3-fluoro-benzil)-1,1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 [(2S)-1,3,3-trimetil-biciklo[2,2,1]hept-2-il]-amid 1-(2,4-dikloro-fenil)-8-(3-floro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 [(2S)-1,3,3-trimetil-biciklo[2,2,1]hept-2-il]-amid 1-cikloheksil-8-(3-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,

[(1*S*)-1-fenil-etil]-amid 1-cikloheksil-8-(3-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne
 kiseline,
 [(2*S*)-1,3,3-trimetil-biciklo[2,2,1]hept-2-il]-amid 1-benzil-8-fenil-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-
 karboksilne kiseline,
 5 [(1*S*)-1-fenil-etil]-amid 1-benzil-8-fenil-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 benzilamid 1-cikloheksil-8-(3-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 [(2*S*)-1,3,3-trimetil-biciklo[2,2,1]hept-2-il]-amid 1-cikloheksil-8-(4-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-
 cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 ciklopentilamid 1-cikloheksil-8-(4-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 10 benzilamid (1-cikloheksil-8-(4-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 metil ester (2*S*)-2- $\{[1\text{-cikloheksil-8-(4-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karbonil}]\text{-amino}\}$ -
 3-(4-fluoro-fenil)-propionske kiseline,
 [(1*S*)-1-fenil-etil]-amid 1-cikloheksil-8-(4-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne
 kiseline,
 15 4-trifluorometil-benzilamid 1-cikloheksil-8-(4-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-
 karboksilne kiseline,
 [(1*R*)-2-hidroksi-1-fenil-etil]-amid (8*S*)-1-cikloheksil-8-(4-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-
 3-karboksilne kiseline,
 [(1*S*)-1-fenil-etil]-amid (2*E*)-2-[1-cikloheksil-8-(3-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-il]-
 20 etensulfonske kiseline,
 metil ester (2*R*)-2- $\{[(8*R*)-1-(2,4\text{-dikloro-fenil})\text{-8-(3-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-}$
 karbonil]-amino}-3-(4-fluoro-fenil)-propionske kiseline,
 metil (2*R*)-2- $\{[(8*S*)-1-(2,4\text{-dikloro-fenil})\text{-8-(9-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karbonil}]\text{-}$
 amino}-3-(4-fluoro-fenil)-propionske kiseline ester,
 25 metil ester (2*R*)-2- $\{[1-(2,4\text{-dikloro-fenil})\text{-8-(3-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karbonil}]\text{-}$
 amino}-3-(4-hidroksi-fenil)-propionske kiseline,
 metil ester (2*R*)-2- $\{[1\text{-cikloheksil-8-(3-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karbonil}]\text{-amino}\}$ -
 3-(4-hidroksi-fenil)-propionske kiseline,
 metil ester (2*R*)-2- $\{[1\text{-cikloheksil-8-(4-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karbonil}]\text{-amino}\}$ -
 30 3-(4-hidroksi-fenil)-propionske kiseline,
 piperidin-1-ilamid 1-(2,4-dikloro-fenil)-8-(3-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne
 kiseline,
 morfolin-4-ilamid 1-(2,4-dikloro-fenil)-8-(3-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne
 kiseline,
 35 [(2*S*)-1,3,3-trimetil-biciklo[2.2.1]hept-2-il]-amid 1-(2,4-difluoro-fenil)-8-(3-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-
 cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 [(1*S*)-1-fenil-etil]-amid (2*E*)-2-[1-(2,4-difluoro-fenil)-8-(3-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-
 3-il]-etensulfonske kiseline,
 [(1*S*)-1-fenil-etil]-amid (2*E*)-2-[8-(3-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-il]-etensulfonske
 40 kiseline,
 [(2*S*)-1,3,3-trimetil-biciklo[2.2.1]hept-2-il]-amid 1-(2,4-difluoro-fenil)-8-(4-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-
 cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 metil ester (2*R*)-2- $\{[1-(2,4\text{-difluoro-fenil})\text{-8-(4-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karbonil}]\text{-}$
 amino}-3-(4-hidroksi-fenil)-propionske kiseline,
 45 [(1*S*)-1-fenil-etil]-amid (2*E*)-2-[8-(4-fluoro-benzil)-1-metil-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-il]-
 etensulfonske kiseline,
 metil ester (2*R*)-2- $\{[8-(3\text{-kloro-benzil})\text{-1-(2,4-dikloro-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karbonil}]\text{-}$
