

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

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

- (10) **FI/EP4192814 T3**
- (12) **EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION**
- (45) Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning - **31.10.2024**
Translation available to the public
- (97) Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för **07.08.2024**
det europeiska patentet - Date of grant of European patent
- (51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -
International patent classification
C07D 213/75 (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)
- (96) Eurooppapatentihakemus - Europeisk patentansökan - **EP22741488.5**
European patent application
- (22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date **30.06.2022**
- (97) Patentihakemuksen julkiseksitilopäivä - Patentansökans **14.06.2023**
publiceringsdag - Patent application available to the public
- (86) Kansainvälinen hakemus - Internationell **30.06.2022 PCT/EP2022068217**
ansökan - International application
- (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/EP2022/065435

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

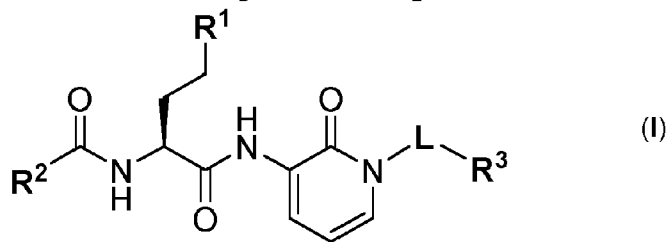
(72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor
1• PASTERNAK, Ralf, 64347 Griesheim, (DE)
2• BÜCHOLD, Christian, 61184 Karben, (DE)
3• HILS, Martin, 64295 Darmstadt, (DE)
4• STIELER, Martin, 64285 Darmstadt, (DE)
5• GERLACH, Uwe, 65795 Hattersheim, (DE)

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

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention
TRANSLUTAMINAASIN ESTÄJIÄ
INHIBITORS OF TRANSLUTAMINASES

PATENTTIVAATIMUKSET

1. Yhdiste, jolla on yleiskaava (I):



jossa

5

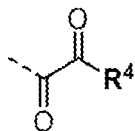
L on -L¹- tai -L¹-L²-; edullisesti -L¹-L²-;

L¹ on -CH₂-, -CH₂CH₂-, -CH₂CH₂CH₂-, -CH₂CO- tai -CH₂CH₂CO-;

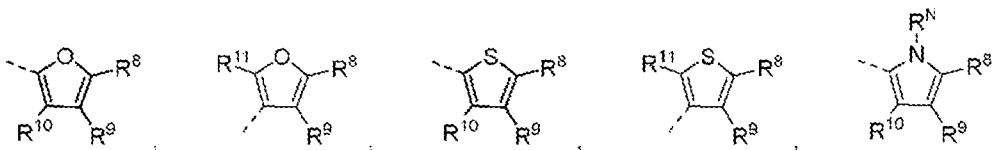
L² on sidos, -NR^{N1}-, -NR^{N1}CH₂-, -NR^{N1}CH₂CH₂- tai -NR^{N1}CH(CH₃)-;

10

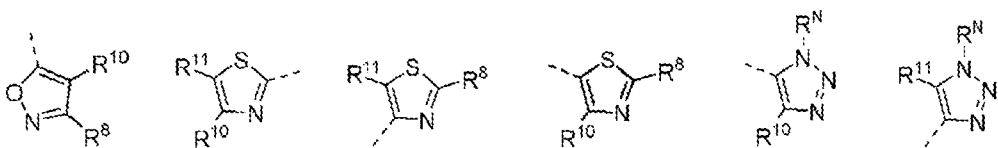
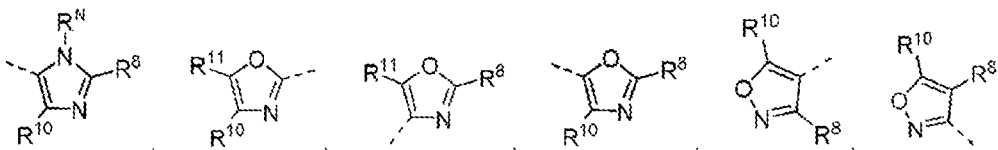
R¹ on



