(19) SUOMI - FINLAND
(FI)

PATENTTI- JA REKISTERIHALLITUS
PATENT- OCH REGISTERSTYRELSEN
FINNISH PATENT AND REGISTRATION OFFICE

(10) **FI/EP4192812 T3**

(12) **EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS**
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION

(45) Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning - Translation available to the public **29.11.2024**

(97) Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för det europeiska patentet - Date of grant of European patent **04.09.2024**

(51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering - International patent classification
C07D 213/75 (2006 . 01)
C07D 213/81 (2006 . 01)
C07D 401/12 (2006 . 01)
C07D 405/12 (2006 . 01)
C07D 409/12 (2006 . 01)
C07D 413/12 (2006 . 01)
C07D 417/12 (2006 . 01)
C07D 453/02 (2006 . 01)
C07D 513/04 (2006 . 01)
A61K 31/443 (2006 . 01)
A61P 37/02 (2006 . 01)
C07D 471/04 (2006 . 01)
C07D 487/08 (2006 . 01)

(96) Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan - European patent application EP22741485.1

(22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date **30.06.2022**

(97) Patenttihakemuksen julkiseksitulopäivä - Patentansökans publiceringsdag - Patent application available to the public **14.06.2023**

(86) Kansainvälinen hakemus - Internationell ansökan - International application **30.06.2022 PCT/EP2022068212**

(30) Etuoikeus - Prioritet - Priority

30.06.2021 EP EP21182956
01.07.2021 EP EP21183316
02.07.2021 US US202163217783 P
17.12.2021 WO WOPCT/EP2021/086674
07.06.2022 WO WOPCT/EP2022/065437

(73) Haltija - Innehavare - Holder
1• Zedira GmbH , Rösslerstrasse 83 , 64293 Darmstadt , (DE)

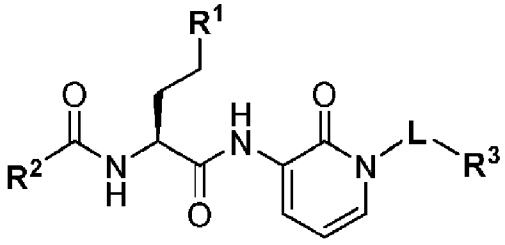
(72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor
1• PASTERNACK, Ralf , 64347 Griesheim , (DE)
2• BÜCHOLD, Christian , 61184 Karben , (DE)
3• HILS, Martin , 64295 Darmstadt , (DE)
4• STIELER, Martin , 64285 Darmstadt , (DE)
5• GERLACH, Uwe , 65795 Hattersheim , (DE)

(74) Asiamies - Ombud - Agent
Papula Oy , P.O.Box 981 , 00101 Helsinki , (FI)

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention
TRANSGLUTAMINAASIEN ESTÄJIÄ
INHIBITORS OF TRANSGLUTAMINASES

PATENTTIVAATIMUKSET

1. Yhdiste, jolla on yleiskaava (I):



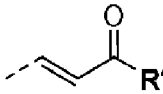
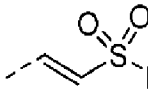
(I)

jossa

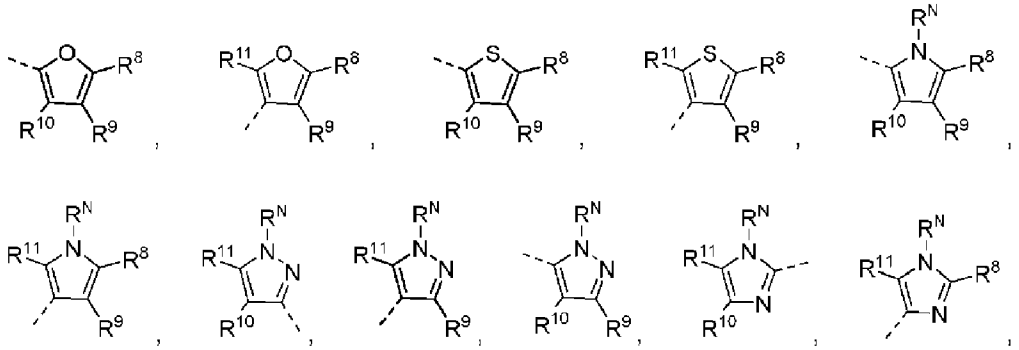
L on $-L^1-$ tai $-L^1-L^2-$; ja edullisesti $-L^1-L^2-$;

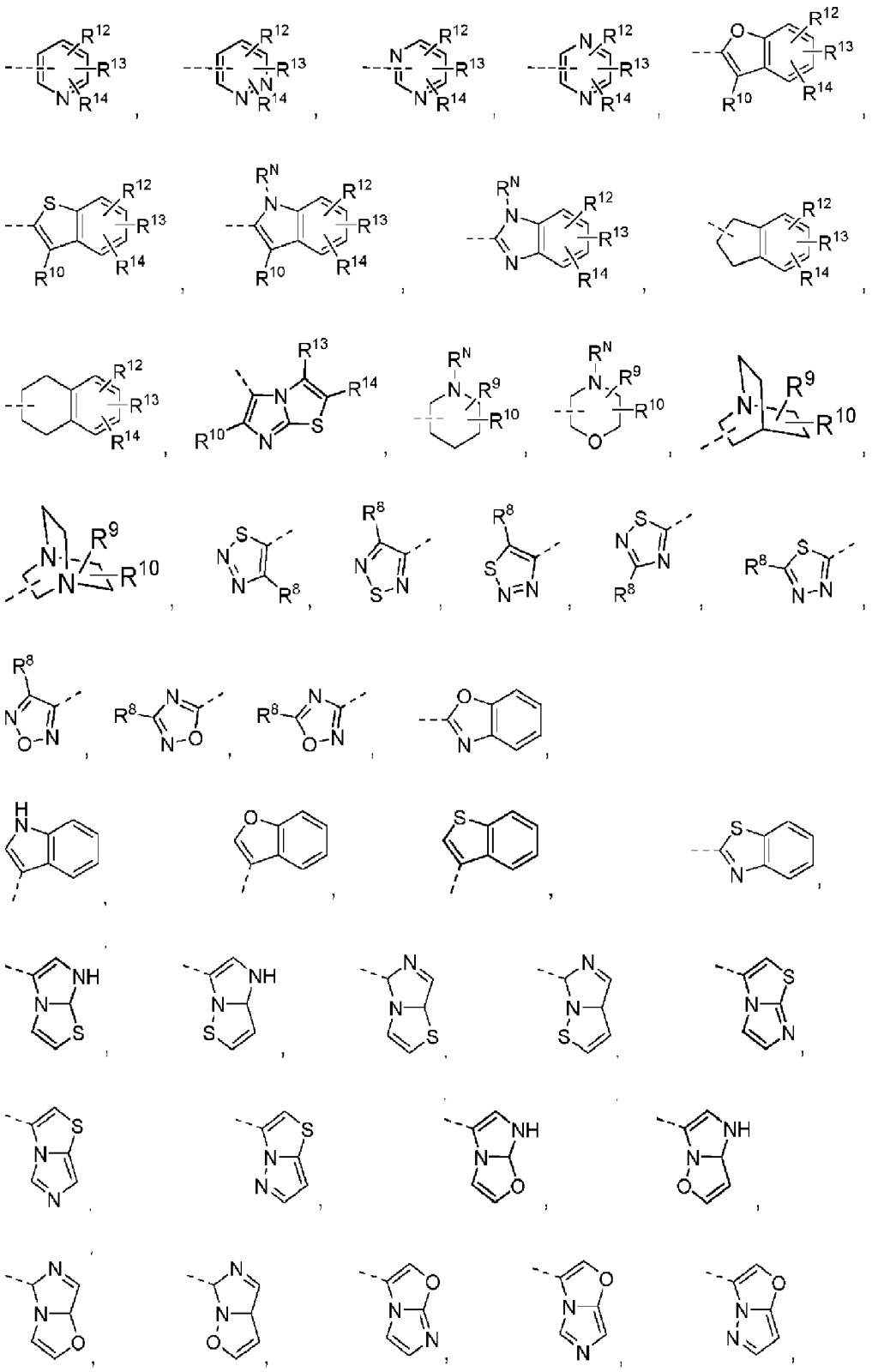
L^1 on $-CH_2-$, $-CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CO-$ tai $-CH_2CH_2CO-$;

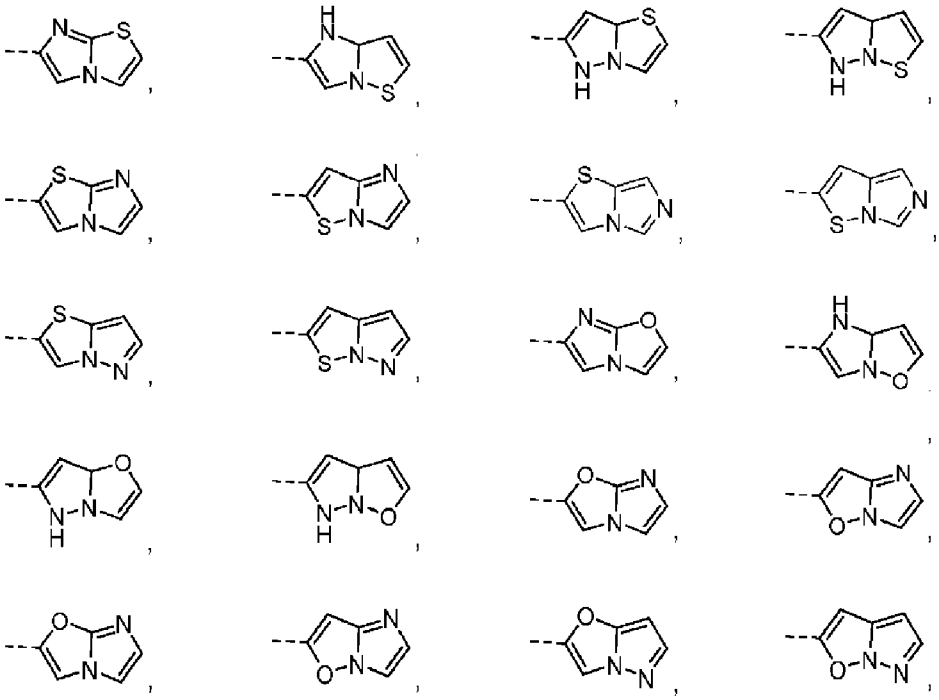
L^2 on sidos, $-NR^{N1}-$, $-NR^{N1}CH_2-$, $-NR^{N1}CH_2CH_2-$ tai $-NR^{N1}CH(CH_3)-$;

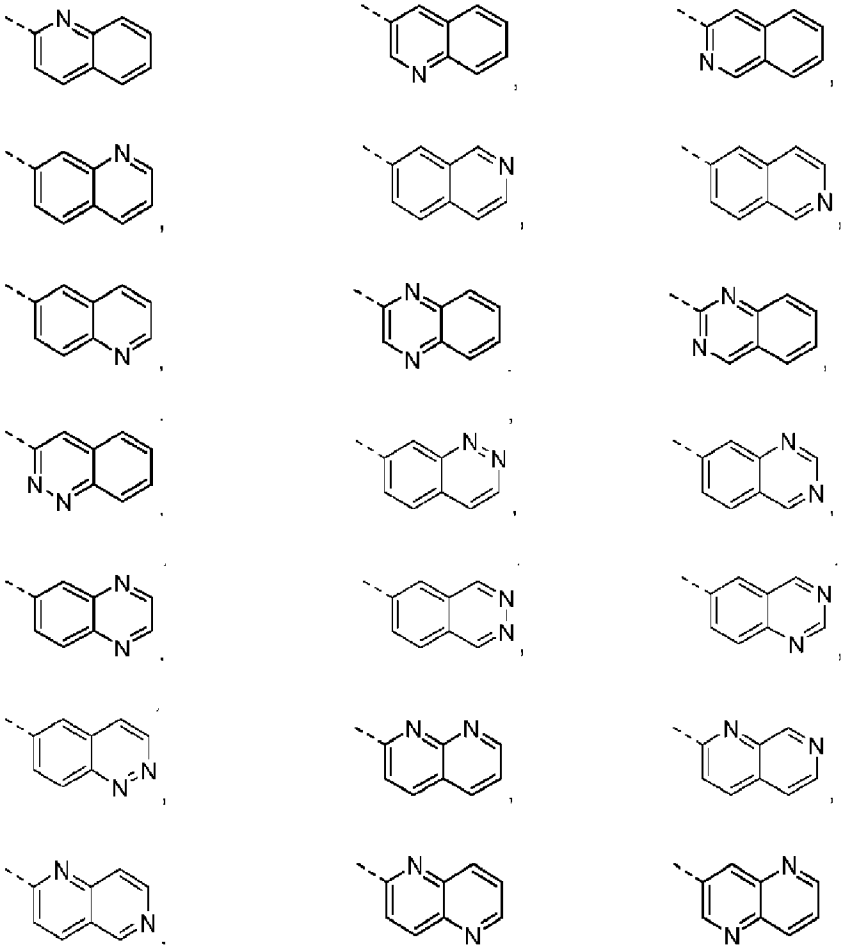
R^1 on , tai ;

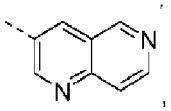
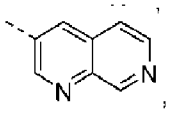
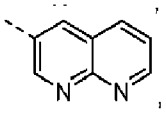
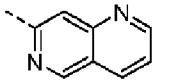
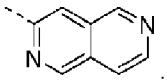
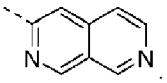
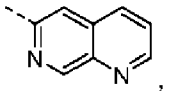
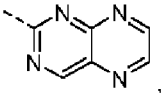
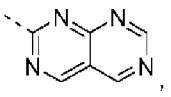
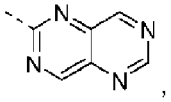
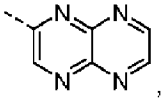
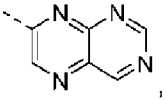
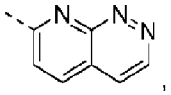
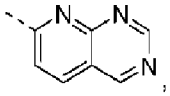
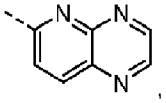
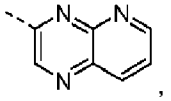
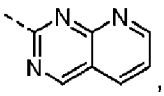
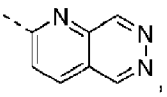
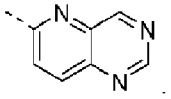
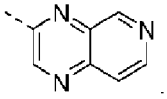
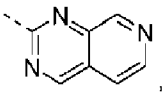
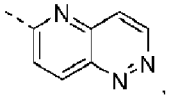
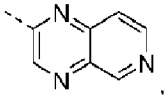
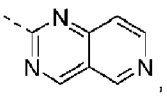
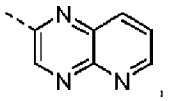
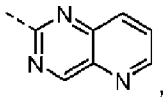
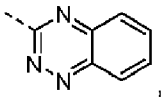
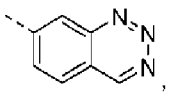
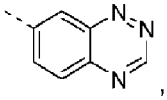
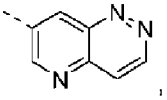
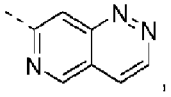
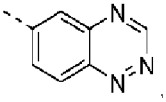
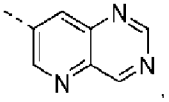
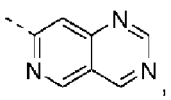
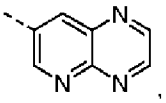
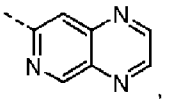
R^2 on

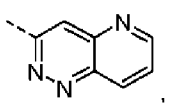
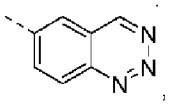
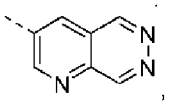
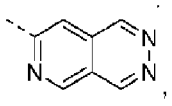
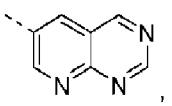
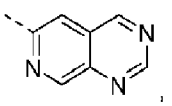
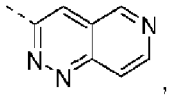
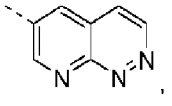
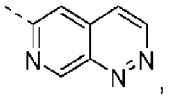
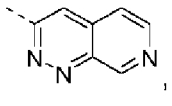
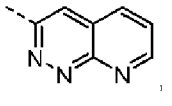
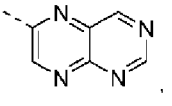
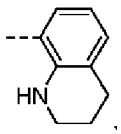
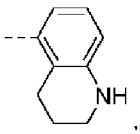
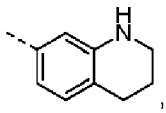
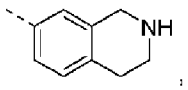
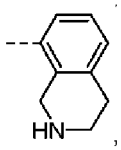
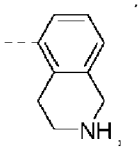
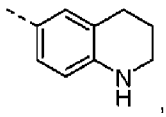
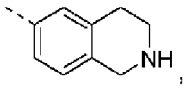
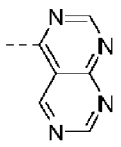
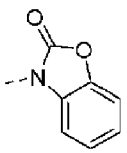
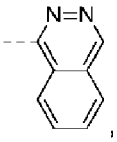
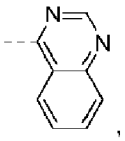
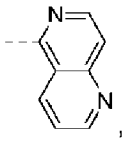
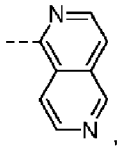
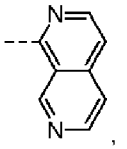
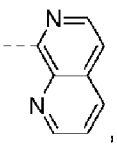
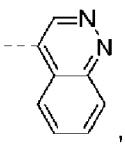
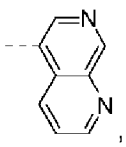
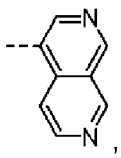
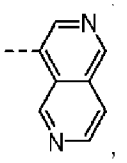
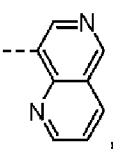
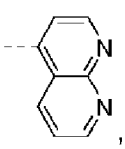
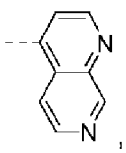
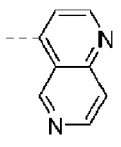
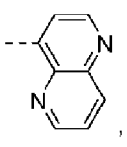
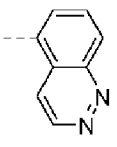
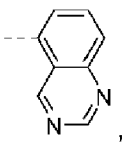
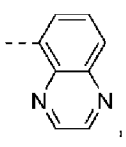