 amino}-3-(4-hidroksi-fenil)-propionske kiseline,
 metil ester (2*R*)-2- $\{[8-(3\text{-kloro-benzil})\text{-1-(2,4-dikloro-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karbonil}]\text{-}$
 50 amino}-3-(4-fluoro-fenil)-propionske kiseline,
 [(1*S*)-1-fenil-etil]-amid (2*E*)-2-[8-(3-fluoro-benzil)-1-metil-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-il]-
 etensulfonske kiseline,
 etil ester (2*R*,3*S*)-3- $\{[1\text{-cikloheksil-8-(3-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karbonil}]\text{-}$
 amino}-biciklo[2.2.1]heptan-2-karboksilne kiseline,
 55 etil ester (2*R*,3*S*)-3- $\{[1\text{-cikloheksil-8-(4-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karbonil}]\text{-}$
 amino}-biciklo[2.2.1]heptan-2-karboksilne kiseline,
 [(1*S*)-1-fenil-etil]-amid (2*E*)-2-[1-(2,4-difluoro-fenil)-8-(4-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-
 3-il]-etensulfonske kiseline,
 [(1*S*)-1-fenil-etil]-amid (2*E*)-2-[8-(4-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-il]-etensulfonske
 60 kiseline,
 etil ester (2*R*,3*S*)-3- $\{[8-(3\text{-kloro-benzil})\text{-1-(2,4-dikloro-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karbonil}]\text{-}$
 amino}-biciklo[2.2.1]heptan-2-karboksilne kiseline,

- etil ester (2R,3S)-3-{[1-(2,4-difluoro-fenil)-8-(4-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karbonil]-amino}-biciklo[2.2.1]heptan-2-karboksilne kiseline,
- etil ester (2R,3S)-3-{[1-(2,4-difluoro-fenil)-8-(3-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karbonil]-amino}-biciklo[2.2.1]heptan-2-karboksilne kiseline,
- 5 [(1R,2S)-2-hidroksi-indan-1-il]-amid (8R)-8-(3-kloro-benzil)-1-(2,4-dikloro-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- [(1R,2S)-2-hidroksi-indan-1-il]-amid (8S)-8-(3-kloro-benzil)-1-(2,4-dikloro-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- 10 [(1R,2S)-2-hidroksi-indan-1-il]-amid (8R)-1-cikloheksil-8-(3-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- [(1R,2S)-2-hidroksi-indan-1-il]-amid (8S)-1-cikloheksil-8-(3-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- [(1R,2S)-2-hidroksi-indan-1-il]-amid (8S)-1-cikloheksil-8-(4-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- 15 piperidin-1-ilamid (2E)-2-[1-(2,4-difluoro-fenil)-8-(4-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-il]-etensulfonske kiseline,
- morfolin-4-ilamid (2E)-2-[8-(4-fluoro-benzil)-1-metil-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-il]-etensulfonske kiseline,
- benzilamid 8-(4-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- 20 benzilamid 8-(4-fluoro-benzil)-1-metansulfonil-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- [(1R)-1-fenil-etil]-amid (8E)-8-(4-kloro-benziliden)-1-(2,4-dikloro-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- [(1R)-1-cikloheksil-etil]-amid (8E)-8-(4-kloro-benziliden)-1-(2,4-dikloro-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- 25 piperidin-1-ilamid (8E)-8-(4-kloro-benziliden)-1-(2,4-dikloro-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- morfolin-4-ilamid (8E)-8-(4-kloro-benziliden)-1-(2,4-dikloro-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- 4-sulfamoi-benzilamid (8E)-8-(4-kloro-benziliden)-1-(2,4-dikloro-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- 30 (8E)-N-[8-(4-kloro-benziliden)-1-(2,4-dikloro-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karbonil]-benzensulfonamid,
- [1-(4-kloro-fenil)-etil]-amid (8E)-8-(4-kloro-benziliden)-1-(2,4-dikloro-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- 35 [(1S)-1-cikloheksil-etil]-amid (8E)-8-(4-kloro-benziliden)-1-(2,4-dikloro-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- [(1S)-1-fenil-etil]-amid (8E)-8-(4-kloro-benziliden)-1-(2,4-dikloro-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- [(1R)-1-cikloheksil-etil]-amid (8E)-8-(4-kloro-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- 40 [(1S)-1-fenil-etil]-amid (8E)-8-(4-kloro-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- [(1R)-1-fenil-etil]-amid (8E)-8-(4-kloro-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- 45 [(1S)-1-cikloheksil-etil]-amid (8E)-8-(4-kloro-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- piperidin-1-ilamid (8E)-8-(4-kloro-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- morfolin-4-ilamid (8E)-8-(4-kloro-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- 50 [(1R)-1-fenil-etil]-amid (8E)-1-(2,4-dikloro-fenil)-8-(4-fluoro-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- [(1R)-1-cikloheksil-etil]-amid (8E)-1-(2,4-dikloro-fenil)-8-(4-fluoro-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- [(1S)-1-cikloheksil-etil]-amid (8E)-1-(2,4-dikloro-fenil)-8-(4-fluoro-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- 55 [(1S)-1-fenil-etil]-amid (8E)-1-(2,4-dikloro-fenil)-8-(4-fluoro-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- piperidin-1-ilamid (8E)-1-(2,4-dikloro-fenil)-8-(4-fluoro-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- morfolin-4-ilamid (8E)-1-(2,4-dikloro-fenil)-8-(4-fluoro-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- 60 piridin-2-ilamid (8E)-8-(4-kloro-benziliden)-1-(2,4-dikloro-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,

(piridin-2-ilmetil)-amid (8E)-8-(4-kloro-benziliden)-1-(2,4-dikloro-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 (piridin-4-ilmetil)-amid (8E)-8-(4-kloro-benziliden)-1-(2,4-dikloro-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 5 (2-piridin-2-il-etil)-amid (8E)-8-(4-kloro-benziliden)-1-(2,4-dikloro-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 [(1S)-1-fenil-etil]-amid (2E)-2-[8-(3-kloro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-il]-etensulfonske kiseline,
 [(1S)-2-hidroksi-1-fenil-etil]-amid 8-(3-kloro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 10 [(1R)-2-hidroksi-1-fenil-etil]-amid 8-(3-kloro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 [(1S)-1-benzil-2-hidroksi-etil]-amid 8-(3-kloro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 15 [(1R)-1-benzil-2-hidroksi-etil]-amid 8-(3-kloro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 [(1S)-2-kloro-1-fenil-etil]-amid 1-(2,4-difluoro-fenil)-8-(4-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 [(1R)-1-cikloheksil-etil]-amid (8E)-8-(4-kloro-benziliden)-1-piridin-4-il-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 20 [(1S)-1-cikloheksil-etil]-amid (8E)-8-(4-kloro-benziliden)-1-piridin-4-il-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 [(1R)-1-fenil-etil]-amid (8E)-8-(4-kloro-benziliden)-1-(4-sulfamoil-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 25 [(1R)-1-cikloheksil-etil]-amid (8E)-8-(4-kloro-benziliden)-1-(4-sulfamoil-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 [(1R)-1-benzil-2-hidroksi-etil]-amid 8-(3-kloro-benzil)-1-(4-trifluorometil-pirimidin-2-il)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 (8E)-[1-(2,4-dikloro-fenil)-8-(4-fluoro-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-il]-(2-piridin-2-il-pirolidin-1-il)-metanon,
 30 [(1R)-1-cikloheksil-etil]-amid (8E)-8-(4-kloro-benziliden)-1-(2-kloro-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 [(1R)-1-fenil-etil]-amid (8E)-8-(4-kloro-benziliden)-1-(2-kloro-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 35 [(1R)-1-fenil-etil]-amid (8E)-8-(4-kloro-benziliden)-1-(2,5-dikloro-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 [(1R)-1-cikloheksil-etil]-amid (8E)-8-(4-kloro-benziliden)-1-(2,5-dikloro-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 40 [(1S)-1-cikloheksil-etil]-amid (8E)-8-(4-kloro-benziliden)-1-(2,5-dikloro-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 [(1S)-1-fenil-etil]-amid (8E)-8-(4-kloro-benziliden)-1-(2,5-dikloro-fenil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 [(1R)-1-fenil-propil]-amid (8E)-1-(2,4-dikloro-fenil)-8-(4-fluoro-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 45 [(1S)-2-hidroksi-1-fenil-etil]-amid (8E)-1-(2,4-dikloro-fenil)-8-(4-fluoro-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 (1-metil-1-fenil-etil)-amid (8E)-1-(2,4-dikloro-fenil)-8-(4-fluoro-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 (8E)-[1-(2,4-dikloro-fenil)-8-(4-fluoro-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-il]-(3,4,5,6-tetrahidro-2H-[2,2']bipiridinil-1-il)-metanon,