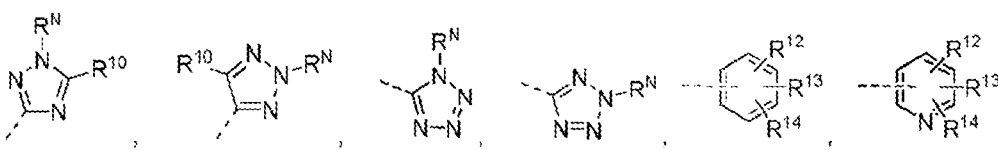
R² on

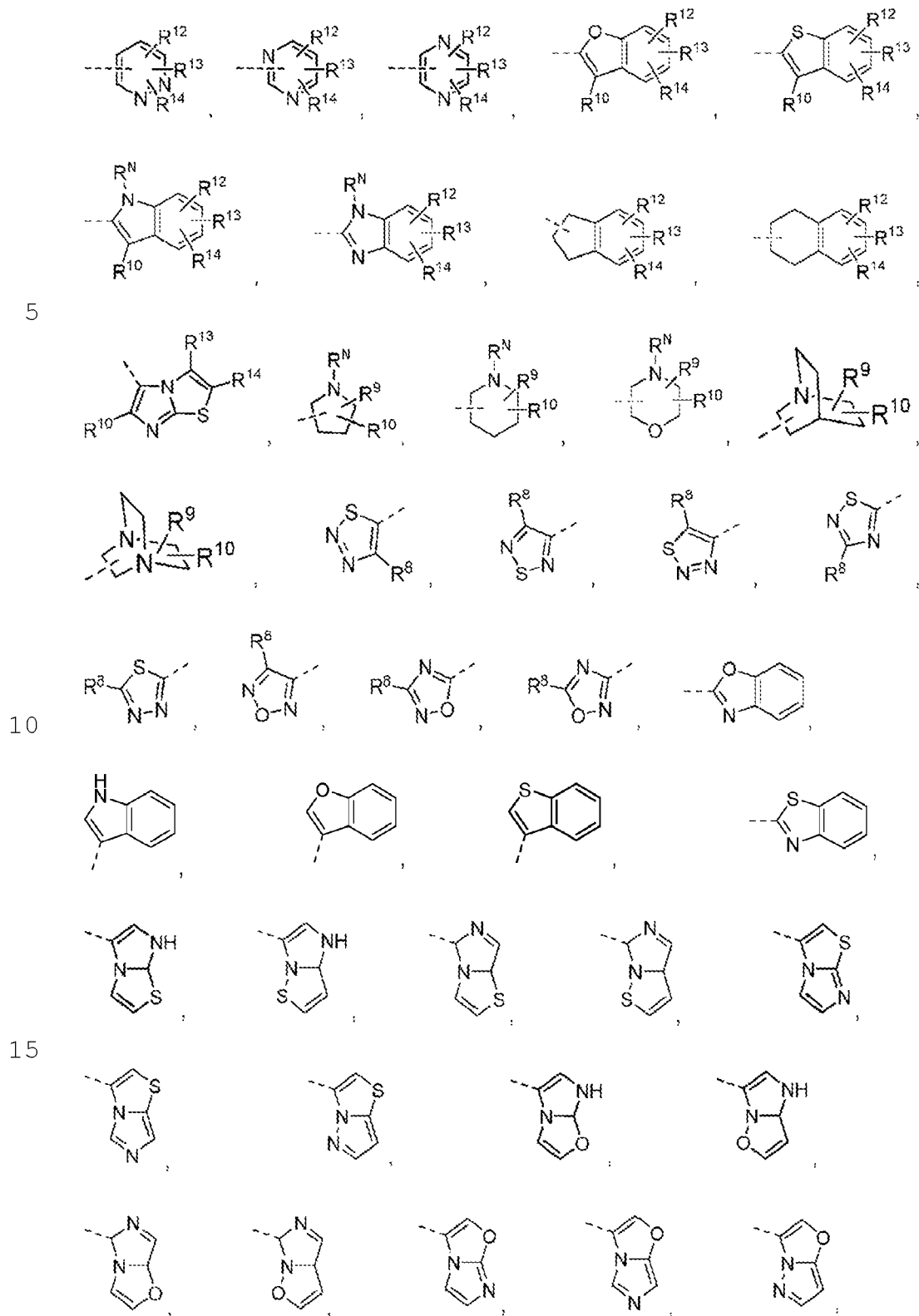


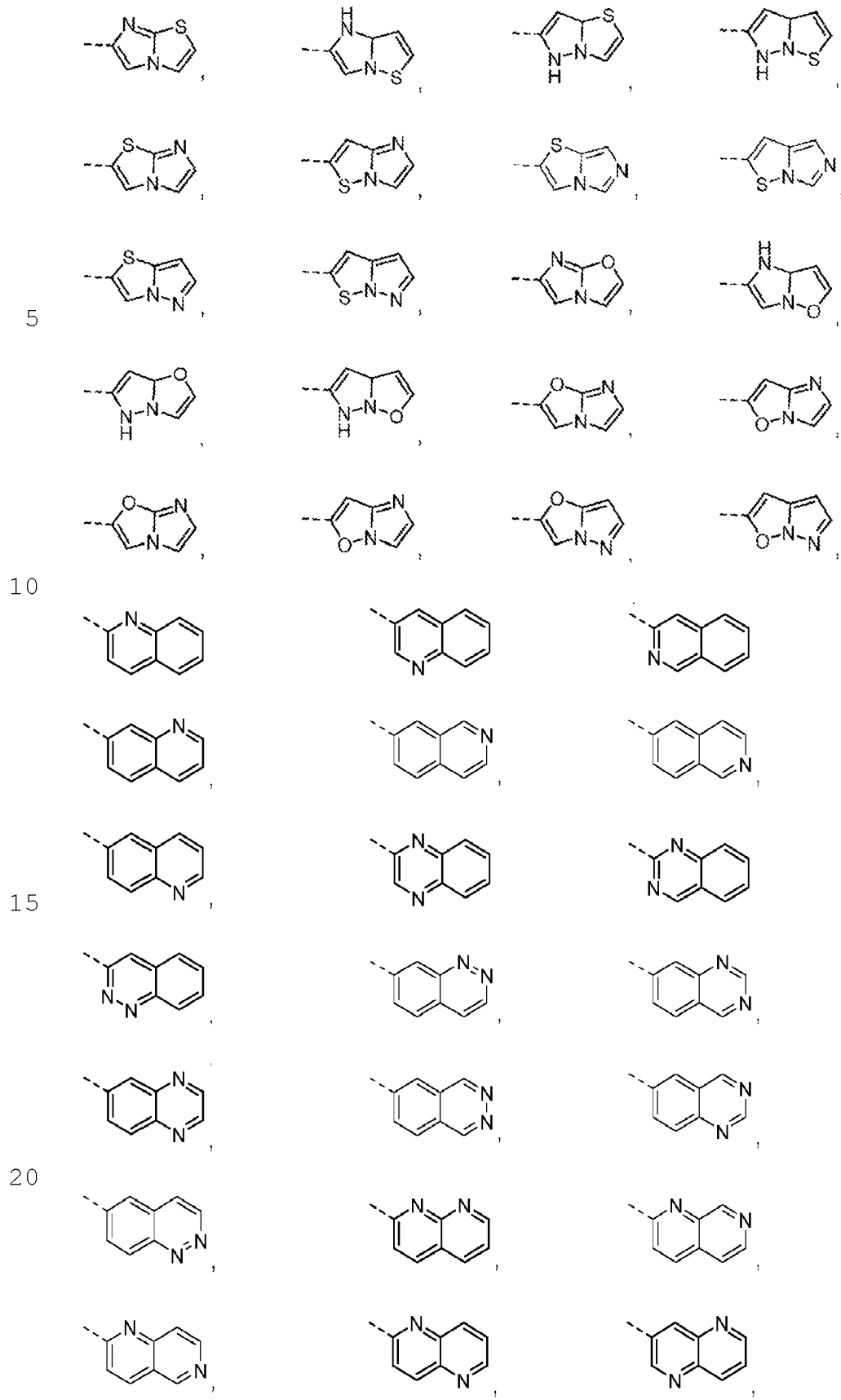
15

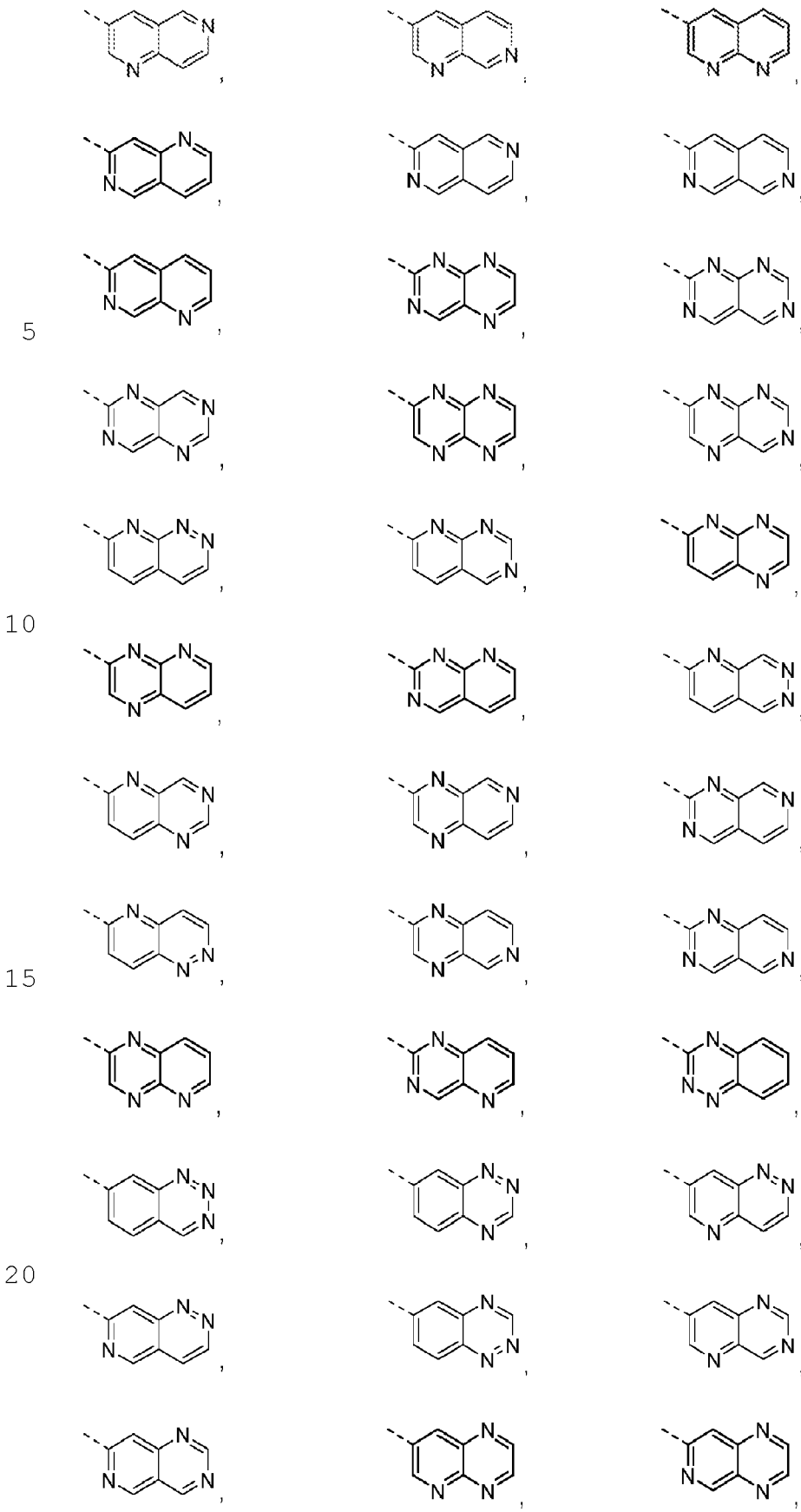


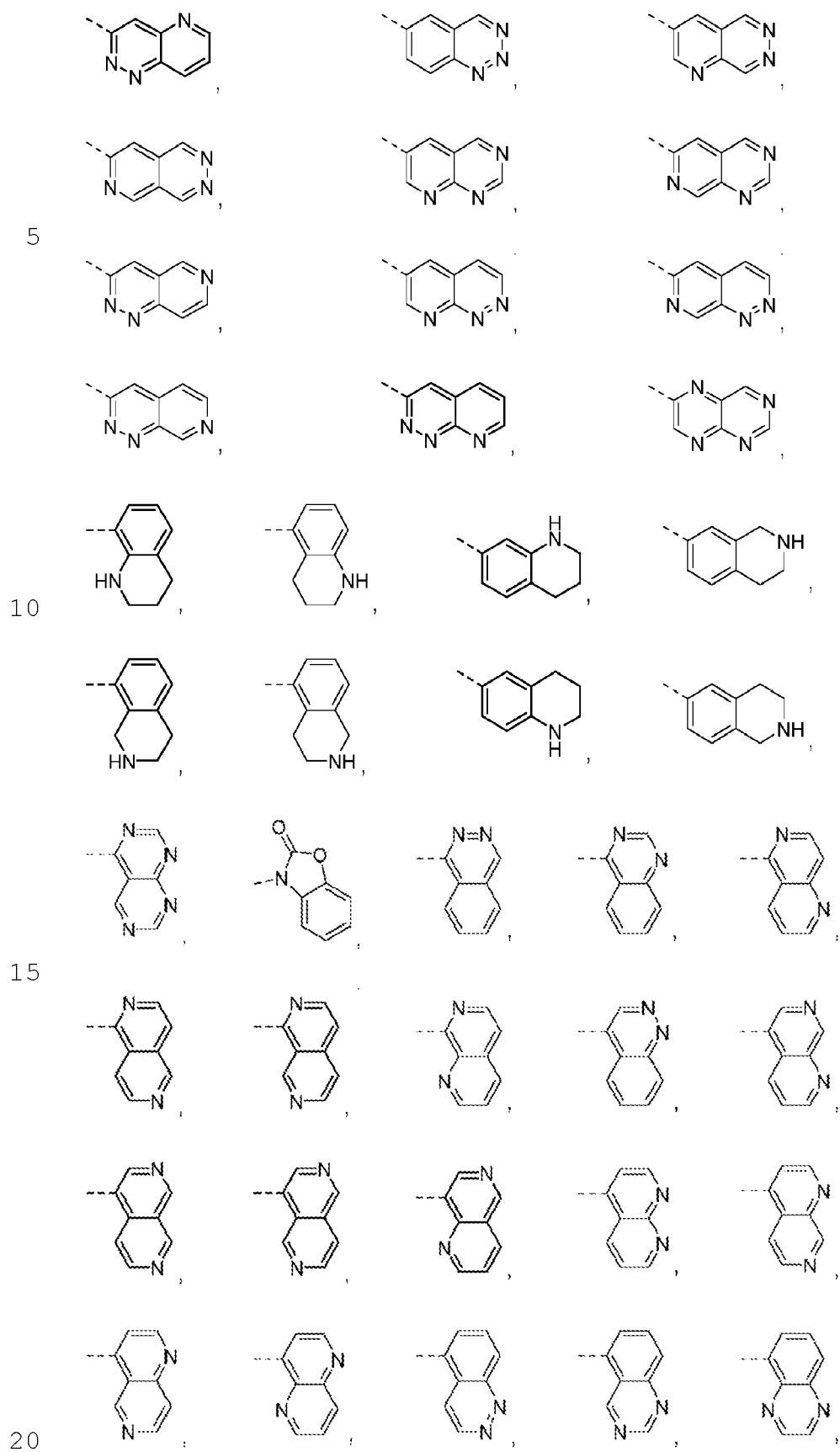
20

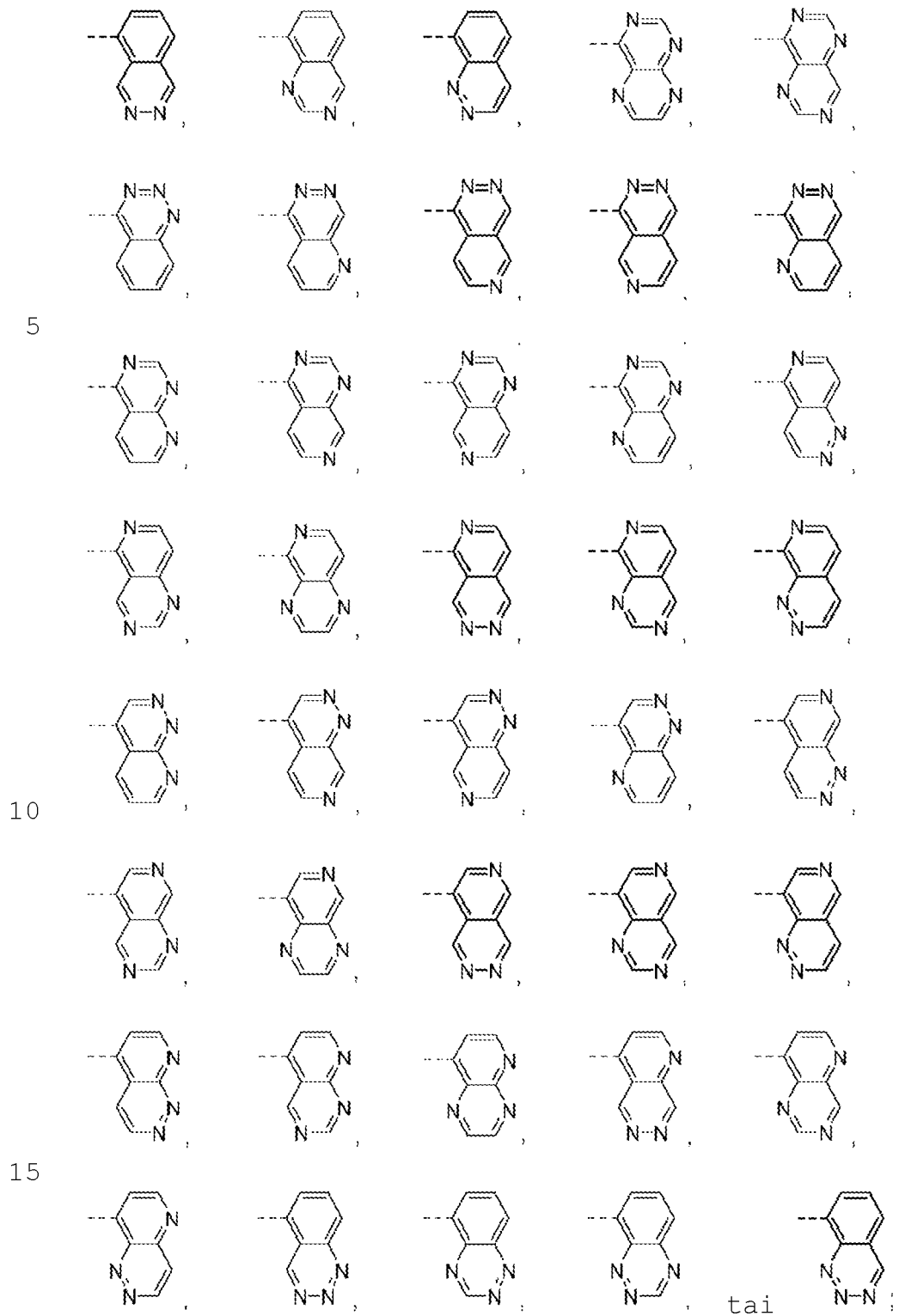












jossa substituomattomat bisykliset tähteet voi olla substituoitu 1-5:llä substituentaista R⁹-

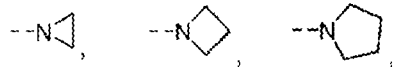
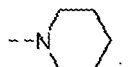
R^{14} ja R^N ; ja edullisesti 1-3:lla substituenteista R^{11} - R^{13} ;

R^3 on bisyklo[1.1.1]pentyyli,
 bisyklo[2.1.1]heksyyli, bisyklo[2.2.1]heptyyli,
 5 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-ho-
 moisotwistyli, adamantyyli, diamantyyli, heksametylee-
 nitetraminyyli, ja edellä mainitut tähteet sisältävät
 10 valinnaisesti yhden tai useamman C=C-kaksoissidoksen
 ja/tai ne on valinnaisesti substituoitu yhdellä tai use-
 amalla 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 riippumat-
 tomasti -H, -F, -Cl, -Br, -CN, -OH, -CH₃, -CH₂CH₃, -