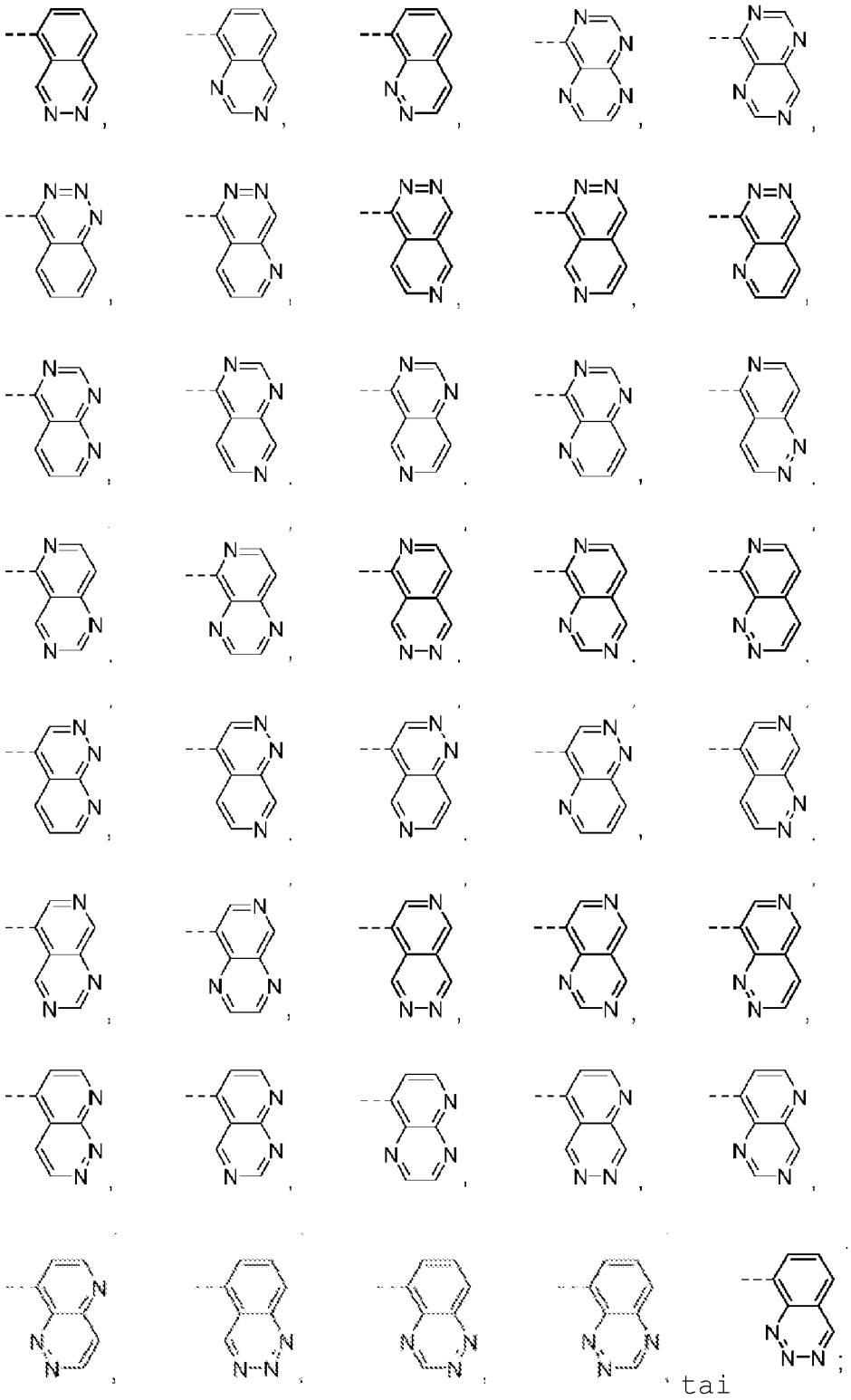








tai

jossa substituoimattomat bisykliset tähteet voi olla substituoitu 1-5:llä substituenteista R^9-R^{14}, R^N; ja edullisesti 1-3:lla substituenteista R^{11}-R^{13};

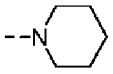
R^3 on bisyklo[1.1.1]pentyyli, bisyklo[2.1.1]heksyyli, bisyklo[2.2.1]heptyyli, bisyklo[3.1.1]heptyyli, bisyklo[2.2.2]oktyyli, bisyklo[3.2.1]oktyyli, bisyklo[3.2.2]nonyyli, bisyklo[3.3.2]dekyyli, bisyklo[3.3.3]undekyyli, 4-homoisotwistyyli, adamantyyli, diamantyyli, heksametyleenitetraminyyli, ja edellä mainitut tähteet sisältävät valinnaisesti yhden tai useamman C=C-kaksoissidoksen ja/tai ne on substituoitu yhdellä tai useammalla R^a:sta, R^b:stä, R^c:stä, R^d:stä ja R^e:stä;

R^a, R^b, R^c, R^d ja R^e ovat toisistaan riippumattomasti -H, -F, -Cl, -Br, -CN, -OH, $-CH_3$, $-CH_2CH_3$, $-CH_2CH_2CH_3$, $-CH(CH_3)_2$, $-CHF_2$, $-CF_3$, $-CH_2CF_3$, $-COCH_3$, $-COCH_2CH_3$, $-CO_2H$, $-CO_2CH_3$, $-CO_2C_2H_5$, $-CONH_2$, $-CONHCH_3$, $-CON(CH_3)_2$, $-CONHC_2H_5$, $-CH_2CO_2H$, $-CH_2CO_2CH_3$, $-CH_2CO_2C_2H_5$, $-CH_2CONH_2$, $-CH_2CONHCH_3$, $-CH_2CON(CH_3)_2$, $-CH_2CONHC_2H_5$, $-NHCOCH_3$, $-NHCOC_2H_5$, $-NHCOCF_3$, $-NHCOCH_2CF_3$, $-NHSO_2CH_3$, $-NHSO_2C_2H_5$, $-NHSO_2CHF_2$, $-NHSO_2CF_3$ tai $-NHSO_2CH_2CF_3$;

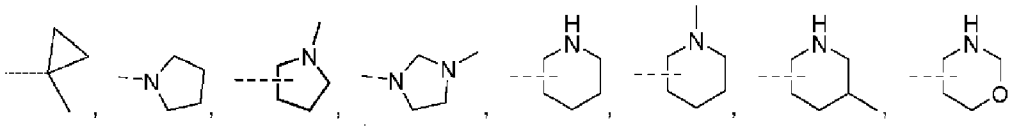
R^4 on $-R^5$, $-OR^5$ tai $-NR^6R^7$;

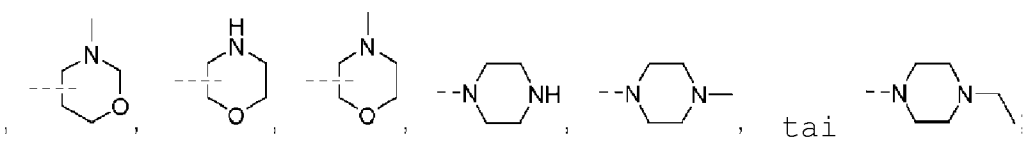
R^5 on -H, $-CH_3$, $-CH_2CH_3$, $-CH_2CH_2CH_3$, $-CH(CH_3)_2$, $-CH_2CH_2CH_2CH_3$, $-CH_2CH(CH_3)_2$, $-C(CH_3)_3$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$, $-CH_2CH=CH_2$, $-CH_2CH=CH(CH_3)$, $-CH_2CH=C(CH_3)_2$, $-CH_2CH=CHCH_2CH_3$, -syklo-C_3H_5, -syklo-C_4H_7, -syklo-C_5H_9, -syklo-C_6H_{11}, $-CH_2$-syklo-C_3H_5, $-CH_2$-syklo-C_4H_7, $-CH_2$-syklo-C_5H_9, $-CH_2$-syklo-C_6H_{11}, -Ph, $-CH_2$-Ph, $-CH_2OCH_3$, $-CH_2OCH_2CH_3$, $-CH_2CH_2OCH_3$ tai $-CH_2CH_2OCH_2CH_3$;

R^6 ja R^7 ovat toisistaan riippumattomasti -H, $-CH_3$, $-CH_2CH_3$, $-CH_2CH_2CH_3$, $-CH(CH_3)_2$, $-CH_2CH_2CH_2CH_3$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$, $-CH_2CH(CH_3)_2$, $-C(CH_3)_3$, $-CH_2CH=CH_2$, $-CH_2CH=CH(CH_3)$, $-CH_2CH=C(CH_3)_2$, $-CH_2CH=CHCH_2CH_3$, -syklo-C_3H_5, -syklo-C_4H_7, -syklo-C_5H_9, -syklo-C_6H_{11}, $-CH_2$-syklo-C_3H_5, $-CH_2$-syklo-C_4H_7, $-CH_2$-syklo-C_5H_9, $-CH_2$-syklo-C_6H_{11}, -Ph, $-CH_2$-Ph, $-CH_2OCH_3$, $-CH_2OCH_2CH_3$, $-CH_2CH_2OCH_3$, $-CH_2CH_2OCH_2CH_3$, $-CH_2CH_2NHCH_3$, tai $-CH_2CH_2N(CH_3)_2$,

tai -NR^6R^7 on , tai ;

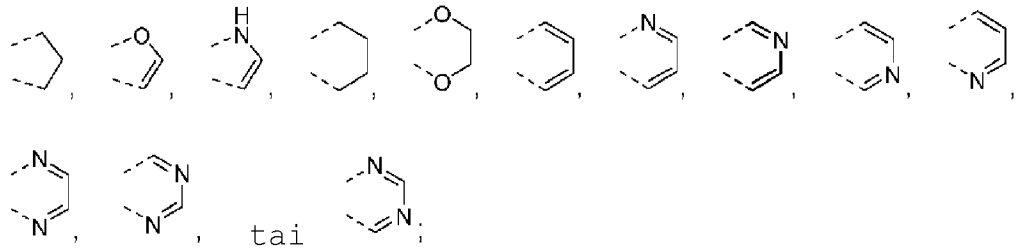
R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13} ja R^{14} ovat toisistaan riippumattomasti -H, -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -CN, -NO_2, -CH_3, -C_2H_5, -C_3H_7, -$CH(CH_3)_2$, -C_4H_9, -CH_2-$CH(CH_3)_2$, -$CH(CH_3)$-C_2H_5, -$C(CH_3)_3$, -syklo-C_3H_5, -CH_2-syklo-C_3H_5, -CH_2OH, -CH_2F, -CHF_2, -CF_3, -CH_2Cl, -CH_2Br, -CH_2I, -CH_2-CH_2F, -CH_2-CHF_2, -CH_2-CF_3, -CH_2-CH_2Cl, -CH_2-CH_2Br, -CH_2-CH_2I, -OCH_3, -OC_2H_5, -OC_3H_7, -$OCH(CH_3)_2$, -$OC(CH_3)_3$, -OC_4H_9, -$OCHF_2$, -OCF_3, -OCH_2CF_3, -OC_2F_5, -OCH_2OCH_3, -O-syklo-C_3H_5, -OCH_2-syklo-C_3H_5, -O-C_2H_4-syklo-C_3H_5, -CHO, -$COCH_3$, -$COCF_3$, -COC_2H_5, -COC_3H_7, -$COCH(CH_3)_2$, -$COC(CH_3)_3$, -COOH, -$COOCH_3$, -$COOC_2H_5$, -$COOC_3H_7$, -$COOCH(CH_3)_2$, -$COOC(CH_3)_3$, -OOC-CH_3, -OOC-CF_3, -OOC-C_2H_5, -OOC-C_3H_7, -OOC-$CH(CH_3)_2$, -OOC-$C(CH_3)_3$, -NH_2, -$NHCH_3$, -NHC_2H_5, -NHC_3H_7, -$NHCH(CH_3)_2$, -$NHC(CH_3)_3$, -$N(CH_3)_2$, -$N(C_2H_5)_2$, -$N(C_3H_7)_2$, -$N[CH(CH_3)_2]_2$, -$N[C(CH_3)_3]_2$, -$NHCOCH_3$, -$NHCOCF_3$, -$NHCOC_2H_5$, -$NHCOC_3H_7$, -$NHCOCH(CH_3)_2$, -$NHCOC(CH_3)_3$, -$CONH_2$, -$CONHCH_3$, -$CONHC_2H_5$, -$CONHC_3H_7$, -$CONHCH(CH_3)_2$, -CONH-syklo-C_3H_5, -$CONHC(CH_3)_3$, -$CON(CH_3)_2$, -$CON(C_2H_5)_2$, -$CON(C_3H_7)_2$, -$CON[CH(CH_3)_2]_2$, -$CON[C(CH_3)_3]_2$, -SO_2NH_2, -SO_2NHCH_3, -$SO_2NHC_2H_5$, -$SO_2NHC_3H_7$, -$SO_2NHCH(CH_3)_2$, -SO_2NH-syklo-C_3H_5, -$SO_2NHC(CH_3)_3$, -$SO_2N(CH_3)_2$, -$SO_2N(C_2H_5)_2$, -$SO_2N(C_3H_7)_2$, -$SO_2N[CH(CH_3)_2]_2$, -$SO_2N[C(CH_3)_3]_2$, -$NHSO_2CH_3$, -$NHSO_2CF_3$, -$NHSO_2C_2H_5$, -$NHSO_2C_3H_7$, -$NHSO_2CH(CH_3)_2$, -$NHSO_2C(CH_3)_3$, -$CH=CH_2$, -CH_2-$CH=CH_2$, -$C(CH_3)=CH_2$, -$CH=CH-CH_3$, -$C\equiv CH$, -$C\equiv C-CH_3$, -CH_2-$C\equiv CH$, -Ph, -O-Ph, -O-CH_2-Ph,



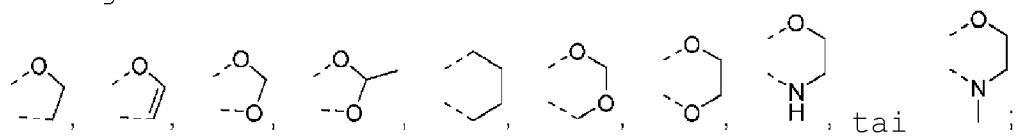


tai ;

tai R^8 ja R^9 tai R^9 ja R^{10} voivat yhdessä muodostaa jonkin seuraavista viisijäsenisistä tai kuusijäsenisistä renkaista:



tai R^{12} ja R^{13} tai R^{13} ja R^{14} voivat yhdessä muodostaa jonkin seuraavista viisijäsenisistä tai kuusijäsenisistä renkaista:

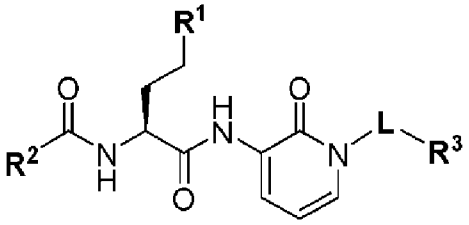


R^N on -H, $-CH_3$, $-C_2H_5$, $-C_3H_7$, $-CH(CH_3)_2$, $-C_4H_9$, $-CH_2-CH(CH_3)_2$, $-CH(CH_3)-C_2H_5$, $-C(CH_3)_3$, -syklo-C_3H_5, -syklo-C_4H_7, -syklo-C_5H_9, $-CH_2$-syklo-C_3H_5, $-CH_2$-syklo-C_4H_7, $-CH_2$-syklo-C_5H_9, $-CH_2F$, $-CHF_2$, $-CF_3$, $-CH_2Cl$, $-CH_2Br$, $-CH_2I$, $-CH_2-CH_2F$, $-CH_2-CHF_2$, $-CH_2-CF_3$, $-CH_2-CH_2Cl$, $-CH_2-CH_2Br$, $-CH_2-CH_2I$, $-CH_2-CH=CH_2$, $-CH_2-C\equiv CH$, -CHO, $-COCH_3$, $-COC_2H_5$, $-COC_3H_7$, $-COCH(CH_3)_2$, $-COC(CH_3)_3$, -CO-syklo-C_3H_5, -CO-syklo-C_4H_7, -CO-syklo-C_5H_9, $-COOCH_3$, $-COOC_2H_5$, $-COOC_3H_7$, $-COOCH(CH_3)_2$, $-COOC(CH_3)_3$, $-COOCH_2Ph$, $-SO_2CH_3$, $-SO_2CF_3$, $-SO_2C_2H_5$, $-SO_2C_3H_7$, $-SO_2CH(CH_3)_2$, $-SO_2$-syklo-C_3H_5, tai $-SO_2C(CH_3)_3$;

R^{N1} on -H, $-CH_3$ tai $-CH_2CH_3$;

tai sen diastereomeeri, enantiomeeri, diastereomeerien seos, enantiomeerien seos, rasemaatti, solvaatti, hydraatti tai farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, jossa yhdisteellä on kaava (I):



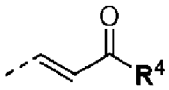
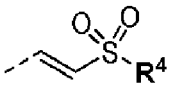
(I)

jossa

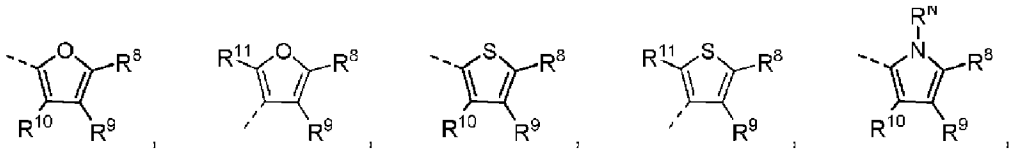
L on $-L^1-$ tai $-L^1-L^2-$; ja edullisesti $-L^1-L^2-$;

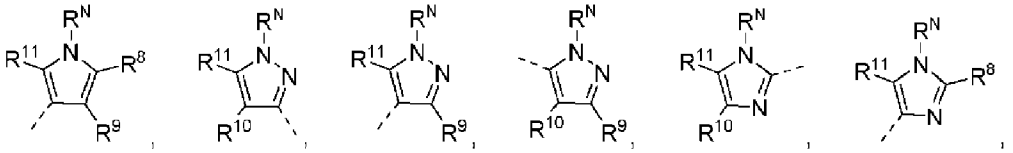
L^1 on $-CH_2-$, $-CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CO-$ tai $-CH_2CH_2CO-$;

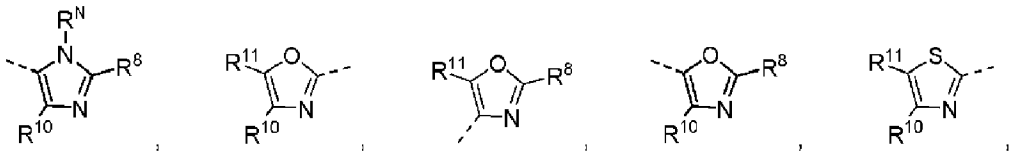
L^2 on sidos, $-NR^{N1}-$, $-NR^{N1}CH_2-$, $-NR^{N1}CH_2CH_2-$ tai $-NR^{N1}CH(CH_3)-$;

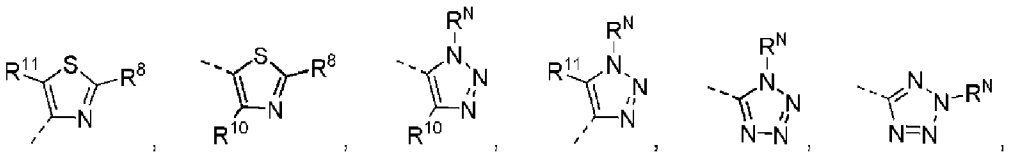
R^1 on  tai ;