 50 [(1R)-indan-1-ilamid (8E)-1-(2,4-dikloro-fenil)-8-(4-fluoro-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 [(1S,2R)-2-hidroksi-indan-1-il]-amid (8E)-1-(2,4-dikloro-fenil)-8-(4-fluoro-benzilidne)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 55 (1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il)-amid (8E)-1-(2,4-dikloro-fenil)-8-(4-fluoro-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 (piridin-2-ilmetil)-amid (8E)-1-(2,4-dikloro-fenil)-8-(4-metoksi-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 (1-metil-1-fenil-etil)-amid (8E)-1-(2,4-dikloro-fenil)-8-(4-metoksi-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
 60 [(1R)-1-fenil-etil]-amid (8E)-1-(2,4-dikloro-fenil)-8-(4-metoksi-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,

- [(1S)-1-fenil-etil]-amid (8E)-1-(2,4-dikloro-fenil)-8-(4-metoksi-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- [(1R)-1-cikloheksil-etil]-amid (8E)-1-(2,4-dikloro-fenil)-8-(4-metoksi-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- 5 [(1S)-2-hidroksil-fenil-etil]-amid (8E)-1-(2,4-dikloro-fenil)-8-(4-metoksi-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- (1R)-indan-1-ilamid (8E)-1-(2,4-dikloro-fenil)-8-(4-metoksi-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- 10 piperidin-1-ilamid (8E)-1-(2,4-dikloro-fenil)-8-(4-metoksi-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- (1-piridin-2-il-etil)-amid (8E)-1-(2,4-dikloro-fenil)-8-(4-metoksi-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- (8E)-[8-(4-kloro-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-il]-piperidin-1-il-metanon,
- (1-piridin-2-il-etil)-amid (8E)-1-(2,4-dikloro-fenil)-8-(4-fluoro-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- 15 [(1R)-1-piridin-2-il-etil]-amid (8E)-1-(2,4-dikloro-fenil)-8-(4-fluoro-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- (heksahidro-ciklopenta[c]pirol-2-il)-amid (8E)-1-(2,4-dikloro-fenil)-8-(4-metoksi-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- 20 [(1R)-1-piridin-2-il-etil]-amid (8E)-1-(2,4-dikloro-fenil)-8-(4-metoksi-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- [(1R)-2-hidroksi-1-fenil-etil]-amid (8S)-8-(3-kloro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- [(1R)-2-hidroksi-1-fenil-etil]-amid (8R)-8-(3-kloro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- 25 [(1S)-2-hidroksi-1-fenil-etil]-amid (8R)-8-(3-kloro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- [(1S)-2-hidroksi-1-fenil-etil]-amid (8S)-8-(3-kloro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- 30 [(1S)-1-fenil-etil]-amid (2E)-2-[(8R)-8-(3-fluoro-benzil)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-il]-etensulfonske kiseline,
- [(1R)-2-hidroksi-1-fenil-etil]-amid (8E)-8-(4-kloro-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- [(1S)-1-fenil-etil]-amid (2E,8E)-2-[8-(4-kloro-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-il]-etensulfonske kiseline,
- 35 metil ester (8E)-(2S)-2-[[8-(4-kloro-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karbonil]-amino]-3-(4-fluoro-fenil)-propionske kiseline,
- [(1R)-2-hidroksi-1-fenil-etil]-amid (8E)-8-(3-kloro-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- 40 metil ester (8E)-(2S)-2-[[8-(3-kloro-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karbonil]-amino]-3-(4-fluoro-fenil)-propionske kiseline,
- metil ester (8E)-(2S)-2-[[8-(3-fluoro-benziliden)-1-metil-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karbonil]-amino]-3-(4-fluoro-fenil)-propionske kiseline,
- [(1R)-2-hidroksi-1-fenil-etil]-amid (8E)-8-(3-fluoro-benziliden)-1-metil-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- 45 [1-hidroksimetil-2-(4-hidroksi-fenil)-etil]-amid (8E)-(2S)-8-(3-fluoro-benziliden)-1-metil-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karboksilne kiseline,
- metil ester (8E)-(2R)-2-[[8-(3-kloro-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karbonil]-amino]-3-(4-fluoro-fenil)-propionske kiseline,
- 50 metil ester (8E)-(2R)-2-[[8-(4-kloro-benziliden)-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karbonil]-amino]-3-(4-fluoro-fenil)-propionske kiseline, ili
- metil ester (8E)-(2R)-2-[[8-(3-fluoro-benziliden)-1-metil-1,4,5,6,7,8-heksahidro-cikloheptapirazol-3-karbonil]-amino]-3-(4-fluoro-fenil)-propionske kiseline.