 15 CH₂CH₂CH₃, -CH(CH₃)₂, -CHF₂, -CF₃, -CH₂CF₃, -COCH₃, -
 COCH₂CH₃, -CO₂H, -CO₂CH₃, -CO₂C₂H₅, -CONH₂, -CONHCH₃, -
 CON(CH₃)₂, -CONHC₂H₅, -CH₂CO₂H, -CH₂CO₂CH₃, -CH₂CO₂C₂H₅, -
 CH₂CONH₂, -CH₂CONHCH₃, -CH₂CON(CH₃)₂, -CH₂CONHC₂H₅, -
 NHCOCH₃, -NHCOC₂H₅, -NHCOCF₃, -NHCOC₂H₅CF₃, -NHSO₂CH₃, -
 20 NHSO₂C₂H₅, -NHSO₂CHF₂, -NHSO₂CF₃ tai -NHSO₂CH₂CF₃;

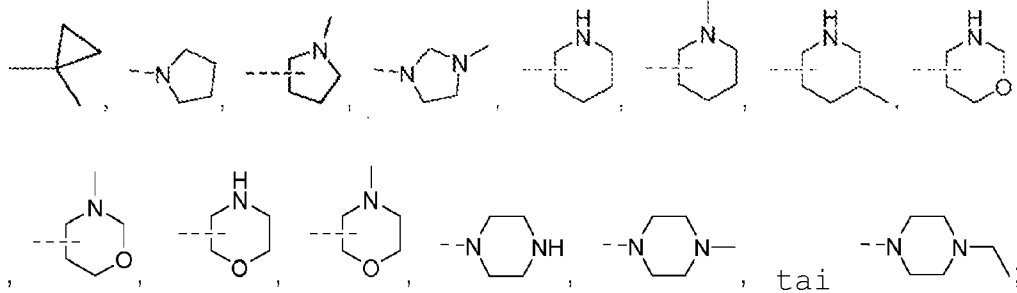
R^4 on -NR⁶R⁷;

R^6 ja R^7 ovat toisistaan riippumattomasti -H, -
 CH₃, -CH₂CH₂CH₃, -CH(CH₃)₂, -CH₂CH₂CH₂CH₃, -CH₂CH₂CH₂CH₂CH₃,
 -CH₂CH(CH₃)₂, -C(CH₃)₃, -CH₂CH=CH₂, -CH₂CH=CH(CH₃), -
 25 CH₂CH=C(CH₃)₂, -CH₂CH=CHCH₂CH₃, -syklo-C₃H₅, -syklo-C₄H₇,
 -syklo-C₅H₉, -syklo-C₆H₁₁, -CH₂-syklo-C₃H₅, -CH₂-syklo-
 C₄H₇, -CH₂-syklo-C₅H₉, -CH₂-syklo-C₆H₁₁, -Ph, -CH₂-Ph, -
 CH₂OCH₃, -CH₂OCH₂CH₃, -CH₂CH₂OCH₃, -CH₂CH₂OCH₂CH₃, -
 CH₂CH₂NHCH₃ tai -CH₂CH₂N(CH₃)₂,

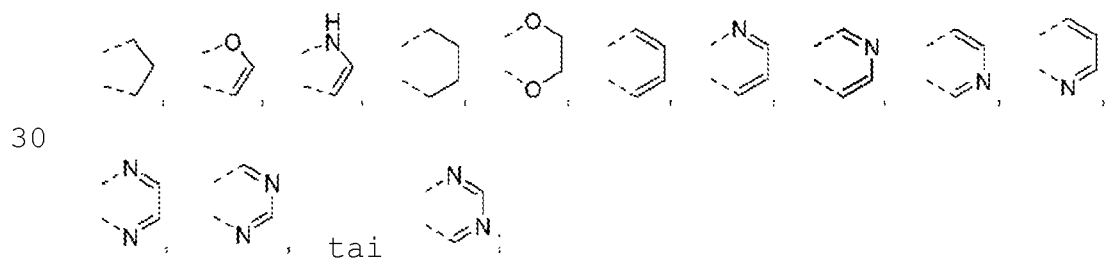
30 tai -NR⁶R⁷ on ,
;
 tai

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, -NO₂,
 -CH₃, -C₂H₅, -C₃H₇, -CH(CH₃)₂, -C₄H₉, -CH₂-CH(CH₃)₂, -
 35 CH(CH₃)-C₂H₅, -C(CH₃)₃, -syklo-C₃H₅, -CH₂-syklo-C₃H₅, -