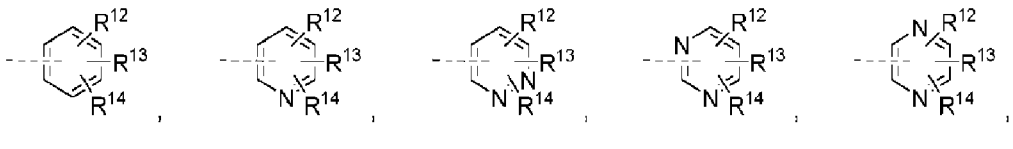
R^2 on

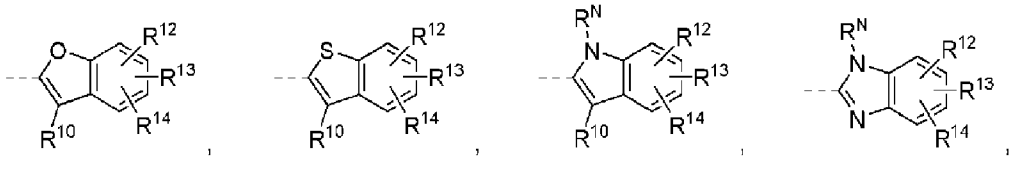


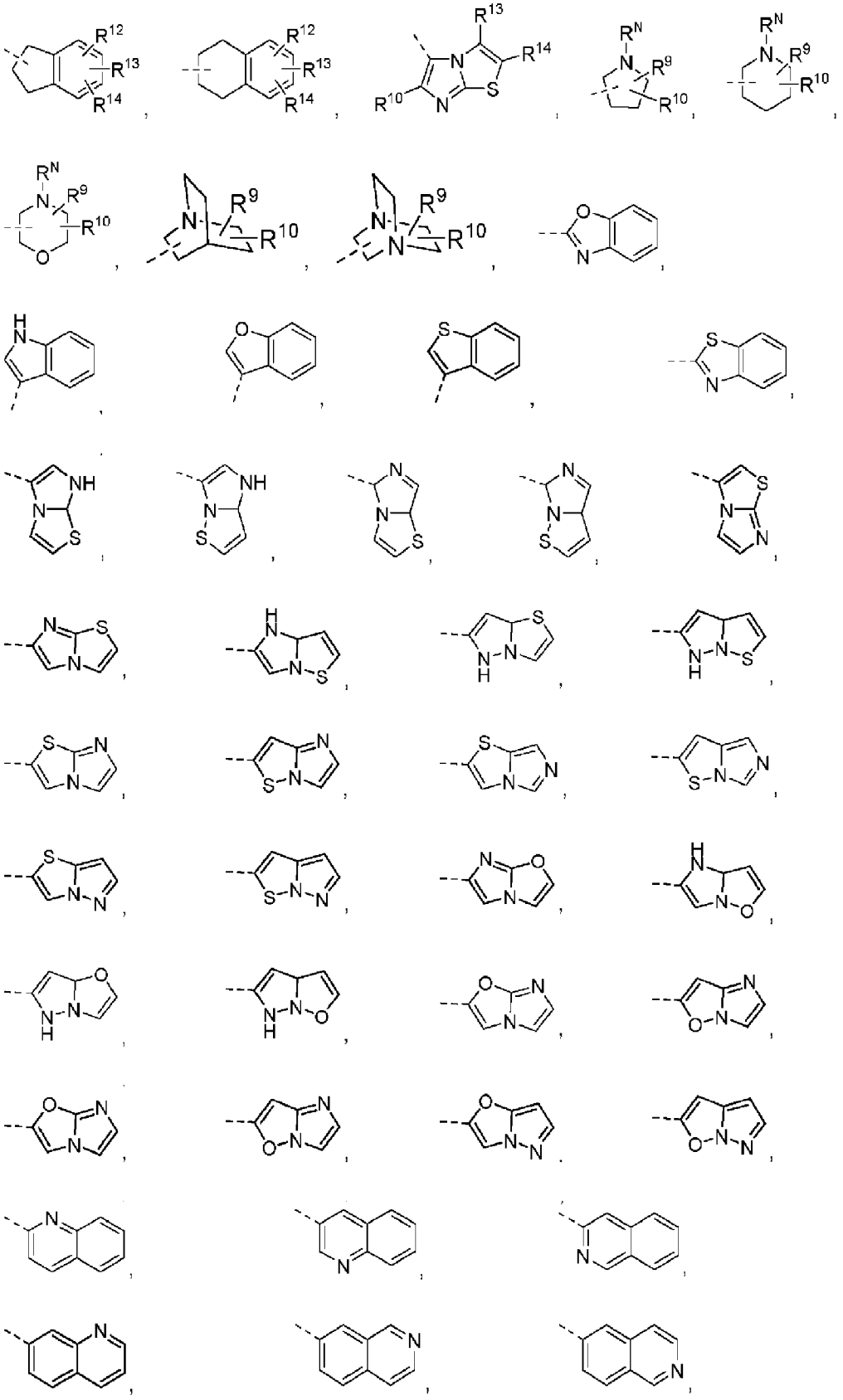


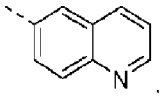
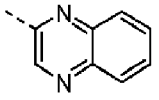
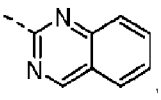
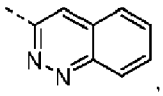
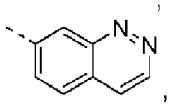
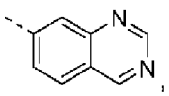
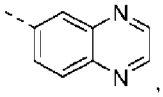
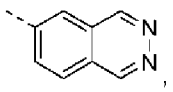
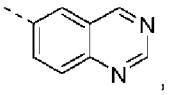
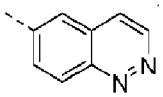
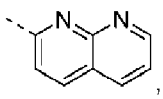
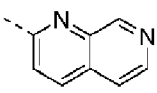
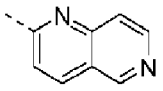
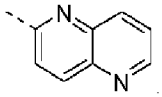
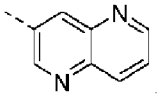
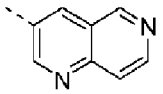
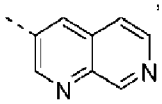
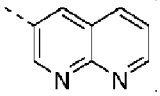
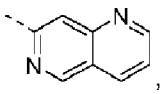
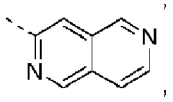
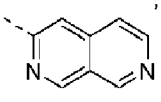
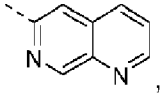
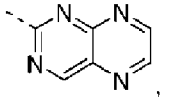
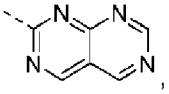
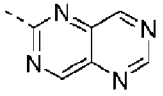
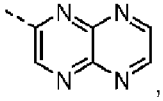
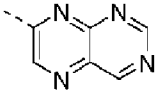
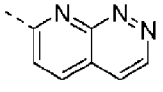
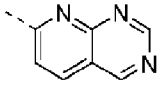
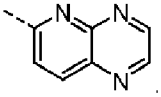
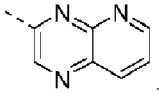
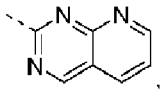
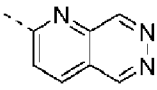
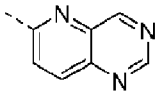
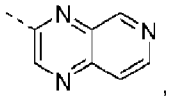
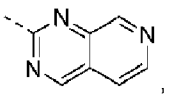


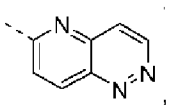
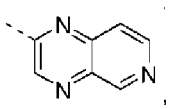
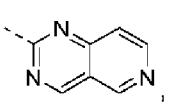
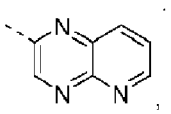
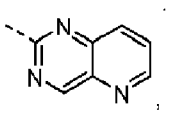
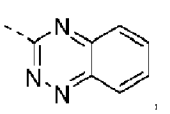
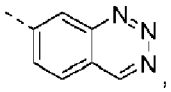
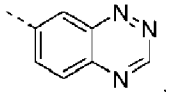
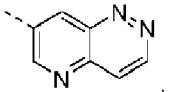
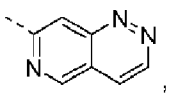
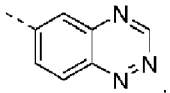
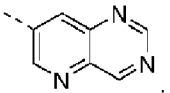
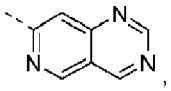
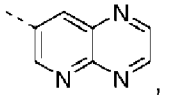
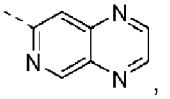
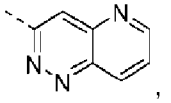
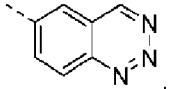
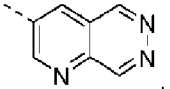
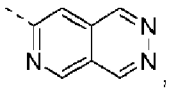
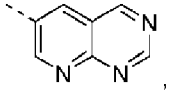
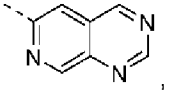
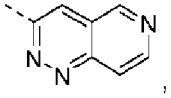
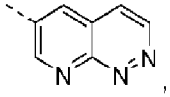
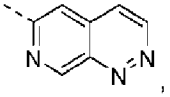
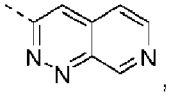
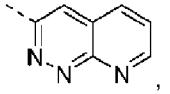
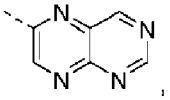
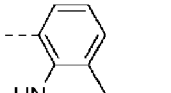


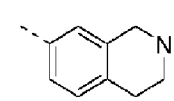
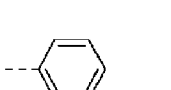


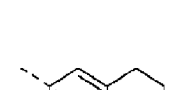
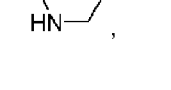


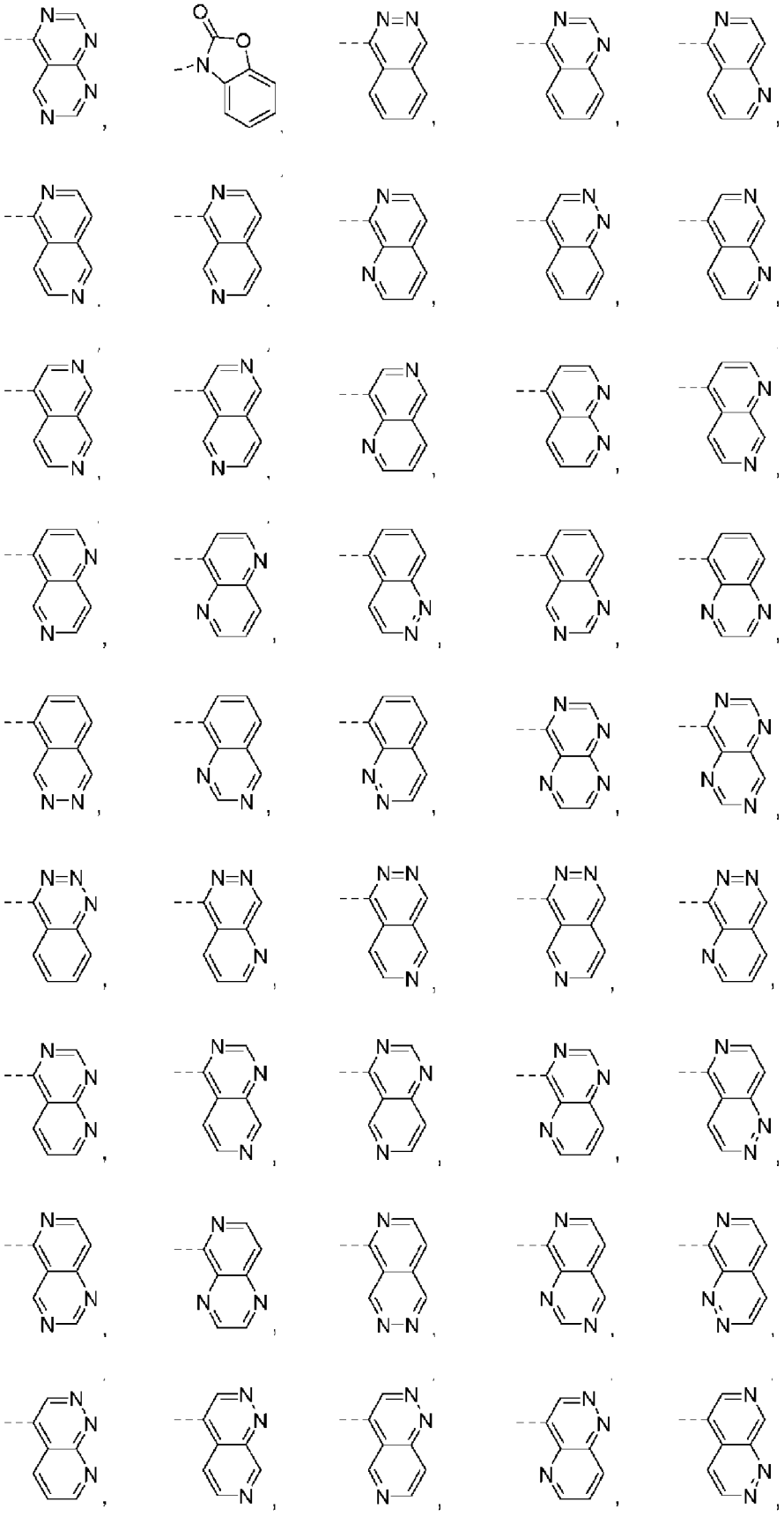


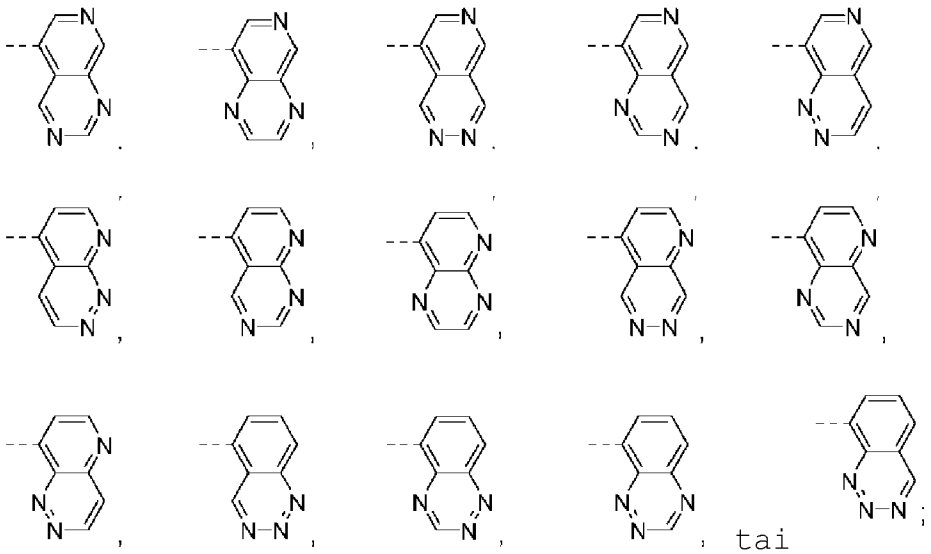









































tai

R^3 on bisyklo[1.1.1]pentyyli, bisyklo[2.1.1]heksyyli, bisyklo[2.2.1]heptyyli, bisyklo[3.1.1]heptyyli, bisyklo[2.2.2]oktyyli, bisyklo[3.2.1]oktyyli, bisyklo[3.2.2]nonyyli, bisyklo[3.3.2]dekyyli, bisyklo[3.3.3]undekyyli, 4-homoisotwistyyli, adamantyyli, diamantyyli tai heksametyleenitetraminyyli, ja edellä mainitut tähteet sisältävät valinnaisesti yhden tai useamman C=C-kaksoissidoksen ja/tai ne on valinnaisesti substituoitu yhdellä useammalla R^a:sta, R^b:stä, R^c:stä, R^d:stä ja R^e:stä;

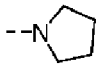
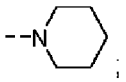
R^a, R^b, R^c, R^d ja R^e ovat toisistaan riippumattomasti -H, -F, -Cl, -Br, -CN, -OH, $-CH_3$, $-CH_2CH_3$, $-CH_2CH_2CH_3$, $-CH(CH_3)_2$, $-CHF_2$, $-CF_3$, $-CH_2CF_3$, $-COCH_3$, $-COCH_2CH_3$, $-CO_2H$, $-CO_2CH_3$, $-CO_2C_2H_5$, $-CONH_2$, $-CONHCH_3$, $-CON(CH_3)_2$, $-CONHC_2H_5$, $-CH_2CO_2H$, $-CH_2CO_2CH_3$, $-CH_2CO_2C_2H_5$, $-CH_2CONH_2$, $-CH_2CONHCH_3$, $-CH_2CON(CH_3)_2$, $-CH_2CONHC_2H_5$, $-NHCOCH_3$, $-NHCOC_2H_5$, $-NHCOCF_3$, $-NHCOCH_2CF_3$, $-NHSO_2CH_3$, $-NHSO_2C_2H_5$, $-NHSO_2CHF_2$, $-NHSO_2CF_3$ tai $-NHSO_2CH_2CF_3$;

R^4 on $-R^5$, $-OR^5$ tai $-NR^6R^7$;

R^5 on -H, $-CH_3$, $-CH_2CH_3$, $-CH_2CH_2CH_3$, $-CH(CH_3)_2$, $-CH_2CH_2CH_2CH_3$, $-CH_2CH(CH_3)_2$, $-C(CH_3)_3$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$, $-CH_2CH=CH_2$, $-CH_2CH=CH(CH_3)$, $-CH_2CH=C(CH_3)_2$, $-CH_2CH=CHCH_2CH_3$, -syklo-C_3H_5, -syklo-C_4H_7, -syklo-C_5H_9, -syklo-C_6H_{11}, $-CH_2$-syklo-C_3H_5, $-CH_2$-syklo-C_4H_7, $-CH_2$-syklo-

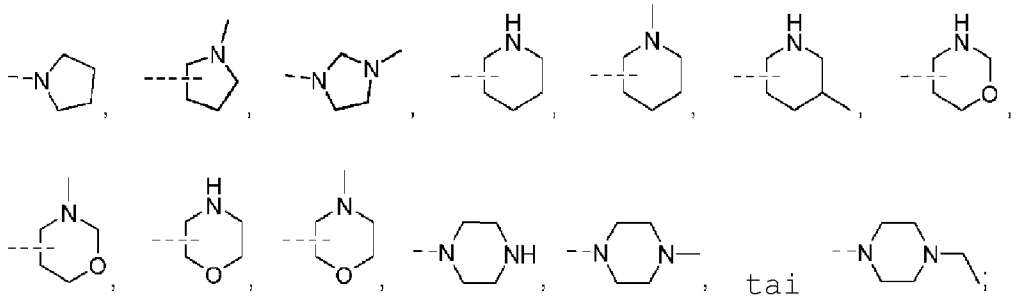
C_5H_9, -CH_2-syklo-C_6H_{11}, -CH_2-Ph, -CH_2OCH_3, -$CH_2OCH_2CH_3$, -$CH_2CH_2OCH_3$ tai -$CH_2CH_2OCH_2CH_3$;

R^6 ja R^7 ovat toisistaan riippumattomasti -H, -CH_3, -CH_2CH_3, -$CH_2CH_2CH_3$, -$CH(CH_3)_2$, -$CH_2CH_2CH_2CH_3$, -$CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$, -$CH_2CH(CH_3)_2$, -$C(CH_3)_3$, -$CH_2CH=CH_2$, -$CH_2CH=CH(CH_3)$, -$CH_2CH=C(CH_3)_2$, -$CH_2CH=CHCH_2CH_3$, -syklo-C_3H_5, -syklo-C_4H_7, -syklo-C_5H_9, -syklo-C_6H_{11}, -CH_2-syklo-C_3H_5, -CH_2-syklo-C_4H_7, -CH_2-syklo-C_5H_9, -CH_2-syklo-C_6H_{11}, -Ph, -CH_2-Ph, -CH_2OCH_3, -$CH_2OCH_2CH_3$, -$CH_2CH_2OCH_3$, -$CH_2CH_2OCH_2CH_3$, -$CH_2CH_2NHCH_3$ tai -$CH_2CH_2N(CH_3)_2$,

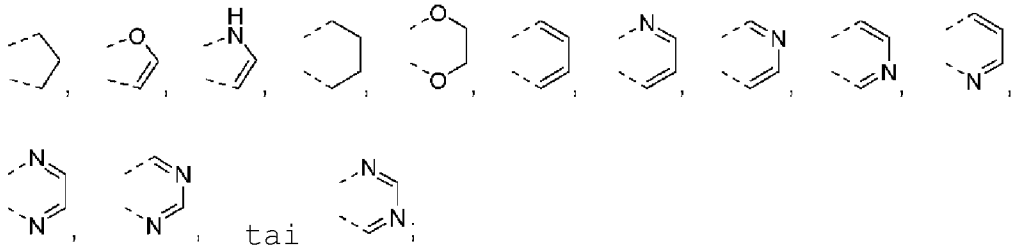
tai -NR^6R^7 on , , , tai ;