19. Spoj prema zahtjevu 1 **naznačen time** da je za upotrebu u postupku za liječenje, ublažavanje ili sprječavanje sindroma, poremećaja ili bolesti posredovanih sa kanabinoidnim receptorom kod subjekta kojem je to potrebno, navedeni postupak sadrži korak davanja subjektu učinkovite količine navedenog spoja.
20. Spoj prema zahtjevu 19 **naznačen time** da kanabinoidni receptor je CB1 ili CB2 receptor, te spoj prema zahtjevu 1 je agonist, antagonist ili inverzni-agonist receptora.
21. Spoj prema zahtjevu 19 **naznačen time** da sindrom, poremećaj ili bolest je povezana sa apetitom, metabolizmom, dijabetesom, intraokularnim tlakom u vezi sa glaukomom, socijalnim poremećajima i poremećajima raspoloženja, napadima, zloupotrebom tvari, učenjem, opažanjem i/ili pamćenjem, kontrakcijom organa ili mišićnim spazmom,

crijevnim poremećajima, respiratornim poremećajima, poremećajima lokomotorne aktivnosti ili poremećajima kretanja, imunološkim poremećajima ili upalnim poremećajima, nereguliranim rastom stanica ili neurozaštitom.

22. Spoj prema zahtjevu 19 **naznačen time** da učinkovita količina spoja prema zahtjevu 1 je od oko 0.001 mg/kg/danu do oko 300 mg/kg/danu.
- 5 23. Spoj prema zahtjevu 19 **naznačen time** da navedeni postupak nadalje sadrži liječenje, ublažavanje ili sprječavanje sindroma, poremećaja ili bolesti u vezi sa apetitom, pretilošću ili metabolizmom u kojima posreduje inverzni-agonist CB1 receptora, kod subjekta kojem je to potrebno pri čemu navedeni postupak sadrži korak davanja subjektu učinkovite količine CB1 inverznog-agonista spoja prema zahtjevu 1.
- 10 24. Spoj prema zahtjevu 23 **naznačen time** da učinkovita količina spoja prema zahtjevu 1 je od oko 0.001 mg/kg/danu do oko 300 mg/kg/danu.
25. Spoj prema zahtjevu 19 **naznačen time** da navedeni postupak nadalje sadrži korak davanja subjektu kombinacijskog produkta i/ili terapije koja sadrži učinkovitu količinu spoja prema zahtjevu 1 i terapijsko sredstvo.
26. Spoj prema zahtjevu 25 **naznačen time** da terapijsko sredstvo je antikonvulziv ili kontracepcijsko sredstvo.
- 15 27. Spoj prema zahtjevu 26 **naznačen time** da antikonvulziv je topiramat, analog 3 topiramata, karbamazepin, valproična kiselina, lamotrigin, gabapentin, fenitoin i slično i njihove smjese ili farmaceutski prihvatljive soli.
28. Spoj prema zahtjevu 26 **naznačen time** da kontracepcijsko sredstvo je samo kontraceptiv progestin, kontraceptiv koji ima komponentu progestina i komponentu 10 estrogena, ili oralni kontraceptiv koji proizvoljno sadrži komponentu folne kiseline.
- 20 29. Pripravak za upotrebu u postupku kontracepcije subjekta, te je navedeni postupak **naznačen time** da sadrži korak davanja subjektu pripravka, pri čemu pripravak sadrži kontracepcijsko sredstvo i inverzni-agonist ili antagonist CB1 receptora spoja prema zahtjevu 1, pri čemu pripravak smanjuje želju za pušenjem kod subjekta i/ili pomaže subjektu kod gubitka težine.