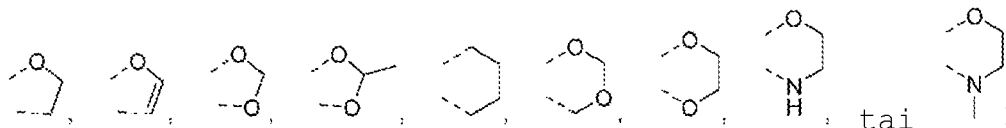
- CH_2OH , $-\text{CH}_2\text{F}$, $-\text{CHF}_2$, $-\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{Cl}$, $-\text{CH}_2\text{Br}$, $-\text{CH}_2\text{I}$, $-\text{CH}_2-$
 CH_2F , $-\text{CH}_2-\text{CHF}_2$, $-\text{CH}_2-\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2-\text{CH}_2\text{Cl}$, $-\text{CH}_2-\text{CH}_2\text{Br}$, $-\text{CH}_2-$
 CH_2I , $-\text{OCH}_3$, $-\text{OC}_2\text{H}_5$, $-\text{OC}_3\text{H}_7$, $-\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{OC}(\text{CH}_3)_3$, $-\text{OC}_4\text{H}_9$,
 $-\text{OCHF}_2$, $-\text{OCF}_3$, $-\text{OCH}_2\text{CF}_3$, $-\text{OC}_2\text{F}_5$, $-\text{OCH}_2\text{OCH}_3$, $-\text{O-syklo-C}_3\text{H}_5$,
 5 $-\text{OCH}_2\text{-syklo-C}_3\text{H}_5$, $-\text{O-C}_2\text{H}_4\text{-syklo-C}_3\text{H}_5$, $-\text{CHO}$, $-\text{COCH}_3$, $-$
 COCF_3 , $-\text{COC}_2\text{H}_5$, $-\text{COC}_3\text{H}_7$, $-\text{COCH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{COC}(\text{CH}_3)_3$, $-\text{COOH}$, $-$
 COOCH_3 , $-\text{COOC}_2\text{H}_5$, $-\text{COOC}_3\text{H}_7$, $-\text{COOCH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{COOC}(\text{CH}_3)_3$, $-$
 OOC-CH_3 , $-\text{OOC-CF}_3$, $-\text{OOC-C}_2\text{H}_5$, $-\text{OOC-C}_3\text{H}_7$, $-\text{OOC-CH}(\text{CH}_3)_2$, $-$
 $\text{OOC-C}(\text{CH}_3)_3$, $-\text{NH}_2$, $-\text{NHCH}_3$, $-\text{NHC}_2\text{H}_5$, $-\text{NHC}_3\text{H}_7$, $-\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$,
 10 $-\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$, $-\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$, $-\text{N}(\text{C}_3\text{H}_7)_2$, $-\text{N}[\text{CH}(\text{CH}_3)_2]_2$,
 $-\text{N}[\text{C}(\text{CH}_3)_3]_2$, $-\text{NHCOCH}_3$, $-\text{NHCOCF}_3$, $-\text{NHCOC}_2\text{H}_5$, $-\text{NHCOC}_3\text{H}_7$, $-$
 $\text{NHCOCH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{NHCOC}(\text{CH}_3)_3$, $-\text{CONH}_2$, $-\text{CONHCH}_3$, $-\text{CONHC}_2\text{H}_5$, $-$
 CONHC_3H_7 , $-\text{CONHCH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{CONH-syklo-C}_3\text{H}_5$, $-\text{CONHC}(\text{CH}_3)_3$, $-$
 $\text{CON}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{CON}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$, $-\text{CON}(\text{C}_3\text{H}_7)_2$, $-\text{CON}[\text{CH}(\text{CH}_3)_2]_2$, $-$
 15 $\text{CON}[\text{C}(\text{CH}_3)_3]_2$, $-\text{SO}_2\text{NH}_2$, $-\text{SO}_2\text{NHCH}_3$, $-\text{SO}_2\text{NHC}_2\text{H}_5$, $-\text{SO}_2\text{NHC}_3\text{H}_7$,
 $-\text{SO}_2\text{NHCH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{SO}_2\text{NH-syklo-C}_3\text{H}_5$, $-\text{SO}_2\text{NHC}(\text{CH}_3)_3$, $-$
 $\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{SO}_2\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$, $-\text{SO}_2\text{N}(\text{C}_3\text{H}_7)_2$, $-\text{SO}_2\text{N}[\text{CH}(\text{CH}_3)_2]_2$, $-$
 $\text{SO}_2\text{N}[\text{C}(\text{CH}_3)_3]_2$, $-\text{NHSO}_2\text{CH}_3$, $-\text{NHSO}_2\text{CF}_3$, $-\text{NHSO}_2\text{C}_2\text{H}_5$, $-$
 $\text{NHSO}_2\text{C}_3\text{H}_7$, $-\text{NHSO}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{NHSO}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$, $-\text{CH}=\text{CH}_2$, $-\text{CH}_2-$
 20 $\text{CH}=\text{CH}_2$, $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$, $-\text{CH}=\text{CH-CH}_3$, $-\text{C}\equiv\text{CH}$, $-\text{C}\equiv\text{C-CH}_3$, $-\text{CH}_2-$
 $\text{C}\equiv\text{CH}$, $-\text{Ph}$, $-\text{O-Ph}$, $-\text{O-CH}_2\text{-Ph}$,



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



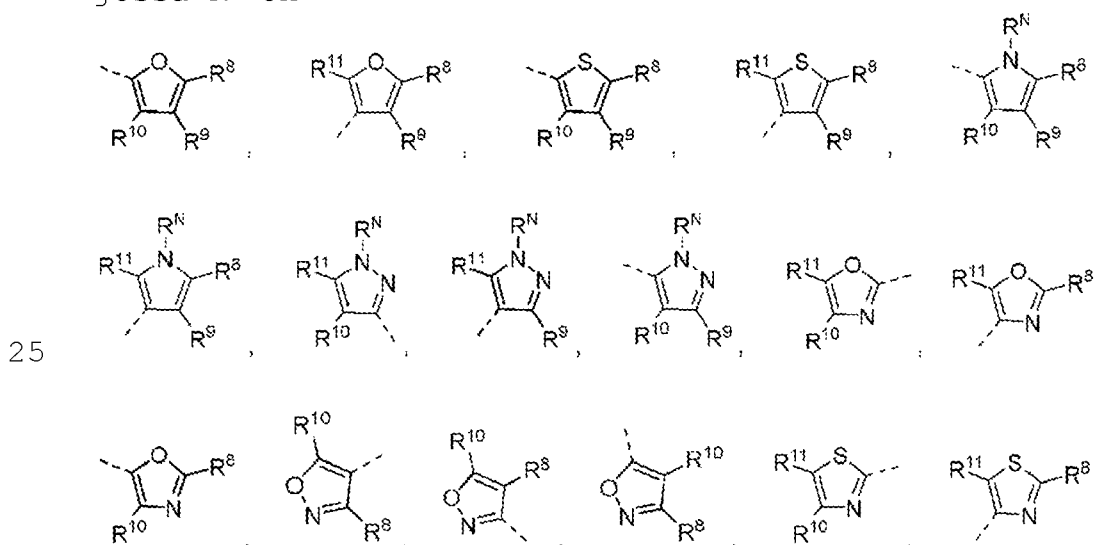
tai R^{12} ja R^{13} tai R^{13} ja R^{14} voivat yhdessä muodostaa jonkin seuraavista viisijäsenisistä tai kuusijäsenisistä renkaista:

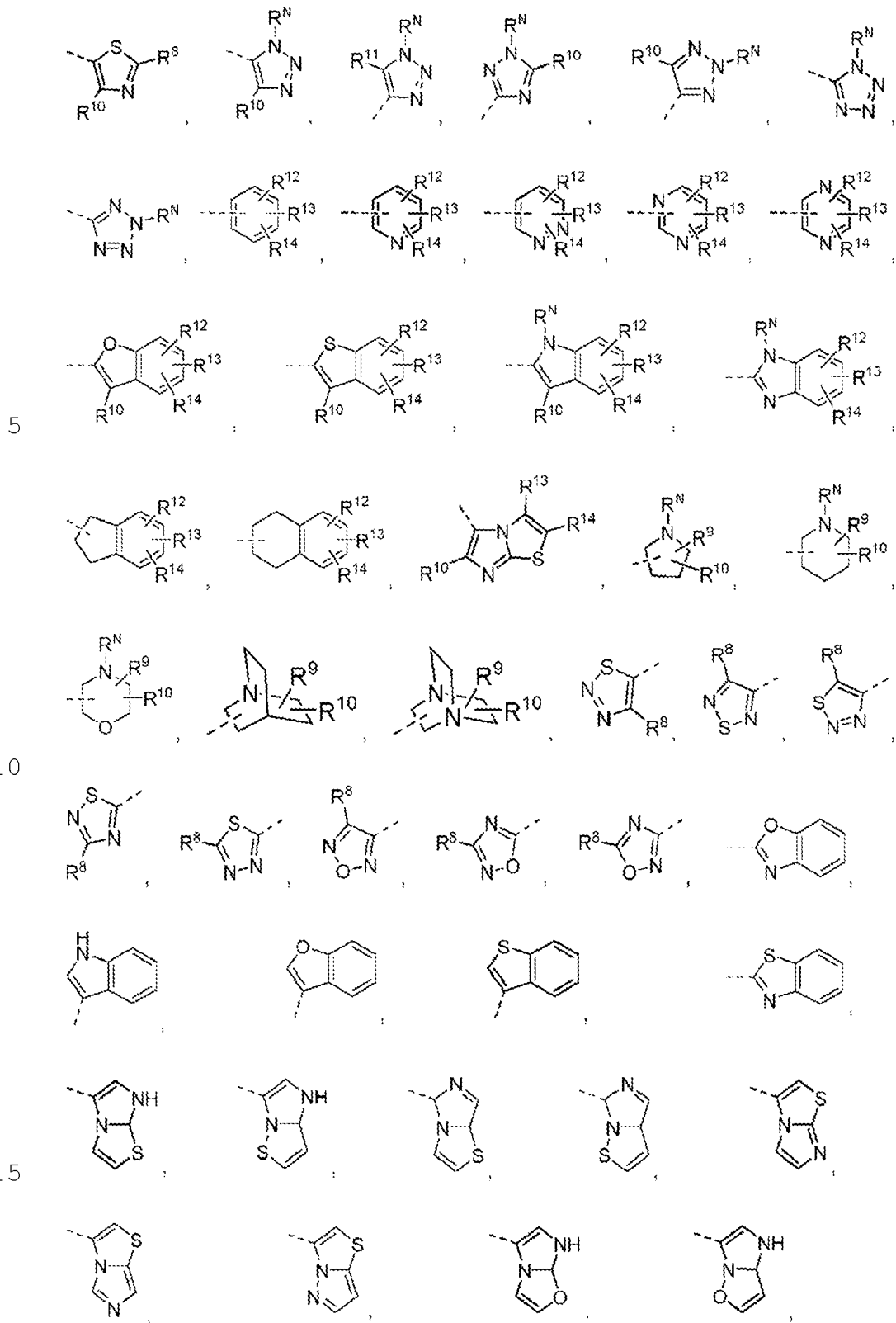


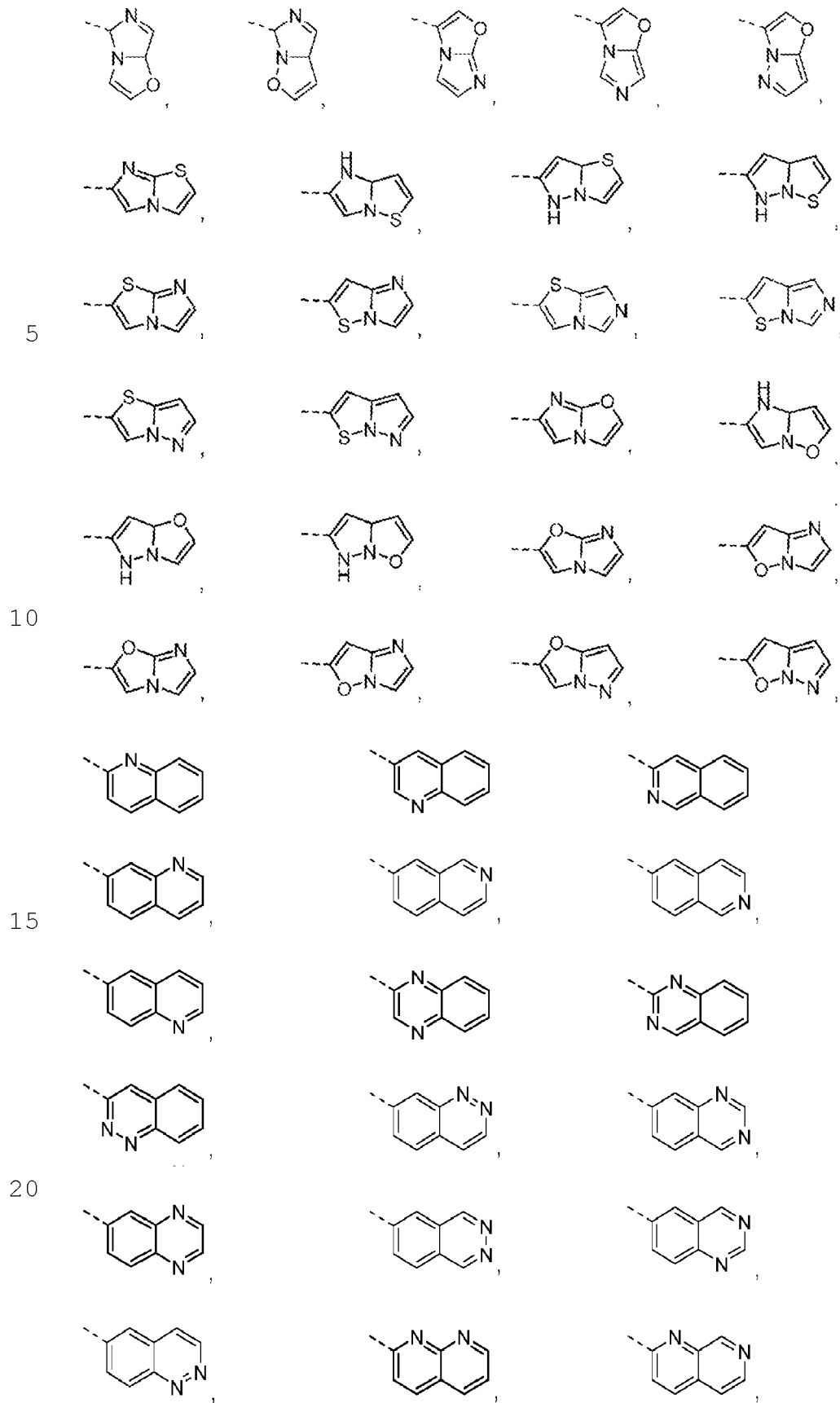
- 5 R^N on -H, -CH₃, -C₂H₅, -C₃H₇, -CH(CH₃)₂, -C₄H₉, -CH₂-CH(CH₃)₂, -CH(CH₃)-C₂H₅, -C(CH₃)₃, -syklo-C₃H₅, -syklo-C₄H₇, -syklo-C₅H₉, -CH₂-syklo-C₃H₅, -CH₂-syklo-C₄H₇, -CH₂-syklo-C₅H₉, -CH₂F, -CHF₂, -CF₃, -CH₂Cl, -CH₂Br, -CH₂I, -CH₂-CH₂F, -CH₂-CHF₂, -CH₂-CF₃, -CH₂-CH₂Cl, -CH₂-CH₂Br, -CH₂-CH₂I, -CH₂-CH=CH₂, -CH₂-C≡CH, -CHO, -COCH₃, -COC₂H₅, -COC₃H₇, -COCH(CH₃)₂, -COC(CH₃)₃, -CO-syklo-C₃H₅, -CO-syklo-C₄H₇, -CO-syklo-C₅H₉, -COOCH₃, -COOC₂H₅, -COOC₃H₇, -COOCH(CH₃)₂, -COOC(CH₃)₃, -COOCH₂Ph, -SO₂CH₃, -SO₂CF₃, -SO₂C₂H₅, -SO₂C₃H₇, -SO₂CH(CH₃)₂, -SO₂-syklo-C₃H₅ tai -SO₂C(CH₃)₃;

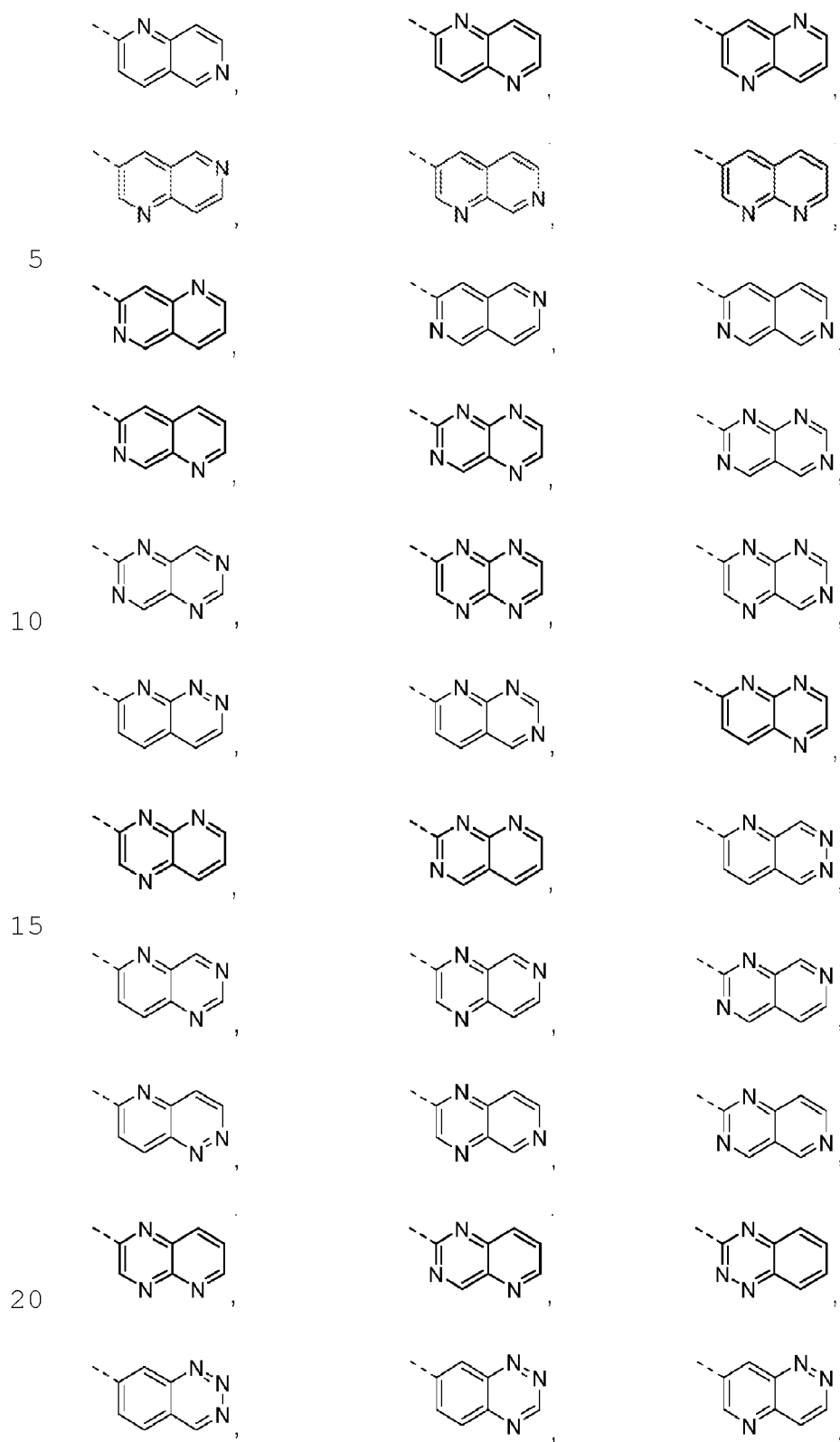
- 10 R^{N1} on -H, -CH₃ tai -CH₂CH₃;
tai sen diastereomeeri, enantiomeeri, diastereomeerien seos, enantiomeerien seos, rasemaatti, solvaatti, hydraatti tai farmaseuttisesti hyväksyttävä
15 suola.