R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, ja R^{14} ovat toisistaan riippumattomasti -H, -F, -Cl, -Br, -I, -OH, -CN, -NO_2, -CH_3, -C_2H_5, -C_3H_7, -$CH(CH_3)_2$, -C_4H_9, -CH_2-$CH(CH_3)_2$, -$CH(CH_3)$-C_2H_5, -$C(CH_3)_3$, -syklo-C_3H_5, -CH_2-syklo-C_3H_5, -CH_2F, -CHF_2, -CF_3, -CH_2Cl, -CH_2Br, -CH_2I, -CH_2-CH_2F, -CH_2-CHF_2, -CH_2-CF_3, -CH_2-CH_2Cl, -CH_2-CH_2Br, -CH_2-CH_2I, -OCH_3, -OC_2H_5, -OC_3H_7, -$OCH(CH_3)_2$, -$OC(CH_3)_3$, -OC_4H_9, -$OCHF_2$, -OCF_3, -OCH_2CF_3, -OC_2F_5, -OCH_2OCH_3, -O-syklo-C_3H_5, -OCH_2-syklo-C_3H_5, -O-C_2H_4-syklo-C_3H_5, -CHO, -$COCH_3$, -$COCF_3$, -COC_2H_5, -COC_3H_7, -$COCH(CH_3)_2$, -$COC(CH_3)_3$, -COOH, -$COOCH_3$, -$COOC_2H_5$, -$COOC_3H_7$, -$COOCH(CH_3)_2$, -$COOC(CH_3)_3$, -OOC-CH_3, -OOC-CF_3, -OOC-C_2H_5, -OOC-C_3H_7, -OOC-$CH(CH_3)_2$, -OOC-$C(CH_3)_3$, -NH_2, -$NHCH_3$, -NHC_2H_5, -NHC_3H_7, -$NHCH(CH_3)_2$, -$NHC(CH_3)_3$, -$N(CH_3)_2$, -$N(C_2H_5)_2$, -$N(C_3H_7)_2$, -$N[CH(CH_3)_2]_2$, -$N[C(CH_3)_3]_2$, -$NHCOCH_3$, -$NHCOCF_3$, -$NHCOC_2H_5$, -$NHCOC_3H_7$, -$NHCOCH(CH_3)_2$, -$NHCOC(CH_3)_3$, -$CONH_2$, -$CONHCH_3$, -$CONHC_2H_5$, -$CONHC_3H_7$, -$CONHCH(CH_3)_2$, -CONH-syklo-C_3H_5, -$CONHC(CH_3)_3$, -$CON(CH_3)_2$, -$CON(C_2H_5)_2$, -$CON(C_3H_7)_2$, -$CON[CH(CH_3)_2]_2$, -$CON[C(CH_3)_3]_2$, -SO_2NH_2, -SO_2NHCH_3, -$SO_2NHC_2H_5$, -$SO_2NHC_3H_7$, -$SO_2NHCH(CH_3)_2$, -SO_2NH-syklo-C_3H_5, -$SO_2NHC(CH_3)_3$, -$SO_2N(CH_3)_2$, -$SO_2N(C_2H_5)_2$, -$SO_2N(C_3H_7)_2$, -$SO_2N[CH(CH_3)_2]_2$, -$SO_2N[C(CH_3)_3]_2$, -$NHSO_2CH_3$, -$NHSO_2CF_3$, -$NHSO_2C_2H_5$, -$NHSO_2C_3H_7$, -$NHSO_2CH(CH_3)_2$, -$NHSO_2C(CH_3)_3$, -$CH=CH_2$, -CH_2-

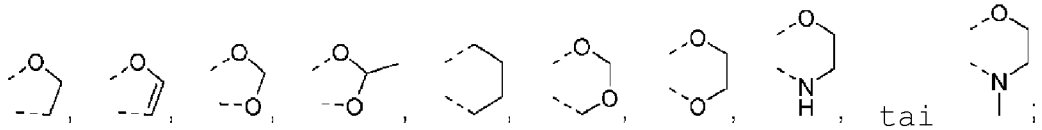
$CH=CH_2$, $-C(CH_3)=CH_2$, $-CH=CH-CH_3$, $-C\equiv CH$, $-C\equiv C-CH_3$, $-CH_2-C\equiv CH$, -Ph, -O-Ph, $-O-CH_2-Ph$,



tai R^8 ja R^9 tai R^9 ja R^{10} voivat yhdessä muodostaa jonkin seuraavista viisijäsenisistä tai kuusijäsenisistä renkaista:



tai R^{12} ja R^{13} tai R^{13} ja R^{14} voivat yhdessä muodostaa jonkin seuraavista viisijäsenisistä tai kuusijäsenisistä renkaista:



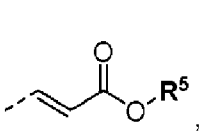
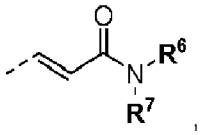
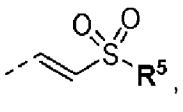
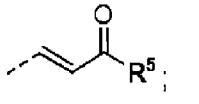
R^N on -H, $-CH_3$, $-C_2H_5$, $-C_3H_7$, $-CH(CH_3)_2$, $-C_4H_9$, $-CH_2-CH(CH_3)_2$, $-CH(CH_3)-C_2H_5$, $-C(CH_3)_3$, -syklo-C_3H_5, -syklo-C_4H_7, -syklo-C_5H_9, $-CH_2$-syklo-C_3H_5, $-CH_2F$, $-CHF_2$, $-CF_3$, $-CH_2Cl$, $-CH_2Br$, $-CH_2I$, $-CH_2-CH_2F$, $-CH_2-CHF_2$, $-CH_2-CF_3$, $-CH_2-CH_2Cl$, $-CH_2-CH_2Br$, $-CH_2-CH_2I$, $-CH_2-CH=CH_2$, $-CH_2-C\equiv CH$, -CHO, $-COCH_3$, $-COC_2H_5$, $-COC_3H_7$, $-COCH(CH_3)_2$, $-COC(CH_3)_3$, $-COOCH_3$, $-COOC_2H_5$, $-COOC_3H_7$, $-COOCH(CH_3)_2$, $-COOC(CH_3)_3$, $-COOCH_2Ph$, $-SO_2CH_3$, $-SO_2CF_3$, $-SO_2C_2H_5$, $-SO_2C_3H_7$, $-SO_2CH(CH_3)_2$ tai $-SO_2C(CH_3)_3$;

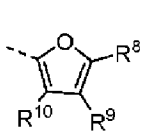
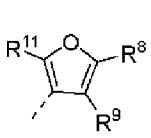
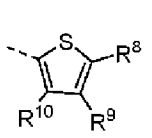
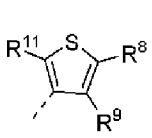
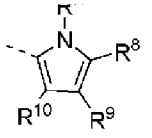
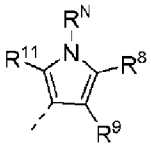
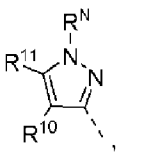
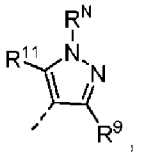
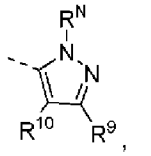
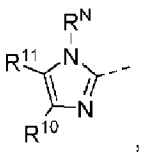
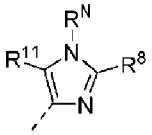
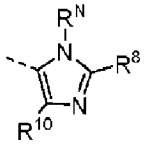
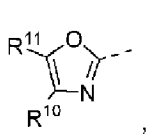
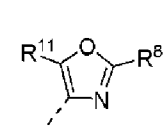
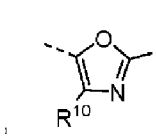
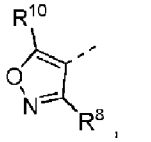
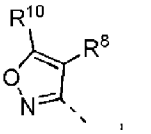
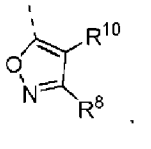
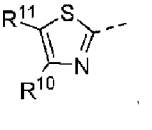
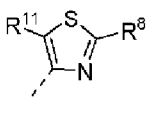
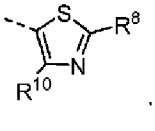
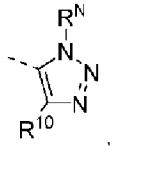
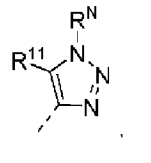
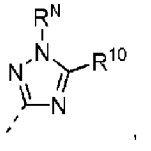
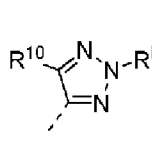
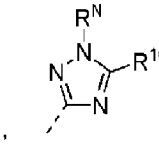
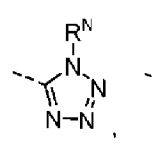
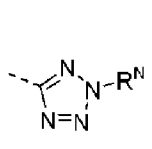
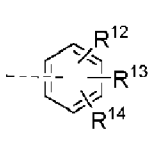
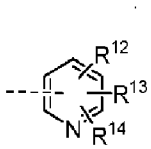
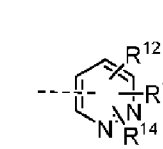
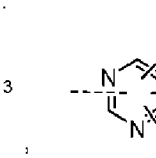
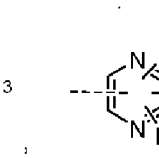
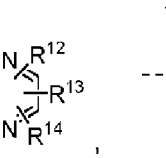
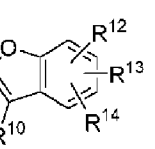
R^{N1} on -H, $-CH_3$ tai $-CH_2CH_3$;

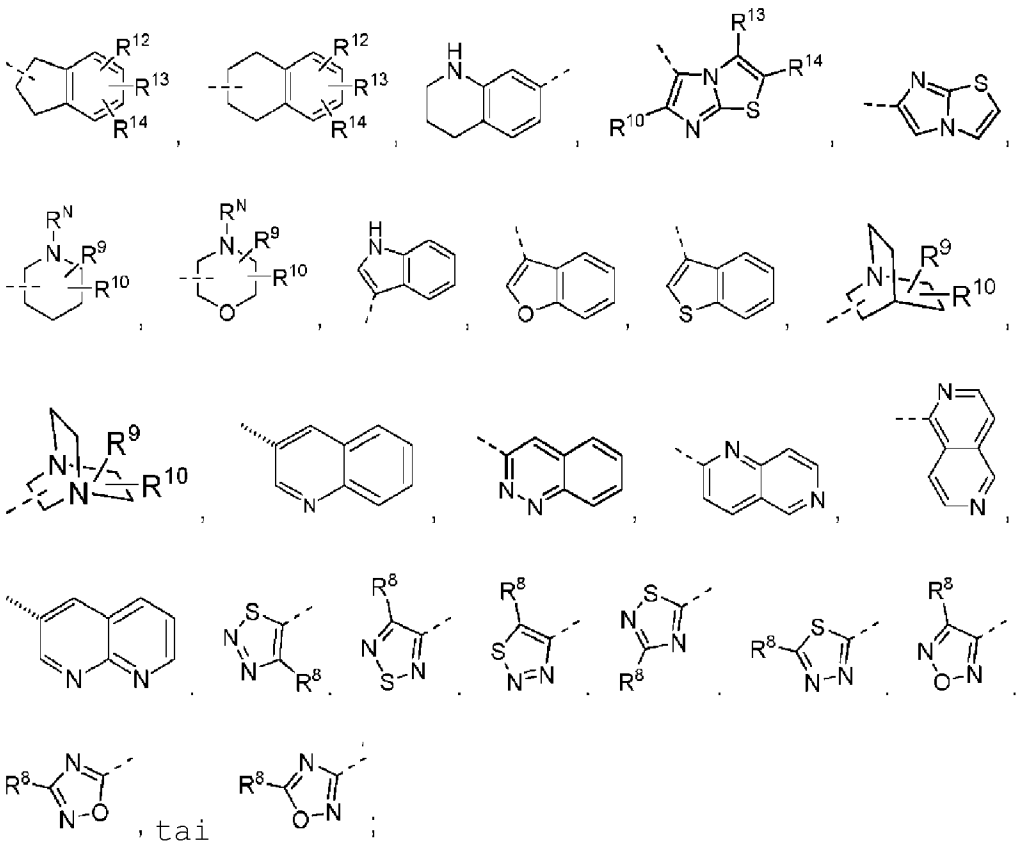
tai sen diastereomeeri, enantiomeeri, diastereomeerien seos, enantiomeeriseos, rasemaatti, solvaatti, hydraatti tai farmaseuttisesti hyväksyttävä

suola.

3. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, jossa

R^1 on , , ,  tai ;

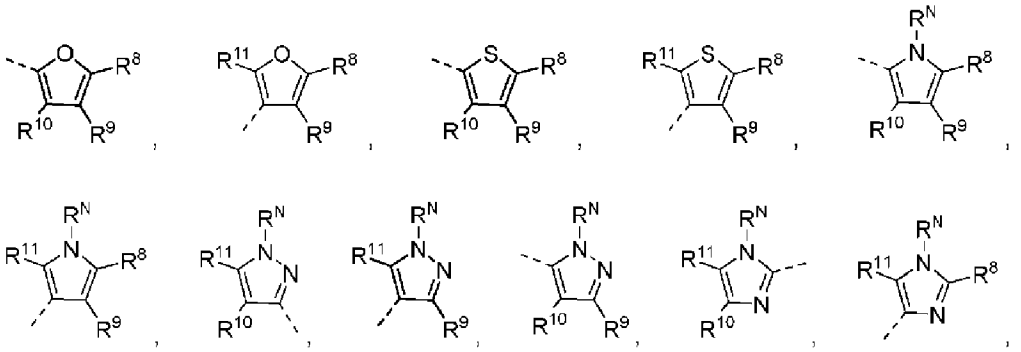
R^2 on , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , ,

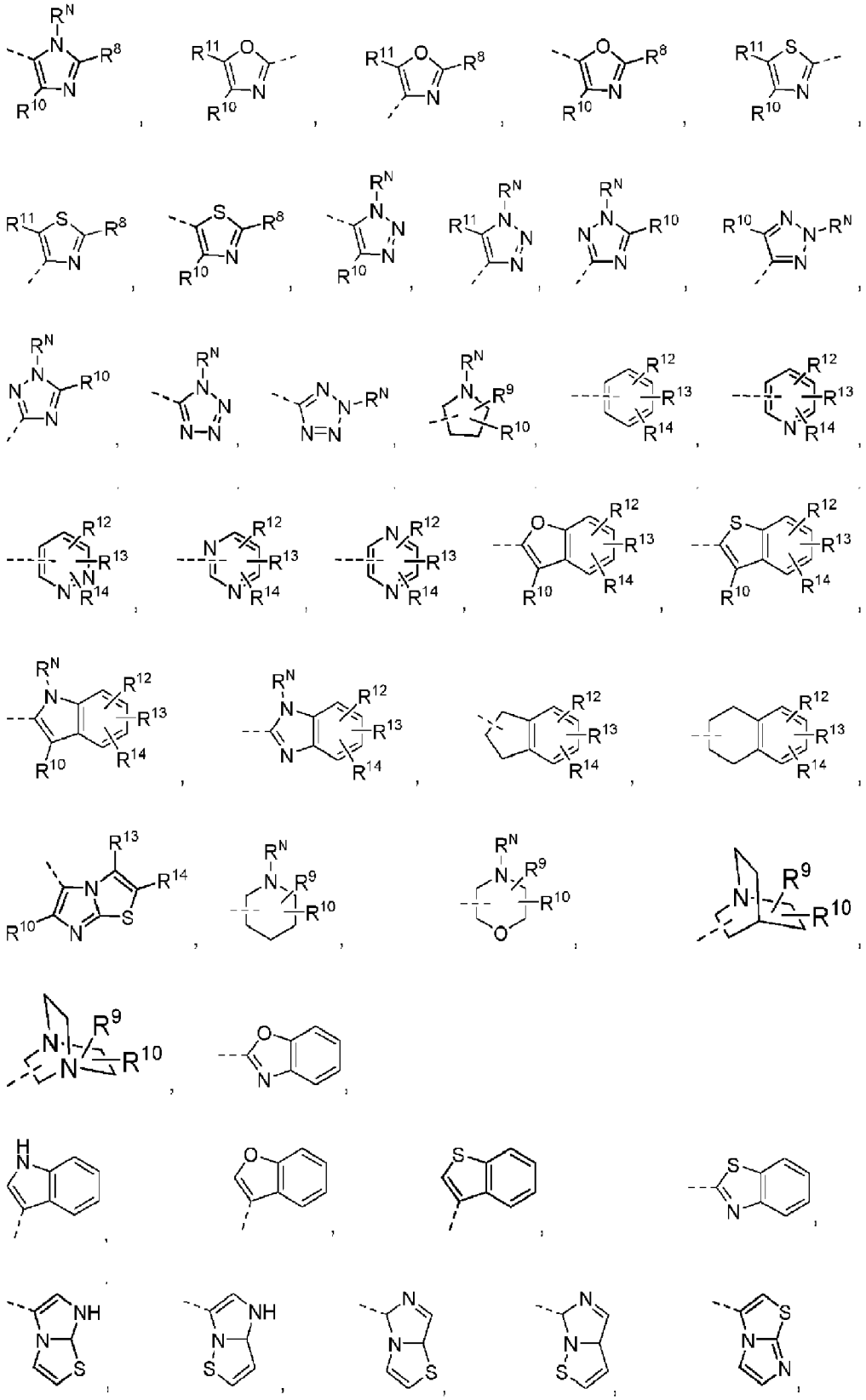


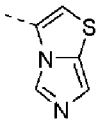
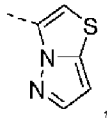
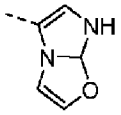
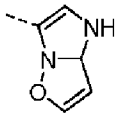
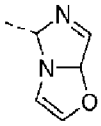
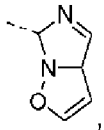
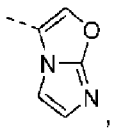
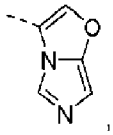
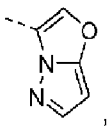
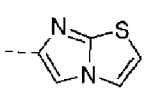
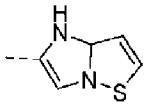
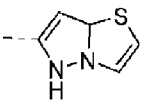
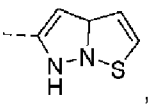
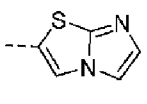
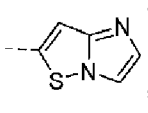
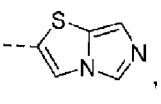
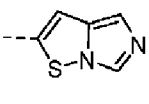
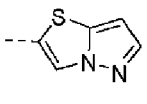
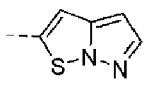
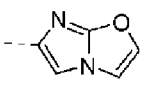
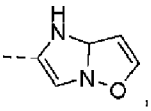
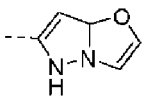
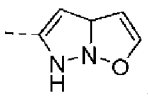
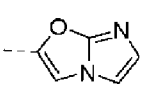
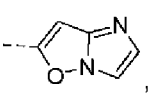
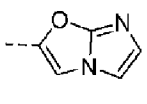
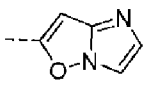
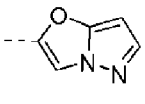
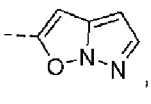
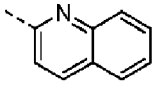
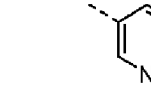
, tai ;

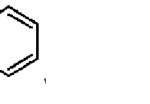
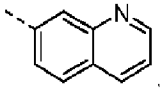
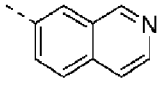
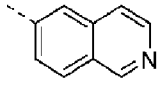
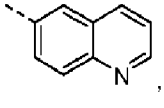
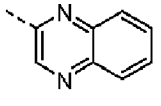
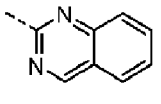
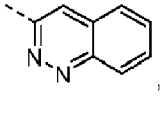
jossa substituoimattomat bisykliset tähteet voi olla substituoitu 1-5:llä substituenteista R^9-R^{14} ja R^N; ja edullisesti 1-3:lla substituenteista R^{11}-R^{13}, ja R^5-R^{14}:llä ja R^N:llä on patenttivaatimuksessa 1 määritellyt merkitykset.

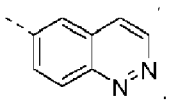
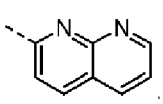
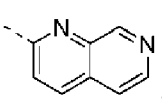
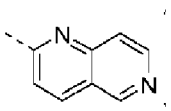
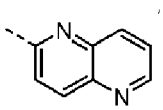
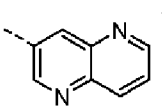
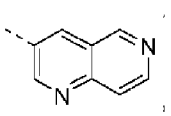
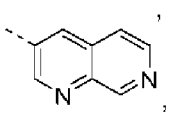
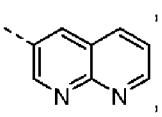
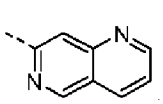
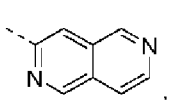
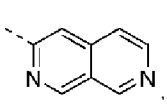
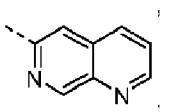
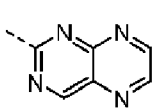
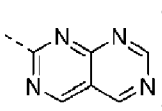
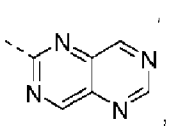
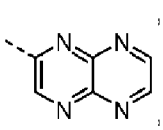
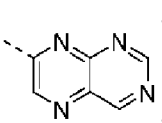
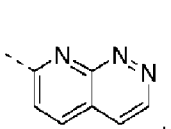
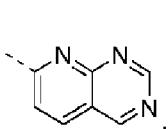
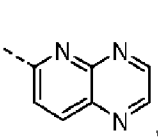
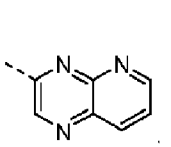
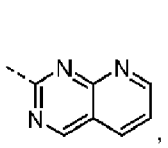
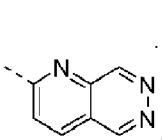
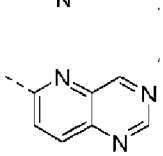
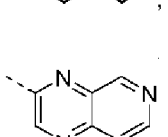
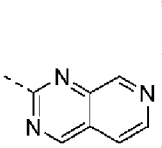
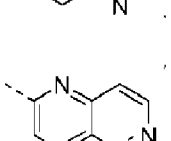
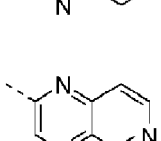
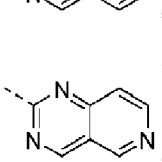
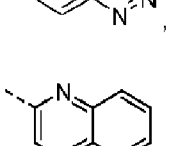
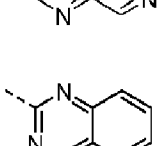
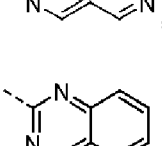
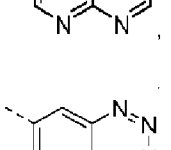
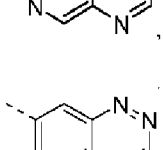
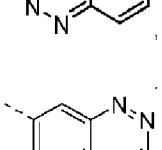
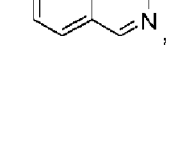
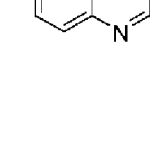
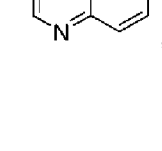
4. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, jossa R^2 on

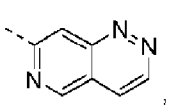
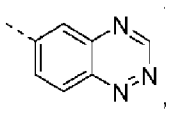
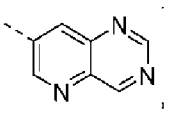
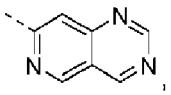
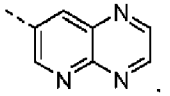
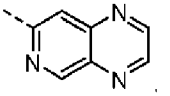
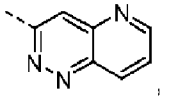
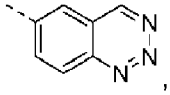
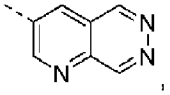
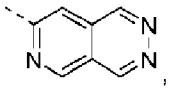
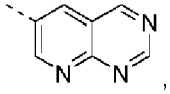
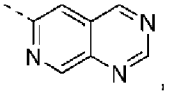
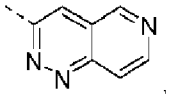
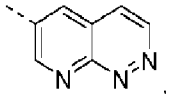
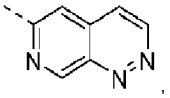
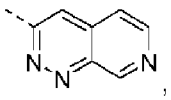
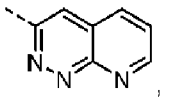
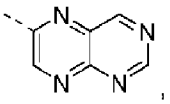
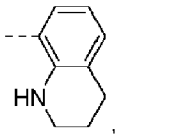
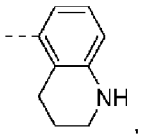
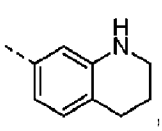
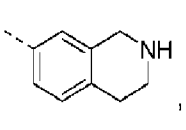
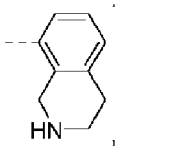
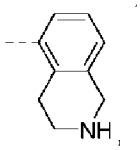
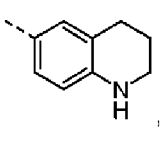
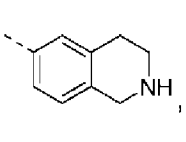
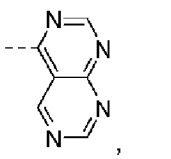
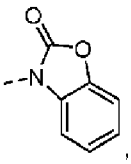
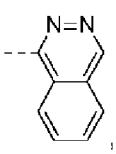
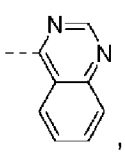
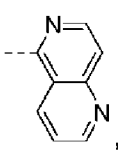
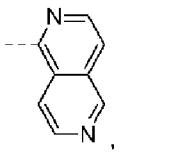
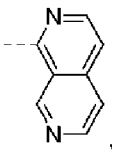
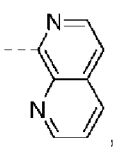
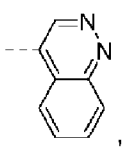
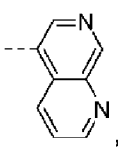


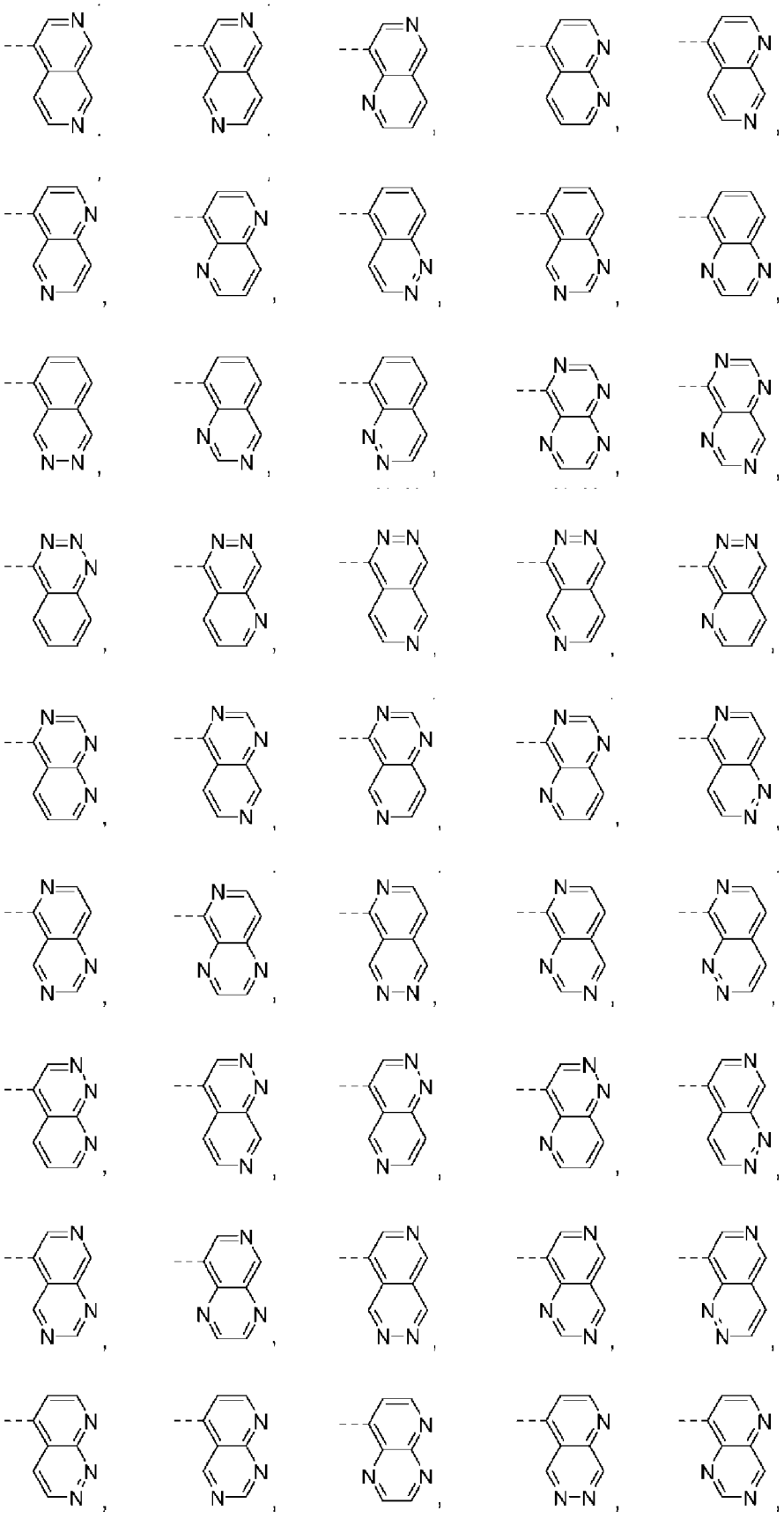


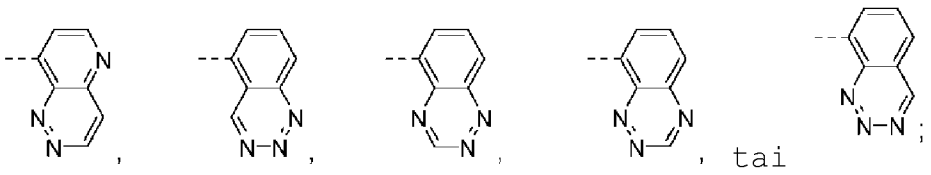
































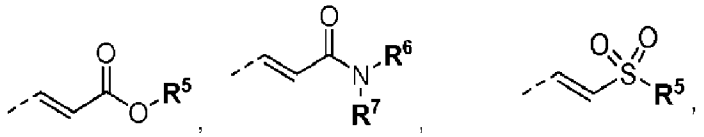
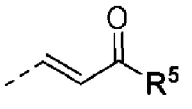









































jossa substituoimattomat bisykliset tähteet voi olla substituoitu 1-5:llä substituenteista R^9-R^{14}, R^N; ja edullisesti 1-3:lla substituenteista R^{11}-R^{13}, ja substituenteilla R^9 -R^{14} ja R^N on patenttivaatimuksessa 1 määritellyt merkitykset.

5. Jonkin patenttivaatimuksista 1, 3 ja 4 mukainen yhdiste, jossa

R^1 on  tai ;

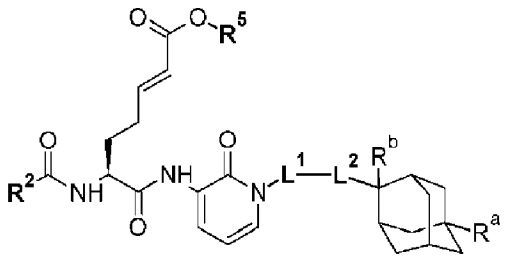
L^1 on $-CH_2-$ tai $-CH_2CO-$;

L^2 on sidos, $-NR^{N1}-$, $-NR^{N1}CH_2-$ tai $-NR^{N1}CH(CH_3)-$;

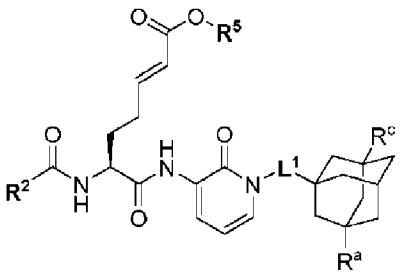
R^3 on bisyklo[1.1.1]pentyyli, bisyklo[2.1.1]heksyyli, bisyklo[2.2.1]heptyyli, bisyklo[3.1.1]heptyyli, bisyklo[2.2.2]oktyyli, bisyklo[3.2.1]oktyyli, 4-homoisotwistyyli, adamantyyli, tai diamantyyli, ja edellä mainitut tähteet sisältävät valinnaisesti yhden tai useamman C=C-kaksoissidoksen ja/tai ne on substituoitu yhdellä tai useammalla R^a:sta, R^b:stä, R^c:stä, R^d:stä ja R^e:stä;

ja R^5, R^6, R^7, R^a, R^b, R^c, R^d, R^e ja R^{N1} tarkoittavat samaa kuin patenttivaatimuksessa 1 on määritelty.

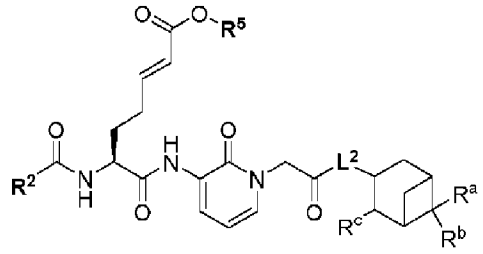
6. Jonkin patenttivaatimuksista 1 ja 3-5 mukainen yhdiste, jossa yhdisteellä on jokin kaavoista (VI-a)-(VI-I), (VII-a)-(VII-I), (VIII-a)-(VIII-I), (IX-a)-(IX-d), (X-a)-(X-d) ja (XI-a)-(XI-d):



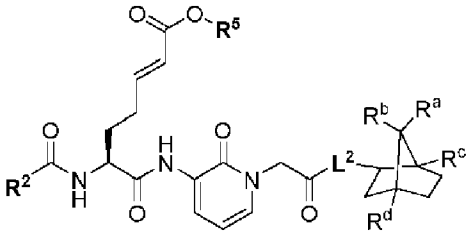
(**VI-a**)



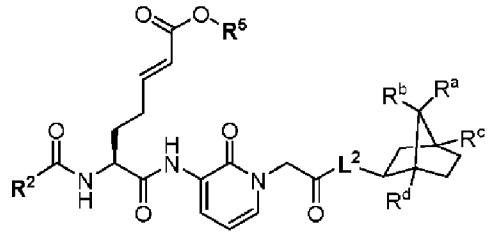
(**VI-b**)



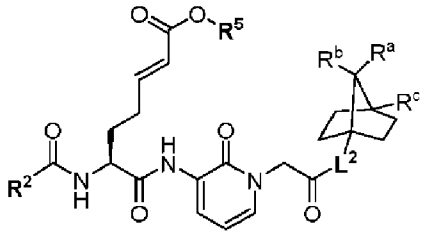
(**VI-c**)



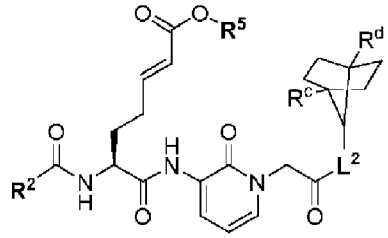
(**VI-d**)



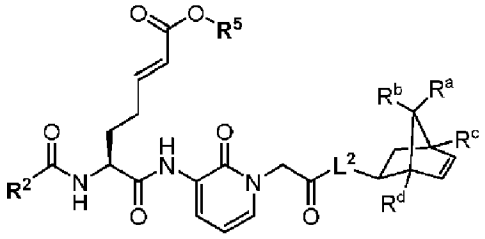
(**VI-e**)



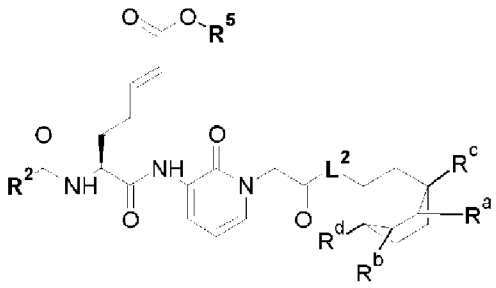
(**VI-f**)



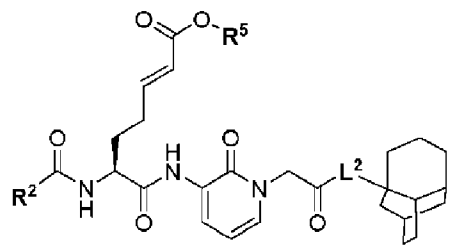
(**VI-g**)



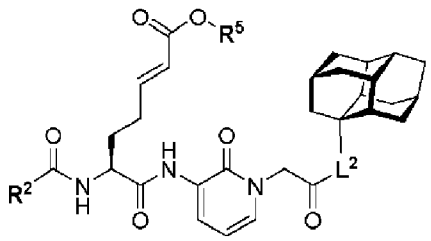
(**VI-h**)



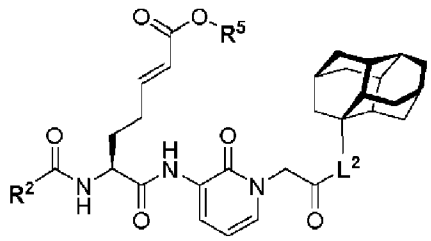
(**VI-i**)



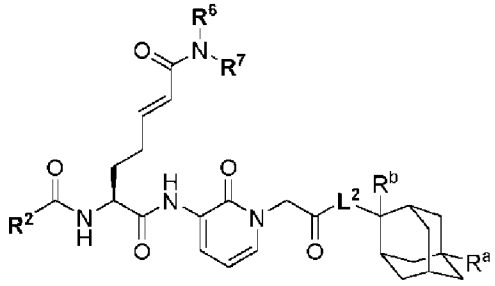
(**VI-j**)



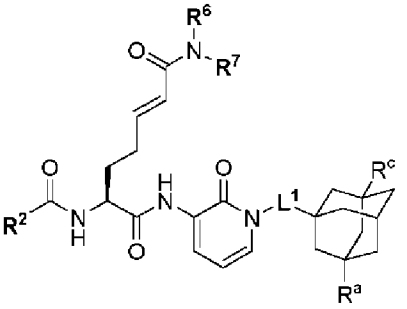
(VI-k)



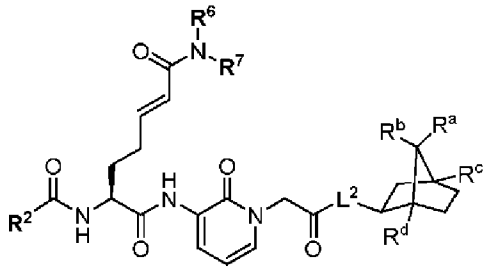
(VI-l)



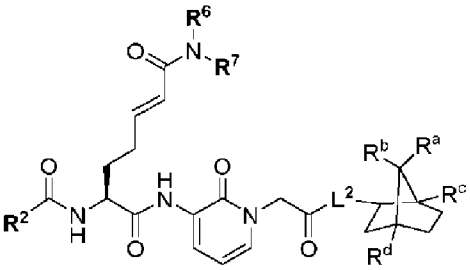
(VII-a)