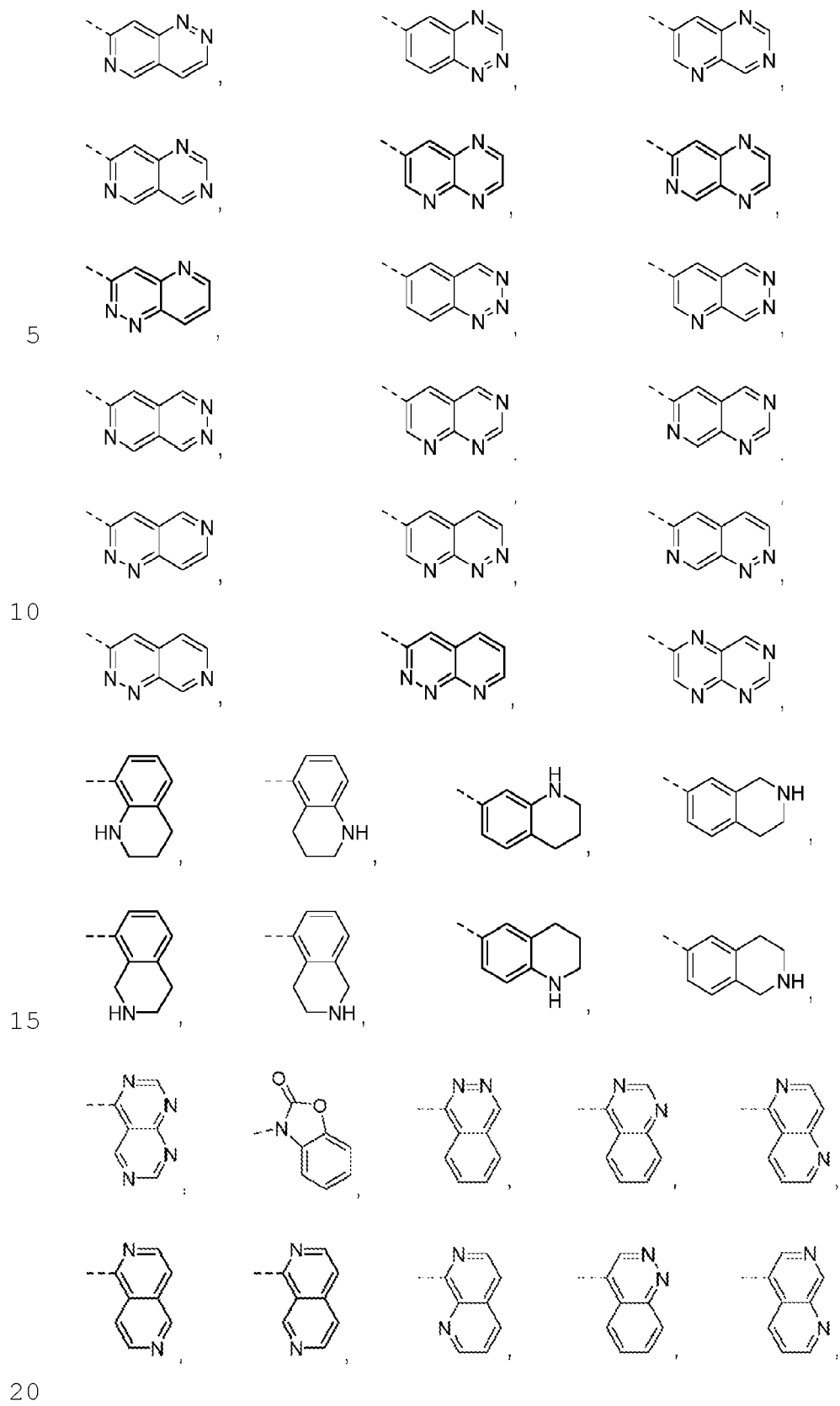
2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, jossa R^2 on