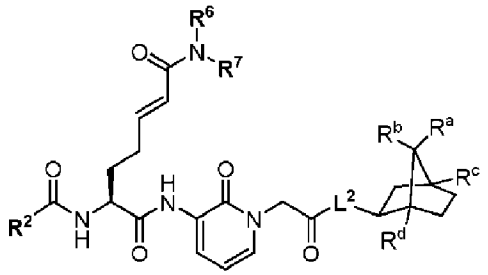
(VII-b)



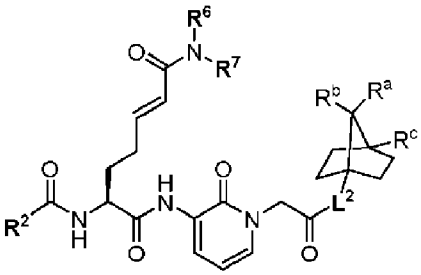
(VII-c)



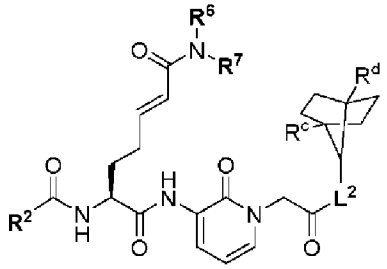
(VII-d)



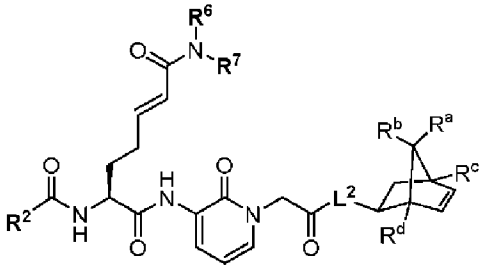
(VII-e)



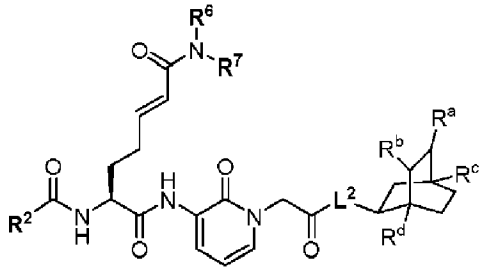
(VII-f)



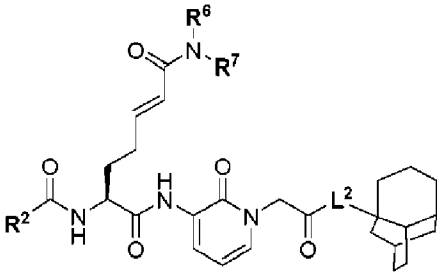
(VII-g)



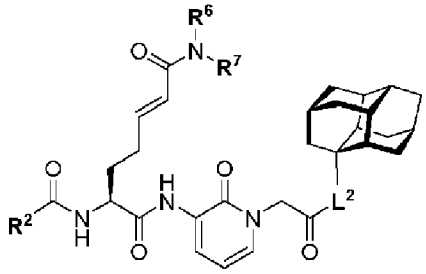
(VII-h)



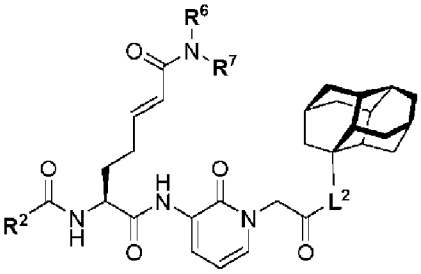
(VII-i)



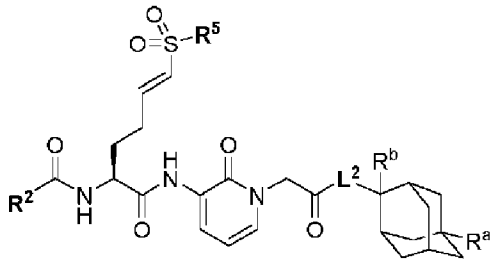
(VII-j)



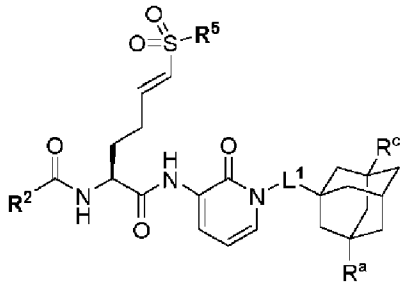
(VII-k)



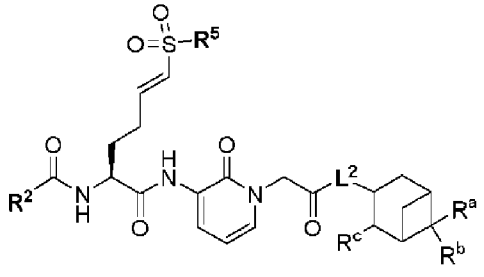
(VII-l)



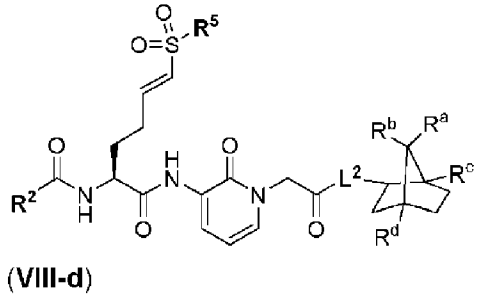
(VIII-a)



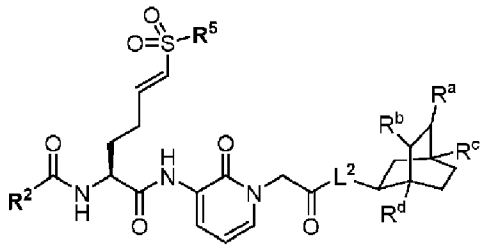
(VIII-b)



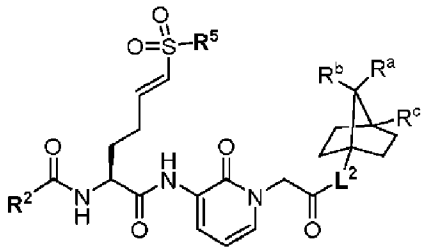
(VIII-c)



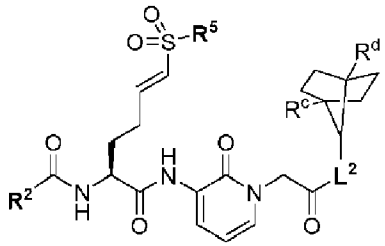
(VIII-d)



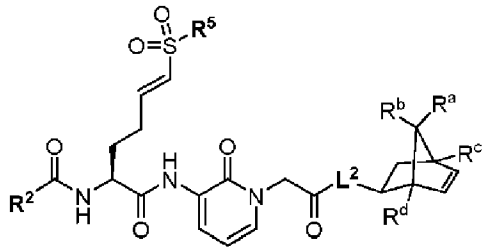
(VIII-e)



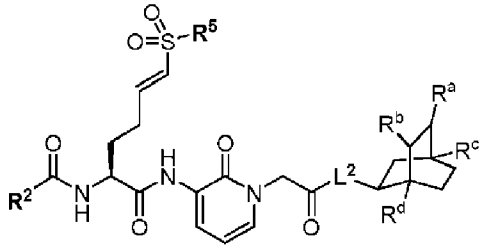
(VIII-f)



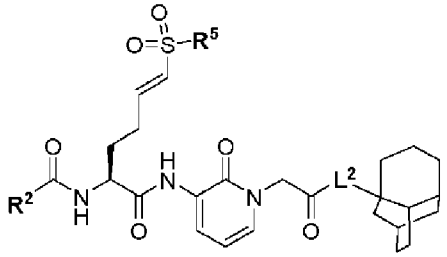
(VIII-g)



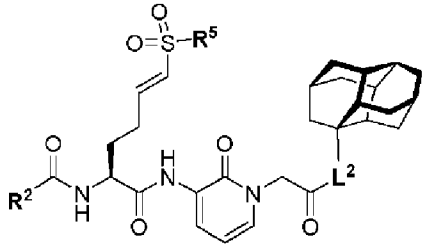
(VIII-h)



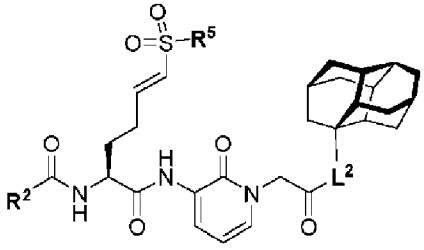
(VIII-i)



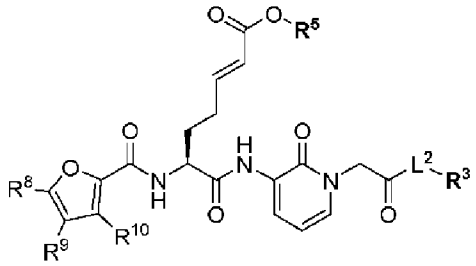
(VIII-j)



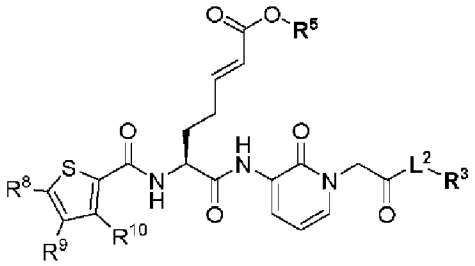
(VIII-k)



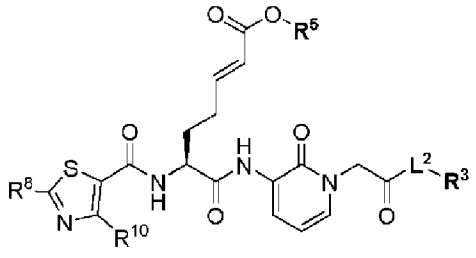
(VIII-l)



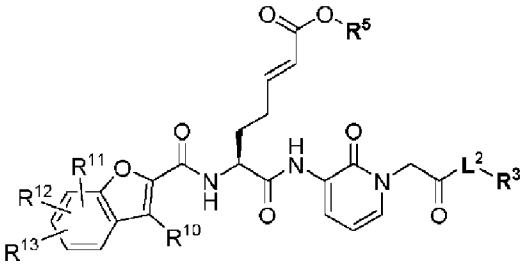
(**IX-a**)



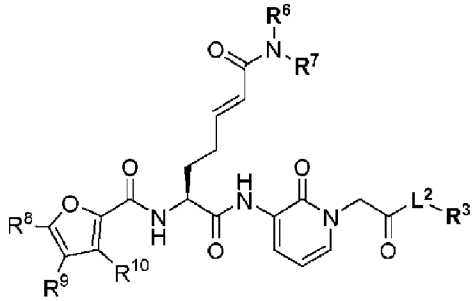
(**IX-b**)



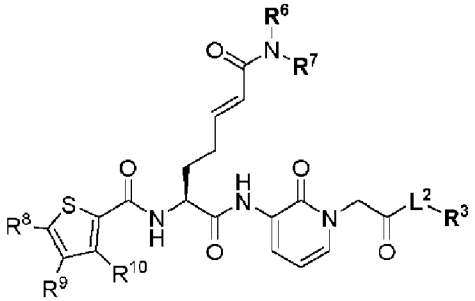
(**IX-c**)



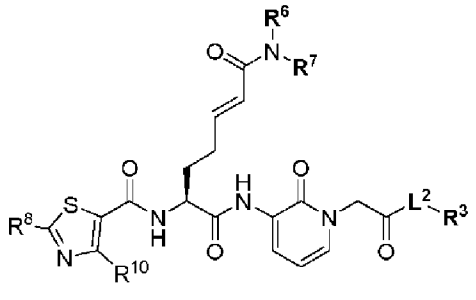
(**IX-d**)



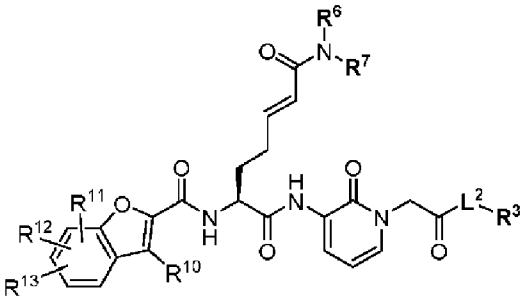
(**X-a**)



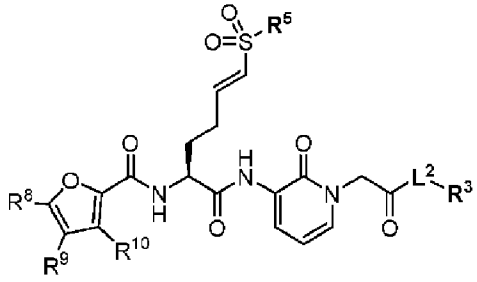
(**X-b**)



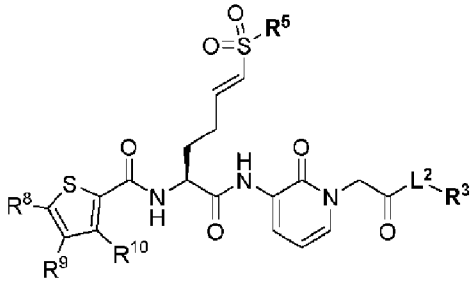
(**X-c**)



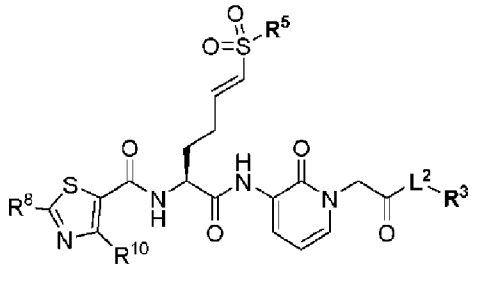
(**X-d**)



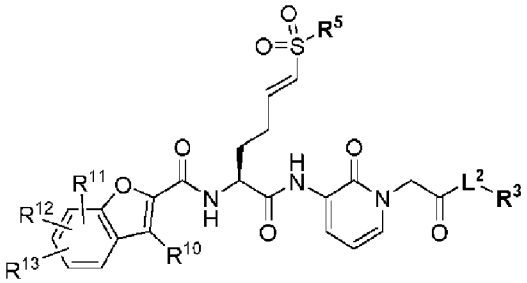
(**XI-a**)



(**XI-b**)



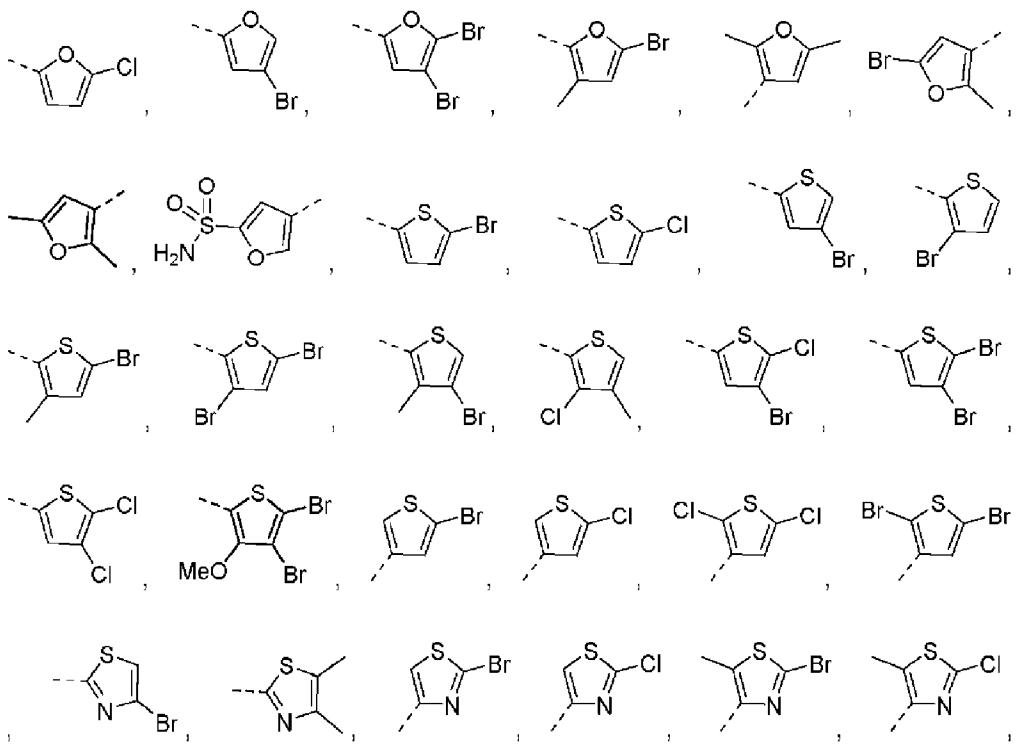
(**XI-c**)

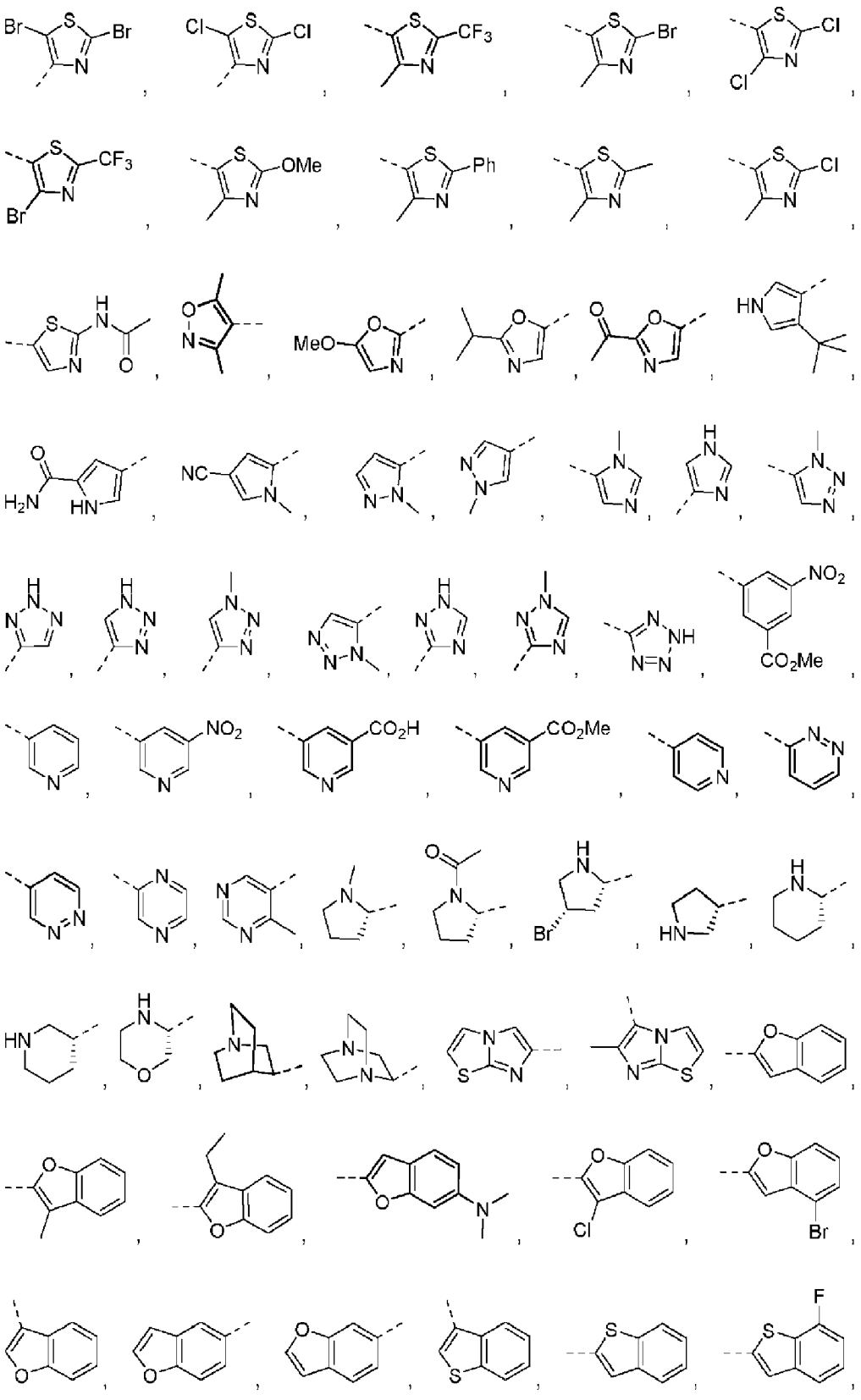


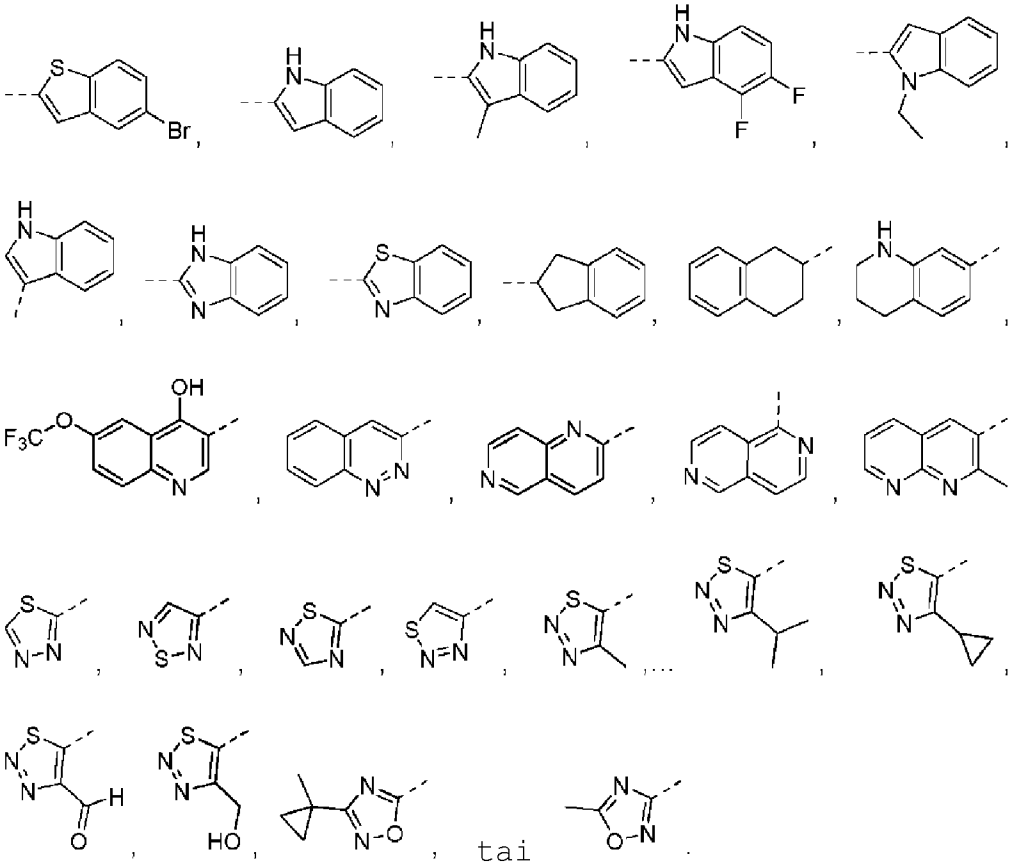
(**XI-d**)

ja R^2 R^3, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^a, R^b, R^c, R^d ja L^2 tarkoittavat samaa kuin patenttivaatimuksessa 1 on määritelty.

7. Jonkin patenttivaatimuksista 1 ja 3-6 mukainen yhdiste, jossa R^2 on

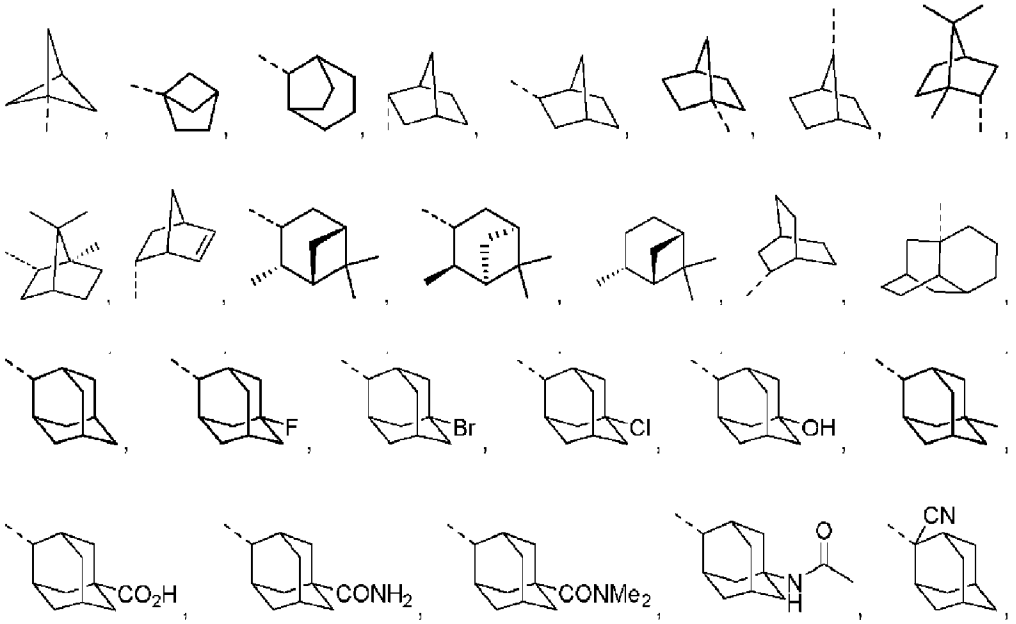


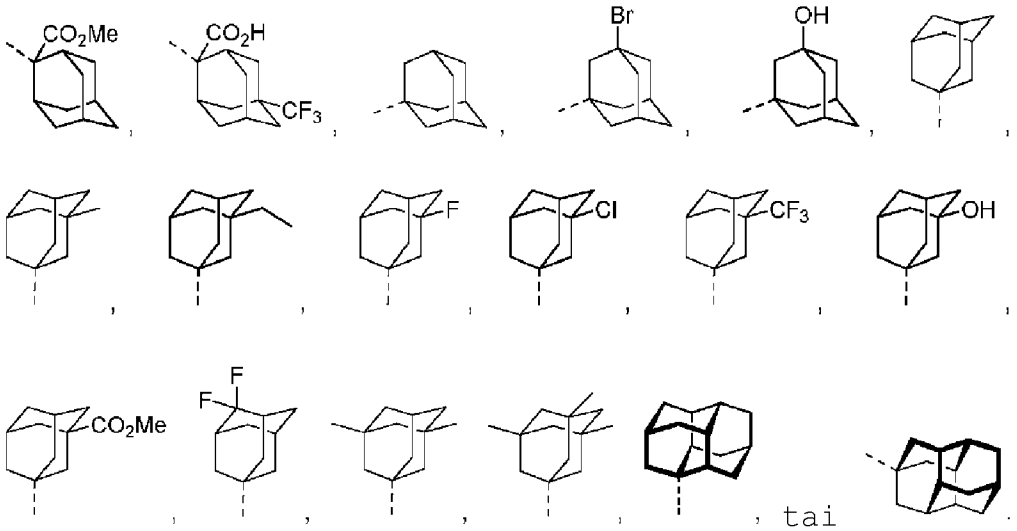




tai

8. Jonkin patenttivaatimuksista 1 ja 3-7 mukainen yhdiste, jossa R^3 on





tai .

9. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, joka on valittu ryhmästä, joka koostuu seuraavista:

Yhdiste	Nimi
III-1:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(1-metyyli-1H-imidatsoli-5-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-2:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-3:	(S,E)-metyyli-6-(3-klooribentsofuraani-2-karboksamido)-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-oksohept-2-enoaatti
III-4:	(S,E)-metyyli-6-(4-bromibentsofuraani-2-karboksamido)-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-oksohept-

Yhdiste	Nimi
	2-enoaatti
III-5:	(S,E)-metyyli-6-(bentso[b]tiofeeni-2-karboksamido)-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-oksohept-2-enoaatti
III-6:	(S,E)-metyyli-6-(5-brom-ibentso[b]tiofeeni-2-karboksamido)-7-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-oksohept-2-enoaatti
III-7:	(S,E)-metyyli-6-(7-flu-oribentso[b]tiofeeni-2-karboksamido)-7-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-oksohept-2-enoaatti
III-8:	(S,E)-metyyli-6-(1H-indoli-2-karboksam-ido)-7-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-ok-soetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-oksohept-2-enoaatti
III-9:	(S,E)-metyyli-6-(4,5-difluori-1H-indoli-2-karboksamido)-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-oksohept-2-enoaatti
III-10:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyyli-1H-indoli-2-karboksamido)-7-ok-sohept-2-enoaatti
III-11:	(S,E)-metyyli-6-(1H-bentso[d]imidatsoli-2-karboksamido)-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-oksohept-

Yhdiste	Nimi
	2-enoaatti
III-12:	(S,E)-metyyli-6-(2,3-dihydro-1H-indeeni-2-karboksamido)-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-oksohept-2-enoaatti
III-13:	(S,E)-metyyli-6-(2,5-diklooritiofeeni-3-karboksamido)-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-oksohept-2-enoaatti
III-14:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(4-metyyli-2-(trifluorimetyyli)tiatsoli-5-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-15:	(S,E)-metyyli-6-(3,5-dibromitiofeeni-2-karboksamido)-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-oksohept-2-enoaatti
III-16:	(S,E)-metyyli-6-(2,5-dibromitiofeeni-3-karboksamido)-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-oksohept-2-enoaatti
III-17:	(S,E)-metyyli-6-(5-bromitiofeeni-3-karboksamido)-7-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-oksohept-2-enoaatti
III-18:	(S,E)-metyyli-6-(4-bromitiofeeni-2-karboksamido)-7-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-oksohept-2-enoaatti

Yhdiste	Nimi
III-19:	(S,E)-metyyli-6-(4,5-dibromitiofeeni-2-karboksamido)-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-oksohept-2-enoaatti
III-20:	(S,E)-metyyli-6-(4,5-diklooritiofeeni-2-karboksamido)-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-oksohept-2-enoaatti
III-21:	(S,E)-metyyli-6-((S)-1-asetyylipyrrolidiini-2-karboksamido)-7-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-oksohept-2-enoaatti
III-22:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(1-metyyli-1H-1,2,3-triatsoli-5-karboksam-ido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-23:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-okso-6-(2H-tetratsoli-5-karboksamido)hept-2-enoaatti
III-24:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-okso-6-(pyratsiini-2-karboksamido)hept-2-enoaatti
III-25:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-((S)-1-metyylipyrrolidiini-2-karboksamido)-7-

Yhdiste	Nimi
	oksohept-2-enoaatti
III-26:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-okso-6-((S)-pyrrolidiini-3-karboksamido)hept-2-enoaatti
III-27:	(S,E)-metyyli-6-((2S,4S)-4-bromi-pyrrolidiini-2-karboksamido)-7-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-okso-hept-2-enoaatti
III-28:	(S,E)-metyyli-6-(1H-imidatsoli-4-karboksamido)-7-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-oksohept-2-enoaatti
III-29:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-okso-6-((S)-piperidiini-2-karboksamido)hept-2-enoaatti
III-30:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-okso-6-((R)-piperidiini-3-karboksamido)hept-2-enoaatti
III-31:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-((R)-morfoliini-3-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-32:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-okso-6-(kinuklidiini-3-karboksamido)hept-2-

Yhdiste	Nimi
	enoaatti
III-33:	(S,E)-metyyli-3-(1-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-metoksi-1,7-dioksohept-5-en-2-yylikarbamoyyli)-5-nitrobentsoaatti
III-34:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(5-ni-tronikotiiniamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-35:	(S,E)-5-(1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-metoksi-1,7-dioksohept-5-en-2-yylikarbamoyyli)nikotiinihappo
III-36:	(S,E)-metyyli-5-(1-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-metoksi-1,7-dioksohept-5-en-2-yylikar-bamoyyli)nikotinaatti
III-37:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(2-adam-antyyli(metyyli)amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-38:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(5-hydroksiadam-antaani-2-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-39:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(5-fluoriadam-antaani-2-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti

Yhdiste	Nimi
III-40:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(5-klooriadam-antaani-2-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-41:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(5-bromiadam-antaani-2-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-42:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(5-metyyliadam-antaani-2-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-43:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(2-karbonitriili-adamantaani-2-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-44:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(2-metyyliadam-antaani-2-karboksylaatti-2-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-45:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(1-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-46:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(3,5-dimetyyli-adamantaani-1-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-

Yhdiste	Nimi
	7-oksohept-2-enoaatti
III-47:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(1-adam-antyyli(metyyli)amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-48:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(3-etyyliadam-antaani-1-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-49:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(3-trifluori-metyyliadamantaani-1-amino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-50:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(3-hydroksiadam-antaani-1-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-51:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(3-fluoriadam-antaani-1-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-52:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(3-klooriadam-antaani-1-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-53:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(3-bromiadam-antaani-1-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-

Yhdiste	Nimi
	metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-54:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(3-metyyliadamantaani-3-karboksylaatti-1-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-55:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(4,4-difluoriadamantaani-1-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-56:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(1-adamantyyli-metyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-57:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(1-(1-adamantyyli)etaaniamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-58:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-((1R,2S,4S)-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(1-metyyli-1H-imidatsoli-5-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-59:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-((1S,2R,4R)-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-60:	(S,E)-metyyli-6-(1-metyyli-1H-imidatsoli-5-karboksamido)-7-okso-7-(2-okso-1-

Yhdiste	Nimi
	(2-okso-2-((1S,2S,4R)-1,7,7-tri-metyylibisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)etyyli)-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)hept-2-enoaatti
III-61:	(S,E)-metyyli-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-okso-7-(2-okso-1-(2-okso-2-((1S,2S,4R)-1,7,7-tri-metyylibisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)etyyli)-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)hept-2-enoaatti
III-62:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-((1R,2R,4S)-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(1-metyyli-1H-imidatsoli-5-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-63:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-((1R,2R,4S)-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-64:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(bisyklo[2.2.1]heptan-1-yyliamino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-65:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(bisyklo[2.2.1]heptan-7-yyliamino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-66:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(bisyklo[2.2.1]hept-5-en-2-yyliamino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-

Yhdiste	Nimi
	karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-67:	(6S,E)-metyyli-7-(1-(2-(bisyklo[2.2.2]oktan-2-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-68:	(S,E)-metyyli-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-okso-7-(2-okso-1-(2-okso-2-((1R,2R,4R)-1,7,7-trimetyylibisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)etyyli)-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)hept-2-enoaatti
III-69:	(S,E)-metyyli-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-okso-7-(2-okso-1-(2-okso-2-((1R,2R,3R,5S)-2,6,6-trimetyylibisyklo[3.1.1]heptan-3-yyliamino)etyyli)-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)hept-2-enoaatti
III-70:	(S,E)-metyyli-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-okso-7-(2-okso-1-(2-okso-2-((1S,2S,3S,5R)-2,6,6-trimetyylibisyklo[3.1.1]heptan-3-yyliamino)etyyli)-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)hept-2-enoaatti
III-71:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(((1S,2R,5S)-6,6-dimetyylibisyklo[3.1.1]heptan-2-yyli)metyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-72:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(4-homoisotwistaani-3-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksam-

Yhdiste	Nimi
	ido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-73:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(diamantaani-1-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-74:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(diamantaani-4-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-75:	(S,E)-N7-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N1,N1-dimetyyli-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)hept-2-eenidiamidi
III-76:	(S,E)-N7-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N1,N1-dimetyyli-6-(1-metyyli-1H-imidatsoli-5-karboksamido)hept-2-eenidiamidi
III-77:	(S,E)-N7-(1-(2-(3,5-dimetyyliadamantaani-1-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N1,N1-dimetyyli-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)hept-2-eenidiamidi
III-78:	(S,E)-metyyli-7-(1-(1-adamantyylimetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(1-metyyli-1H-imidatsoli-5-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-79:	(S,E)-metyyli-7-(1-(1-adamantyylimetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti

Yhdiste	Nimi
III-80:	(6S,E)-metyyli-7-(1-((3-hydroksi-1-adam-antyyli)metyyli)-2-okso-1,2-di-hydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-81:	(6S,E)-metyyli-7-(1-((3-bromi-1-adam-antyyli)metyyli)-2-okso-1,2-di-hydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-82:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-adamantyyli-metyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-83:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(nikoti-iniamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-84:	(S,E)-metyyli-6-(isonikotiiniamido)-7-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-oksohept-2-enoaatti
III-85:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-okso-6-(pyridatsiini-4-karboksamido)hept-2-enoaatti
III-86:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-okso-6-(pyridatsiini-3-karboksamido)hept-2-enoaatti
III-87:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(1-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-

Yhdiste	Nimi
	dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(1-metyyli-1H-imidatsoli-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-88:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(3,5-dimetyyli-adamantaani)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(1-metyyli-1H-imidatsoli-5-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-89:	(S,E)-etyyli-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-90:	(S,E)-N-(1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(metyylisulfonyyli)-1-okso-heks-5-en-2-yyli)-3-metyylibentsofur-aani-2-karboksamidi
III-91:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(3,5,7-trimetyyli-1-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(1-metyyli-1H-imidatsoli-5-karboksam-ido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-92:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(3,5,7-trimetyyli-1-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-93:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(3,5,7-trimetyyli-1-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(1-metyyli-1H-1,2,3-triatsoli-5-karboks-amido)-7-oksohept-2-enoaatti

Yhdiste	Nimi
III-94:	(S,E)-metyyli-6-(2,5-diklooritiofeeni-3-karboksamido)-7-(1-(2-(3,5,7-trimetyyli-1-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-oksohept-2-enoaatti
III-95:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(3,5,7-trimetyyli-1-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(4-metyyli-2-(trifluorimetyyli)tiatsoli-5-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-96:	(6S,E)-metyyli-7-(1-(2-((1R,2R,4S)-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(1-metyyli-1H-1,2,3-triatsoli-5-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-97:	(6S,E)-metyyli-7-(1-(2-((1R,2R,4S)-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(2,5-diklooritiofeeni-3-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-98:	(6S,E)-metyyli-7-(1-(2-((1R,2R,4S)-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(4-metyyli-2-(trifluorimetyyli)tiatsoli-5-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-99:	(S,E)-etyyli-7-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(1-metyyli-1H-imidatsoli-5-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-100:	(S,E)-N-(1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-

Yhdiste	Nimi
	yyliamino)-6-(metyylisulfonyyli)-1-okso-heks-5-en-2-yyli)-1-metyyli-1H-imidat-soli-5-karboksamidi
III-101:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-okso-6-(2H-1,2,3-triatsoli-4-karboksamido)hept-2-enoaatti
III-102:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-okso-6-(1H-1,2,3-triatsoli-4-karboksamido)hept-2-enoaatti
III-103:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(1-metyyli-1H-1,2,3-triatsoli-4-karboksam-ido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-104:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-okso-6-(1H-1,2,4-triatsoli-3-karboksamido)hept-2-enoaatti
III-105:	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(2-adam-antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(1-metyyli-1H-1,2,4-triatsoli-3-karboksam-ido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-106:	(S,E)-metyyli-6-(bentsofuraani-3-kar-boksamido)-7-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-oksohept-2-enoaatti
III-107:	(S,E)-metyyli-6-(bentso[b]tiofeeni-3-karboksamido)-7-(1-(2-(2-adam-