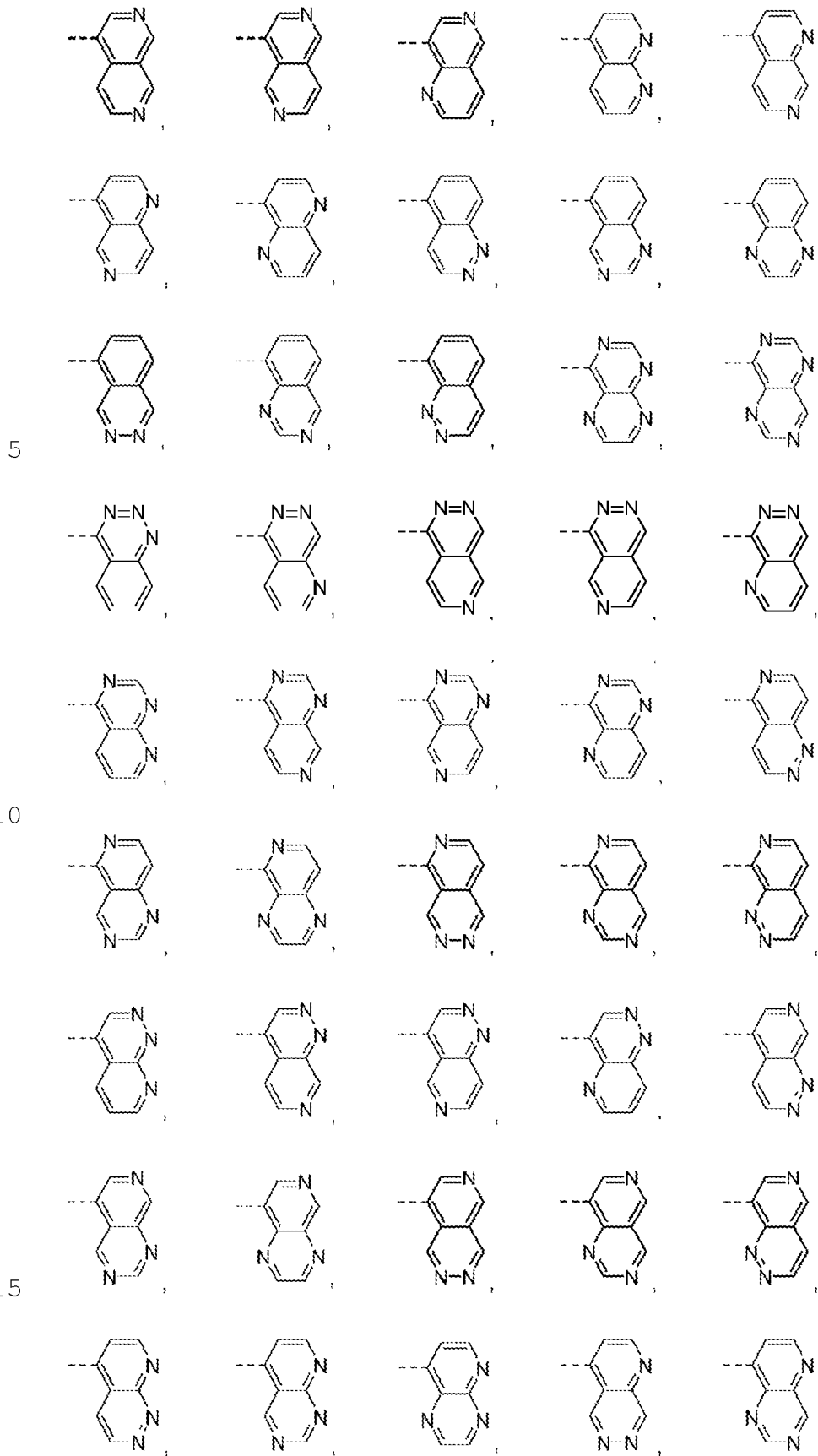


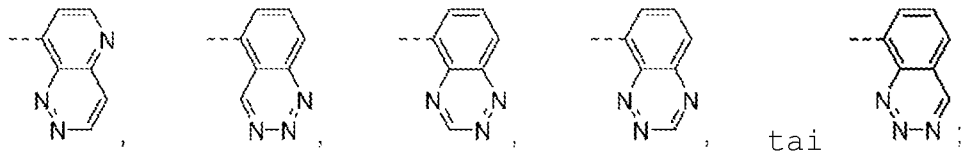






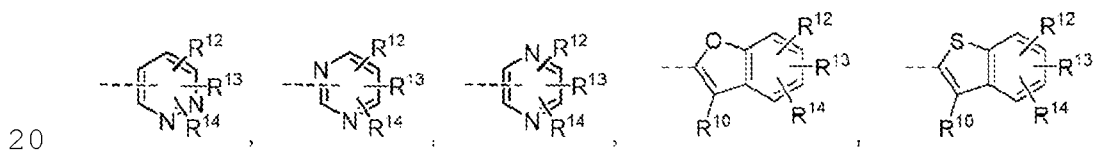
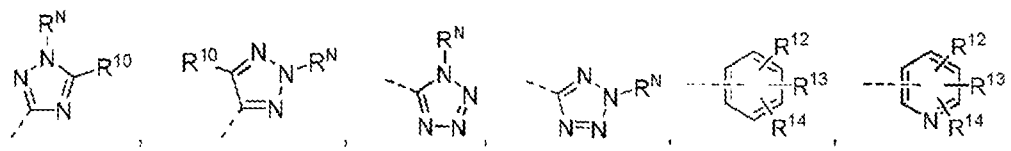
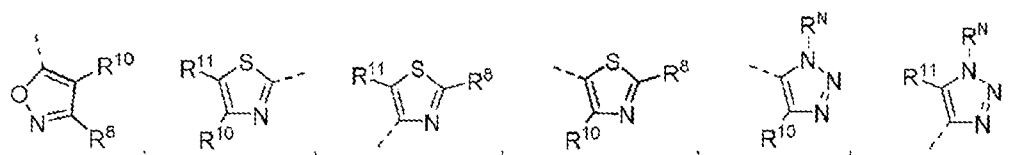
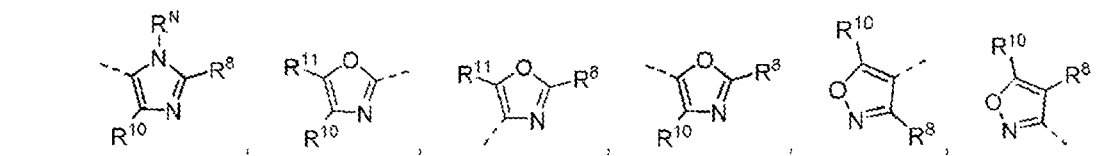
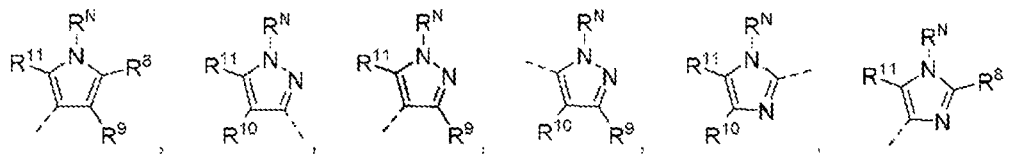
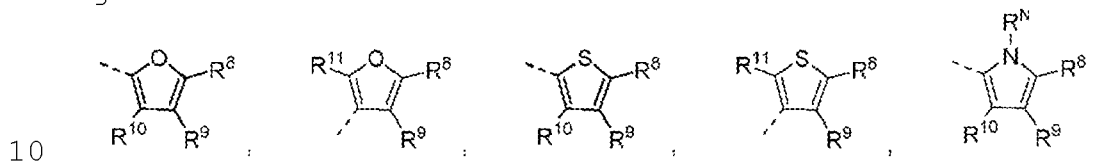


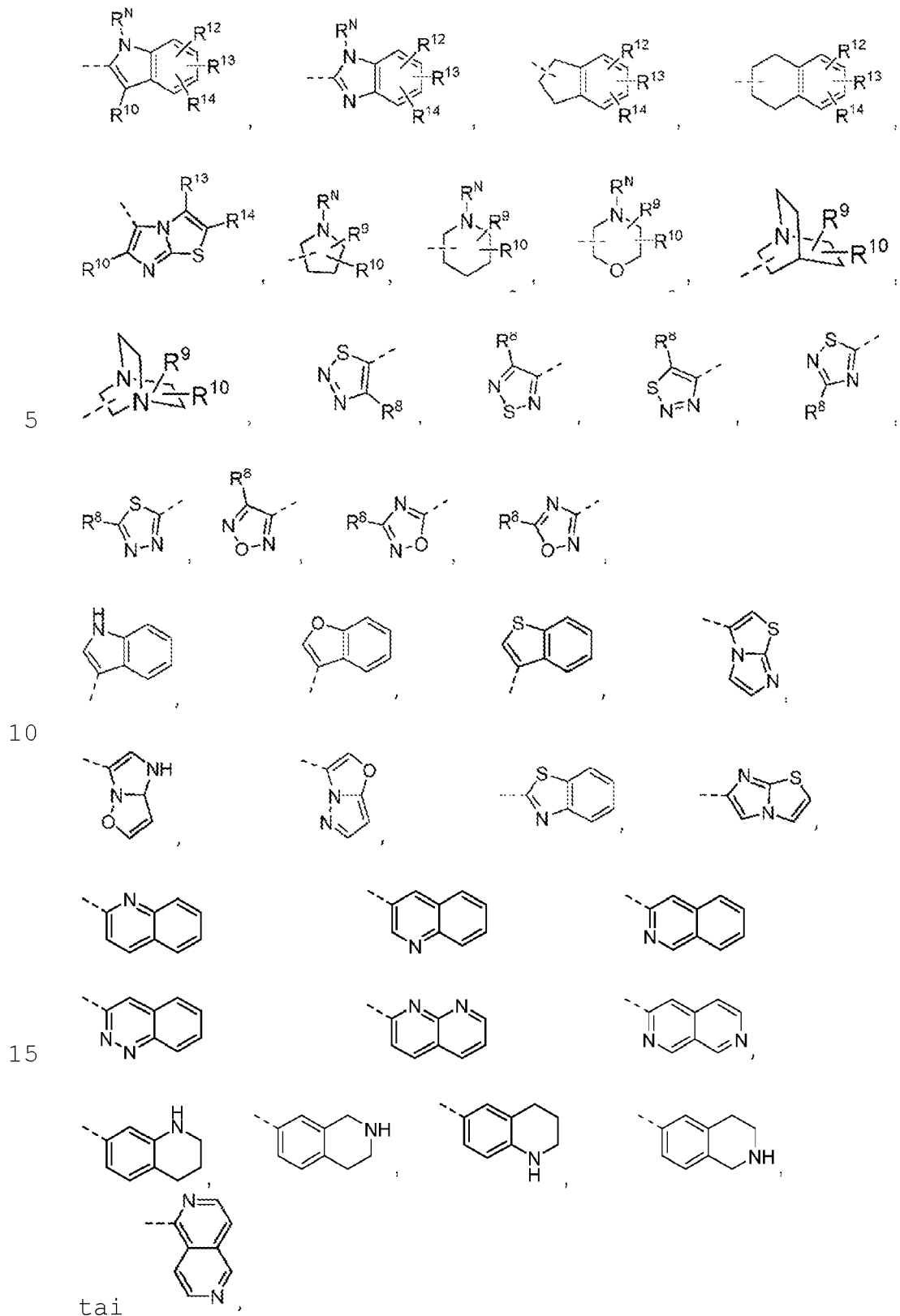




jossa substituotut bisykliset tähteet voi olla substituoitu 1-5:llä substitueista R^9 - R^{14} ja R^N ; ja edullisesti 1-3:lla substitueista R^{11} - R^{13} , ja substitueilla R^9 - R^{14} ja R^N on patenttivaatimuksessa 1 määritellyt merkitykset.

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

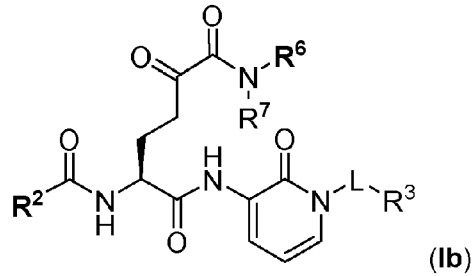




jossa substituimattomat bisykliset tähteet
 20 voi olla substituoitu 1-5:llä substitueista R^9 - R^{14} ja R^N ; ja edullisesti 1-3:lla substitueista R^{11} -

R^{13} , ja substituenteilla R^9-R^{14} ja R^N on patenttivaatimuksessa 1 määritellyt merkitykset.

4. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, jossa yhdisteellä on kaava (Ib)



5

jossa

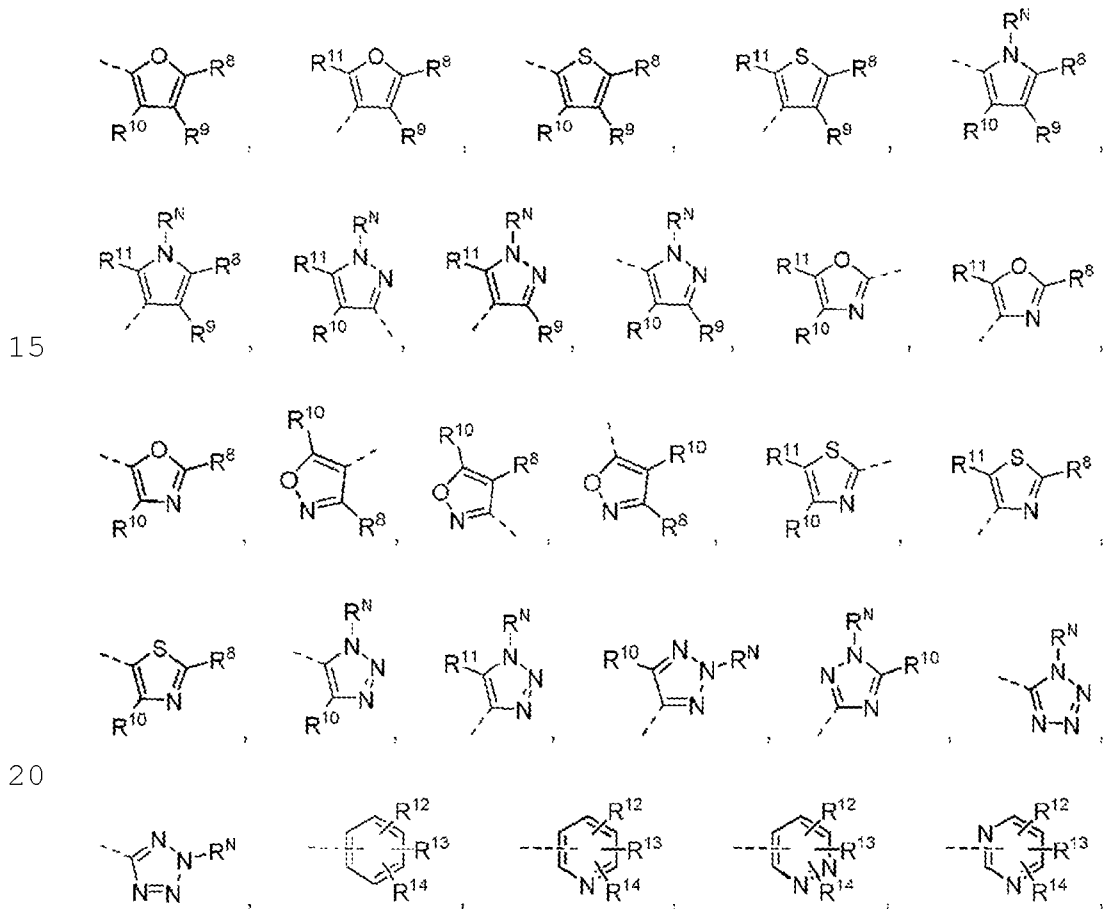
L on $-L^1-$ tai $-L^1-L^2-$; edullisesti $-L^1-L^2-$;