Yhdiste	Nimi
	antyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-oksohept-2-enoaatti
III-108	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(3,5,7-trimetyyli-1-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(4-metyyli-1,2,3-tiadiatsoli-5-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-109	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(3,5,7-trimetyyli-1-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(1-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-110	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-((1R,2R,4S)-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(4-metyyli-1,2,3-tiadiatsoli-5-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-111	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-((1R,2R,4S)-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(1-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-112	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(3,5-dimetyyli-adamantaani-1-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(4-metyyli-1,2,3-tiadiatsoli-5-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-113	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(3,5-dimetyyli-adamantaani-1-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(1-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti

Yhdiste	Nimi
III-114	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(3,5-dimetyyli-adamantaani-1-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(1-metyyli-1H-1,2,3-triatsoli-5-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-115	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-((1S,2R,4R)-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(4-metyyli-1,2,3-tiadiatsoli-5-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-116	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-((1S,2R,4R)-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(1-metyyli-1H-1,2,3-triatsoli-5-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-117	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-((1S,2R,4R)-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(1-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-118	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(4-metyyli-1,2,3-tiadiatsoli-5-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-119	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(1-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-120	(S,E)-metyyli-6-(4-metyyli-1,2,3-tiadiatsoli-5-karboksamido)-7-okso-7-(2-okso-

Yhdiste	Nimi
	1-(2-okso-2-((1R,2S,4R)-1,7,7-tri-metyylibisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)etyyli)-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)hept-2-enoaatti
III-121	(S,E)-metyyli-6-(1-metyyli-1H-1,2,3-tri-atsoli-5-karboksamido)-7-okso-7-(2-okso-1-(2-okso-2-((1R,2S,4R)-1,7,7-tri-metyylibisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)etyyli)-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)hept-2-enoaatti
III-122	(S,E)-metyyli-6-(1-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-7-okso-7-(2-okso-1-(2-okso-2-((1R,2S,4R)-1,7,7-tri-metyylibisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)etyyli)-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)hept-2-enoaatti
III-123	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(3,5-dimetyyli-adamantaani-1-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(4-metyyli-2-(trifluorimetyyli)tiatsoli-5-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-124	(S,E)-metyyli-6-(2,5-diklooritiofeeni-3-karboksamido)-7-(1-(2-(3,5-dimetyyli-adamantaani-1-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-oksohept-2-enoaatti
III-125	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-((1S,2R,4R)-bisyk-lo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(4-metyyli-2-(trifluori-metyyli)tiatsoli-5-karboksamido)-7-okso-hept-2-enoaatti
III-126	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-((1S,2R,4R)-bisyk-lo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-okso-

Yhdiste	Nimi
	etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(2,5-diklooritiofeeni-3-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-127	(S,E)-metyyli-6-(4-metyyli-2-(trifluorimetyyli)tiatsoli-5-karboksamido)-7-okso-7-(2-okso-1-(2-okso-2-((1R,2S,4R)-1,7,7-trimetyylibisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)etyyli)-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)hept-2-enoaatti
III-128	(S,E)-metyyli-6-(2,5-diklooritiofeeni-3-karboksamido)-7-okso-7-(2-okso-1-(2-okso-2-((1R,2S,4R)-1,7,7-trimetyylibisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)etyyli)-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)hept-2-enoaatti
III-129	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(1-metyyli-1H-pyratsoli-3-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-130	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(1-metyyli-1H-pyratsoli-4-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-131	(S,E)-metyyli-6-(4-tert-butyyli-1H-pyrroli-3-karboksamido)-7-(1-(2-(1-adamantyyliamino)etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-oksohept-2-enoaatti
III-132	(S,E)-metyyli-6-(4-syano-1-metyyli-1H-pyrroli-2-karboksamido)-7-(1-(3-(1-adamantyyliamino)propyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-oksohept-2-

Yhdiste	Nimi
	enoaatti
III-133	(S,E)-metyyli-7-(1-(3-(2-adam-antyyliamino)-3-oksopropyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(5-metoksioksatsoli-2-karboksamido)-7-okso-hept-2-enoaatti
III-134	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(bisyk-lo[2.1.1]heksan-1-yyliamino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(2-isopropyylioksatsoli-5-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-135	(6S,E)-metyyli-7-(1-(2-(bisyk-lo[3.2.1]oktan-8-yyliamino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3,5-dimetyyli-isoksatsoli-4-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-136	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(5-karboksi-2-am inoadamantaani)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(4-metyylipyrimidiini-5-karboksamido)-7-ok-sohept-2-enoaatti
III-137	(6S,E)-metyyli-7-(1-(2-(4-aminoadam-antaani-N,N-dimetyyli-1-karboksamidi)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-okso-6-(1,2,3,4-tetrahy-dronaftaleeni-2-karboksamido)hept-2-enoaatti
III-138	(S,E)-6-(2-asetyylioksatsoli-4-karboks-amido)-N7-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-di-hydropyridin-3-yyli)-N1,N1-dietyylihept-2-eenidiamidi
III-139	(S,E)-N7-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-di-

Yhdiste	Nimi
	hydropyridin-3-yyli)-6-((S)-1,4-diatsabisyklo[2.2.2]oktaani-2-karboksamido)-N1,N1-dietyylihept-2-eenidiamidi
III-140	(S,E)-N7-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-6-(1H-indoli-3-karboksamido)-N1-isopropyylihept-2-eenidiamidi
III-141	(S,E)-N7-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N1-isopropyyli-6-(6-metyyli-imidatso[2,1-b]tiatsoli-3-karboksamido)hept-2-eenidiamidi
III-142	(S,E)-6-(bentso[d]tiatsoli-2-karboksamido)-N7-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N1-pentyylihept-2-eenidiamidi
III-143	(S,E)-N7-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-6-(imidatso[2,1-b]tiatsoli-6-karboksamido)-N1-pentyylihept-2-eenidiamidi
III-144	(S,E)-N7-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N1-syklopropyyli-6-(4-hydroksi-6-(trifluorimetoksi)kinoliini-3-karboksamido)hept-2-eenidiamidi
III-145	(S,E)-N7-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-6-(kinnoliini-3-karboksamido)-N1-syklopropyylihept-2-eenidiamidi

Yhdiste	Nimi
III-146	(S,E)-N7-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N1-syklopentyyli-6-(2-metyyli-1,8-naftyridiini-3-karboksamido)hept-2-eenidiamidi
III-147	(S,E)-N7-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N1-syklopentyyli-6-(3-etyylibentsofuraani-2-karboksamido)hept-2-eenidiamidi
III-148	(S,E)-N7-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N1-sykloheksyyli-6-(1-etyyli-1H-indoli-2-karboksamido)hept-2-eenidiamidi
III-149	(S,E)-N7-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N1-sykloheksyyli-6-(1,2,3,4-tetrahydrokinoliini-7-karboksamido)hept-2-eenidiamidi
III-150	(S,E)-N1-allyyli-N7-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-6-(1,6-naftyridiini-2-karboksamido)hept-2-eenidiamidi
III-151	(S,E)-N1-allyyli-N7-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-6-(2,6-naftyridiini-1-karboksamido)hept-2-eenidiamidi
III-152	(S,E)-N7-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-6-(5-bromi-2-metyylifuraani-3-karboksamido)-N1-fenyy-

Yhdiste	Nimi
	lihept-2-eenidiamidi
III-153	(S,E)-N7-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-6-(2,5-dimetyyli-furaani-3-karboksamido)-N1-fenyylihept-2-eenidiamidi
III-154	(S,E)-N1-bentsyyli-N7-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-6-(2,5-diklooritiatsoli-4-karboksamido)hept-2-eenidiamidi
III-155	(S,E)-N1-bentsyyli-N7-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-6-(4-bromitiatsoli-2-karboksamido)hept-2-eenidiamidi
III-156	(S,E)-bentsyyli-7-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(4-metyyli-2-fenyylitiatsoli-5-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-157	(S,E)-N-(1-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-1,7-diokso-7-fenyylihept-5-en-2-yyli)-1-metyyli-1H-imidatsoli-2-karboksamidi
III-158	(S,E)-isopropyyli-7-(1-(2-(bisyklo[2.1.1]heksan-1-yyliamino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-okso-6-(2H-1,2,3-triatsoli-4-karboksamido)hept-2-enoaatti
III-159	N-((2S,E)-1-(1-(2-(bisyklo[3.2.1]oktan-8-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-

Yhdiste	Nimi
	dihydropyridin-3-yyliamino)-1,7-diokso-okt-5-en-2-yyli)-1-metyyli-1H-1,2,4-triatsoli-3-karboksamidi
III-160	(S,E)-metyyli-6-(4-amino-1,2,5-oksadiatsoli-3-karboksamido)-7-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-oksohept-2-enoaatti
III-161	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(6-(dimetyyliamino)bentsofuraani-2-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-162	(S,E)-metyyli-6-(2-asetamidotiatsoli-5-karboksamido)-7-(1-(2-(bisyklo[1.1,1]pentan-1-yyliamino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-oksohept-2-enoaatti
III-163	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(5-karbamoyyli-1H-pyrroli-3-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-164	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(1-asetyyliamino-4-aminoadamantaani)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-okso-6-(5-sulfamoyylifuraani-3-karboksamido)hept-2-enoaatti
III-165	(S,E)-metyyli-6-(bentsofuraani-5-karboksamido)-7-(1-(2-(1-asetyyliamino-4-aminoadamantaani)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-okso-hept-2-enoaatti

Yhdiste	Nimi
III-166	(S,E)-metyyli-6-(bentsofuraani-6-karboksamido)-7-(1-(2-(4-aminoadamantaani-1-karboksamidi)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-oksohept-2-enoaatti
III-167	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(4-aminoadamantaani-1-karboksamidi)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(3-(1-metyylisyklopropyyli)-1,2,4-oksadiatsoli-5-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-168	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(5-metyyli-1,2,4-oksadiatsoli-3-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-169	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-okso-6-(1,2,3-tiadiatsoli-4-karboksamido)hept-2-enoaatti
III-170	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-okso-6-(1,2,4-tiadiatsoli-5-karboksamido)hept-2-enoaatti
III-171	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-okso-6-(1,3,4-tiadiatsoli-2-karboksamido)hept-2-enoaatti
III-172	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-okso-

Yhdiste	Nimi
	etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(4-syklopropyyli-1,2,3-tiadiatsoli-5-karboksamido)-7-oksohept-2-enoaatti
III-173	(S,E)-metyyli-7-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-okso-etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-okso-6-(1,2,5-tiadiatsoli-3-karboksamido)hept-2-enoaatti
III-174	(S,E)-metyyli-6-(4-formyyli-1,2,3-tiadiatsoli-5-karboksamido)-7-(1-(2-(2-karboksi-2-amino-5-(trifluorimetyyli)adamantaani)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-oksohept-2-enoaatti
III-175	(S,E)-metyyli-6-(4-(hydroksimetyyli)-1,2,3-tiadiatsoli-5-karboksamido)-7-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-7-oksohept-2-enoaatti

tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

10. Farmaseuttinen koostumus, joka käsittää jonkin patenttivaatimuksista 1-9 mukaisen yhdisteen aktiivisena ainesosana yhdessä vähintään yhden farmaseuttisesti hyväksyttävän kantaja-aineen, apuaineen ja/tai laimennusaineen kanssa.

11. Jonkin patenttivaatimuksista 1–9 mukainen yhdiste käytettäväksi lääketieteessä.

12. Jonkin patenttivaatimuksista 1–9 mukainen yhdiste tai patenttivaatimuksen 10 mukainen farmaseuttinen koostumus käytettäväksi autoimmuuni- ja tulehdussairauksien, verisuonisairauksien, fibroottisten sairauksien, maksasairauksien, kolestaattisten maksasairauksien, syövän, neurodegeneratiivisten sairauksien, silmäsairauksien ja ihotautien hoidossa tai en-

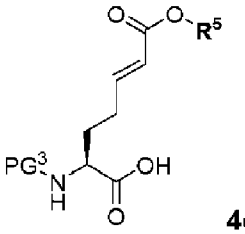
naltaehkäisyssä.

13. Yhdiste tai farmaseuttinen koostumus käytettäväksi patenttivaatimuksen 12 mukaisesti, jossa autoimmuuni- ja tulehdussairaudet käsittävät multippeliskleroosin, keliakian, Duhring-Brocqin taudin (dermatitis herpetiformis), gluteeniataksian, gluteeneuropatian, diabeteksen, nivelreuman, Gravesin taudin, tulehduksellisen suolistosairauden, systeemisen lupus erythematosuksen, psoriaasin ja ientulehduksen; jossa verisuonisairaudet käsittävät ateroskleroosin, tromboosin, verisuonten jäykkyyden; jossa fibroottiset sairaudet vaikuttavat keuhkoihin, munuaisiin, maksaan, ihoon tai suolistoon, kuten kystinen fibroosi, munuaisfibroosi ja diabeettinen nefropatia, suolistofibroosi, idiopaattinen keuhkofibroosi, maksafibroosi; jossa maksasairaudet käsittävät alkoholiperäisen maksatulehduksen, alkoholiperäisen rasvamaksatulehduksen, ei-alkoholiperäisen rasvamaksatulehduksen, ei-alkoholiperäisen rasvamaksasairauden, maksakirroosin, autoimmuunihepatiitin tai maksatulehduksen; jossa kolestaattiset maksasairaudet käsittävät primaarisen biliaarisen kolangiitin ja primaarisen sklerosoivan kolangiitin; jossa syöpä käsittää glioblastooman, melanooman, haimasyövän, munuaissolukarsinooman, meningeooman ja rintasyövän, jossa neurodegeneratiiviset sairaudet käsittävät Parkinsonin taudin, Huntingtonin taudin tai Alzheimerin taudin, jossa silmäsairaudet käsittävät glaukooman, kaihin, makulärappeuman tai uveiitin; ja jossa ihotaudit käsittävät aknen, psoriaasin, arpeutumisen ja ihon ikääntymisen.

14. Yhdiste tai farmaseuttinen koostumus käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksista 12 ja 13 mukaisesti keliakian hoidossa tai ennaltaehkäisyssä.

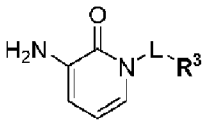
15. Menetelmä patenttivaatimuksen 1 mukaisen kaavan (Ic) mukaisen yhdisteen tuottamiseksi, käsittäen seuraavat:

Vaihe 1C: järjestetään yhdiste 4c



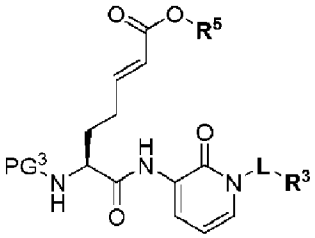
4c;

Vaihe 2C: suoritetaan yhdisteen 4c kytkentäreaktio yhdisteen 5 kanssa



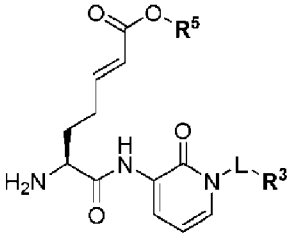
5

jotta saadaan yhdiste 6c



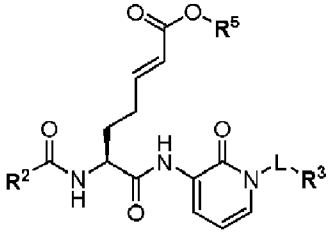
6c;

Vaihe 3C: poistetaan suojaus aminosuojaryhmästä PG^3, jotta saadaan yhdiste 7c



7c;

Vaihe 4C: suoritetaan yhdisteen 7c kytkentäreaktio karboksyylihapon (R^2-CO_2H 8) kanssa, jotta tuotetaan yhdiste, jolla on kaava (Ic)



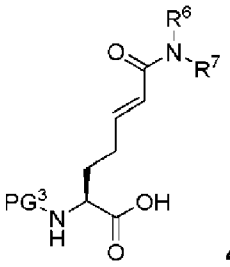
(Ic);

jossa L, R^2, R^3, R^5 tarkoittavat samaa kuin patenttivaatimuksessa 1 on määritelty, ja PG^3 on aminosuojaryhmä;

tai

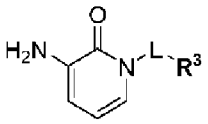
menetelmä patenttivaatimuksen 1 mukaisen kaavan (Id) mukaisen yhdisteen tuottamiseksi, käsittäen seuraavat:

Vaihe 1D: järjestetään yhdiste 4d



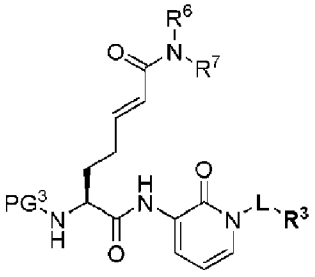
4d;

Vaihe 2D: suoritetaan yhdisteen 4d kytkentäreaktio yhdisteen 5 kanssa



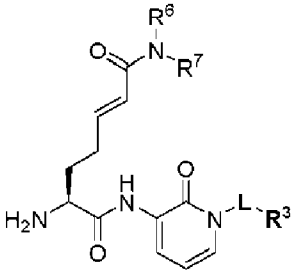
5

jotta saadaan yhdiste 6d



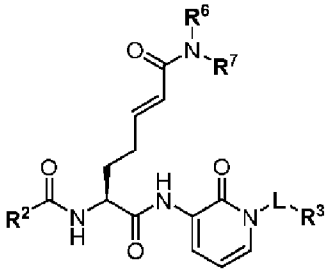
6d;

Vaihe 3D: poistetaan suojaus aminosuojaryhmästä PG^3, jotta saadaan yhdiste 7d



7d;

Vaihe 4D: suoritetaan yhdisteen 7d kytkentäreaktio karboksyylihapon (R^2-CO_2H 8) kanssa, jotta tuotetaan yhdiste, jolla on kaava (Id)

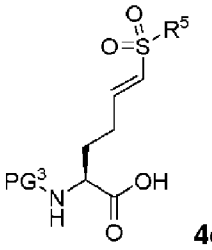

(Id);

jossa L, R^2, R^3, R^6, R^7 tarkoittavat samaa kuin edellä on määritelty kaavalle (Id), ja PG^3 on aminosuojaryhmä;

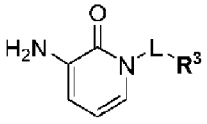
tai

menetelmä patenttivaatimuksen 1 mukaisen kaavan (Ie) mukaisen yhdisteen tuottamiseksi, käsittäen seuraavat:

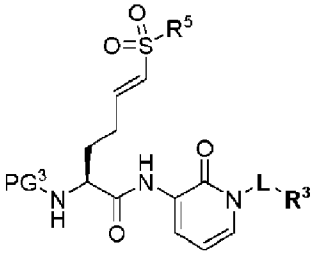
Vaihe 1E: järjestetään yhdiste 4e


4e;

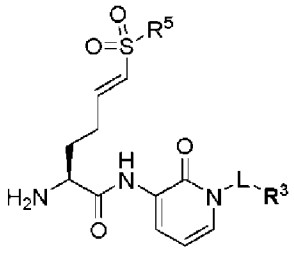
Vaihe 2E: suoritetaan yhdisteen 4e kytkentäreaktio yhdisteen 5 kanssa


5

jotta saadaan yhdiste 6e

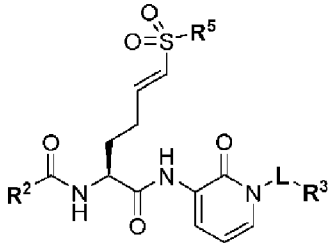

6e;

Vaihe 3E: poistetaan suojaus aminosuojaryhmästä PG^3, jotta saadaan yhdiste 7e



7e;

Vaihe 4E: suoritetaan yhdisteen 7e kytkentäreaktio karboksyylihapon (R^2-CO_2H 8) kanssa, jotta tuotetaan yhdiste, jolla on kaava (Ie)



(Ie)

jossa L, R^2, R^3, R^5 tarkoittavat samaa kuin edellä on määritelty kaavalle (Ie), ja PG^3 on aminosuojaryhmä.