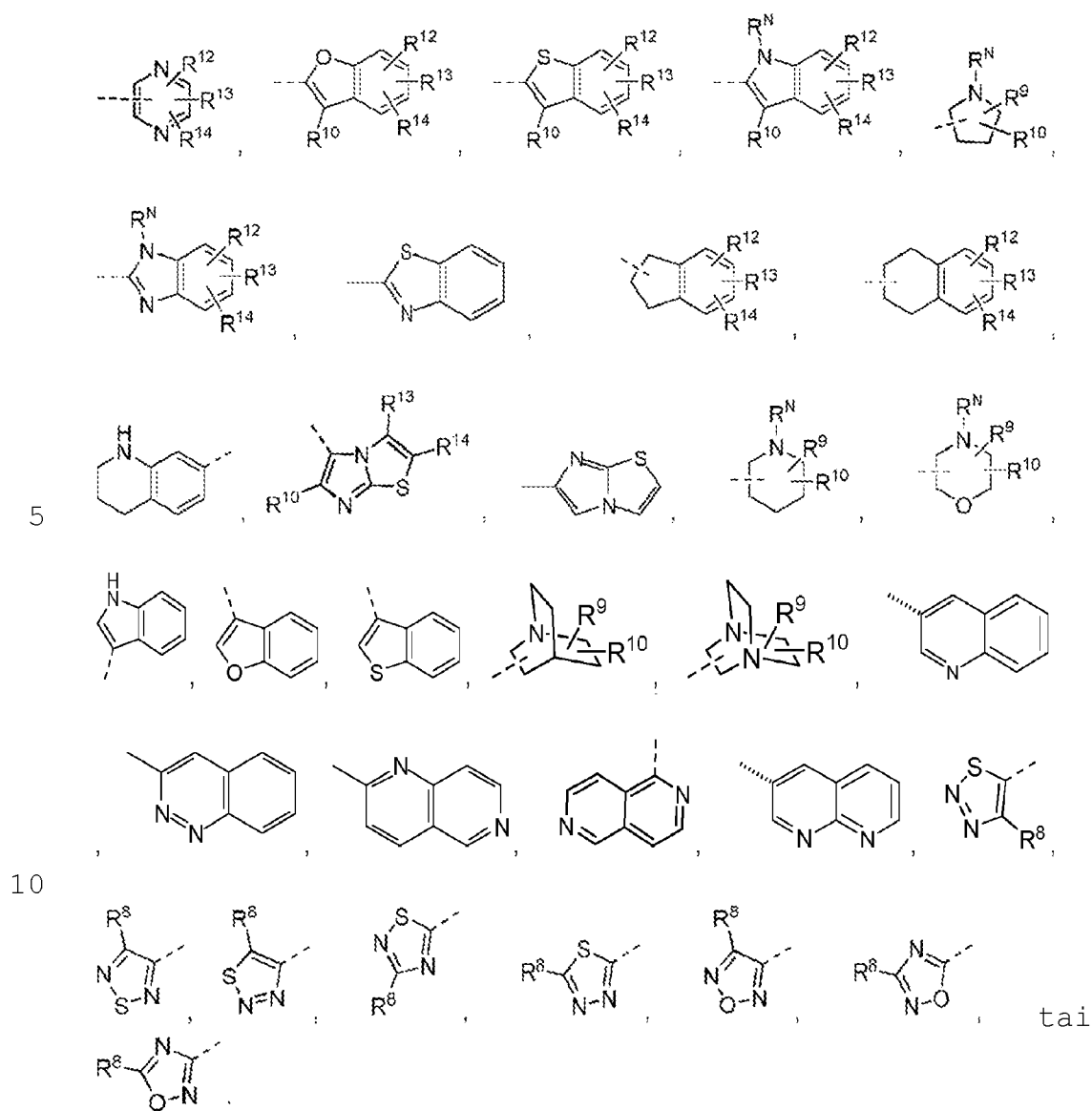
L^1 on $-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CO}-$ tai $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CO}-$;

10

L^2 on sidos, $-\text{NR}^{\text{N}1}-$, $-\text{NR}^{\text{N}1}\text{CH}_2-$, $-\text{NR}^{\text{N}1}\text{CH}_2\text{CH}_2-$ tai $-\text{NR}^{\text{N}1}\text{CH}(\text{CH}_3)-$;

R^2 on





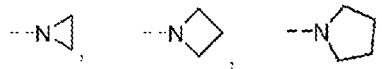
R^3 on bisyklo[1.1.1]pentyyli,
 bisyklo[2.1.1]heksyyli, bisyklo[2.2.1]heptyyli,
 15 bisyklo[3.1.1]heptyyli, bisyklo[2.2.2]oktyyli,
 bisyklo[3.2.1]oktyyli, bisyklo[3.2.2]nonyyli,
 bisyklo[3.3.2]dekyyli, bisyklo[3.3.3]undekyyli, 4-ho-
 moisotwistyyli, adamantyyli, diamantyyli, heksametylee-
 nitetraminyyli, ja edellä mainitut tähteet sisältävät
 20 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;

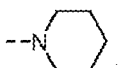
R^a , R^b , R^c , R^d ja R^e ovat toisistaan riippumat-
 tomasti -H, -F, -Cl, -Br, -CN, -OH, -CH₃, -CH₂CH₃, -

$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{CHF}_2$, $-\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{CF}_3$, $-\text{COCH}_3$, $-\text{COCH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CO}_2\text{H}$, $-\text{CO}_2\text{CH}_3$, $-\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5$, $-\text{CONH}_2$, $-\text{CONHCH}_3$, $-\text{CON}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{CONHC}_2\text{H}_5$, $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$, $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{C}_2\text{H}_5$, $-\text{CH}_2\text{CONH}_2$, $-\text{CH}_2\text{CONHCH}_3$, $-\text{CH}_2\text{CON}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{CH}_2\text{CONHC}_2\text{H}_5$,
 5 NHCOCH_3 , $-\text{NHCOC}_2\text{H}_5$, $-\text{NHCOCF}_3$, $-\text{NHCOCH}_2\text{CF}_3$, $-\text{NHSO}_2\text{CH}_3$, $-\text{NHSO}_2\text{C}_2\text{H}_5$, $-\text{NHSO}_2\text{CHF}_2$, $-\text{NHSO}_2\text{CF}_3$ tai $-\text{NHSO}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$;

R^4 on $-\text{NR}^6\text{R}^7$;

R^6 ja R^7 ovat toisistaan riippumattomasti $-\text{H}$, $-\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$,
 10 $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{C}(\text{CH}_3)_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$, $-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}(\text{CH}_3)$, $-\text{CH}_2\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{CH}_3$, $-\text{syklo-C}_3\text{H}_5$, $-\text{syklo-C}_4\text{H}_7$, $-\text{syklo-C}_5\text{H}_9$, $-\text{syklo-C}_6\text{H}_{11}$, $-\text{CH}_2\text{-syklo-C}_3\text{H}_5$, $-\text{CH}_2\text{-syklo-C}_4\text{H}_7$, $-\text{CH}_2\text{-syklo-C}_5\text{H}_9$, $-\text{CH}_2\text{-syklo-C}_6\text{H}_{11}$, $-\text{Ph}$, $-\text{CH}_2\text{-Ph}$, $-\text{CH}_2\text{OCH}_3$, $-\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$,
 15 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHCH}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$,

tai $-\text{NR}^6\text{R}^7$ on $-\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$, 

 tai 

R^N on $-\text{H}$, $-\text{CH}_3$, $-\text{C}_2\text{H}_5$, $-\text{C}_3\text{H}_7$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{C}_4\text{H}_9$, $-\text{CH}_2\text{-CH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-C}_2\text{H}_5$, $-\text{C}(\text{CH}_3)_3$, $-\text{syklo-C}_3\text{H}_5$,
 20 $-\text{syklo-C}_4\text{H}_7$, $-\text{syklo-C}_5\text{H}_9$, $-\text{CH}_2\text{-syklo-C}_3\text{H}_5$, $-\text{CH}_2\text{F}$, $-\text{CHF}_2$, $-\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{Cl}$, $-\text{CH}_2\text{Br}$, $-\text{CH}_2\text{I}$, $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{F}$, $-\text{CH}_2\text{-CHF}_2$, $-\text{CH}_2\text{-CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{Cl}$, $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{Br}$, $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{I}$, $-\text{CH}_2\text{-CH}=\text{CH}_2$, $-\text{CH}_2\text{-C}\equiv\text{CH}$, $-\text{CHO}$, $-\text{COCH}_3$, $-\text{COC}_2\text{H}_5$, $-\text{COC}_3\text{H}_7$, $-\text{COCH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{COC}(\text{CH}_3)_3$, $-\text{COOCH}_3$, $-\text{COOC}_2\text{H}_5$, $-\text{COOC}_3\text{H}_7$, $-\text{COOCH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{COOC}(\text{CH}_3)_3$,
 25 COOCH_2Ph , $-\text{SO}_2\text{CH}_3$, $-\text{SO}_2\text{CF}_3$, $-\text{SO}_2\text{C}_2\text{H}_5$, $-\text{SO}_2\text{C}_3\text{H}_7$, $-\text{SO}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ tai $-\text{SO}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$;

$\text{R}^{\text{N}1}$ on $-\text{H}$, $-\text{CH}_3$ tai $-\text{CH}_2\text{CH}_3$;

ja $\text{R}^8\text{-R}^{14}$ tarkoittavat samaa kuin kaavassa (I) on määritelty;

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

35 5. Jonkin patenttivaatimuksista 1-4 mukainen yhdiste, jossa

L¹ on -CH₂- tai -CH₂CO-;

L² on sidos, -NR^{N1}-, -NR^{N1}CH₂- tai -NR^{N1}CH(CH₃)-

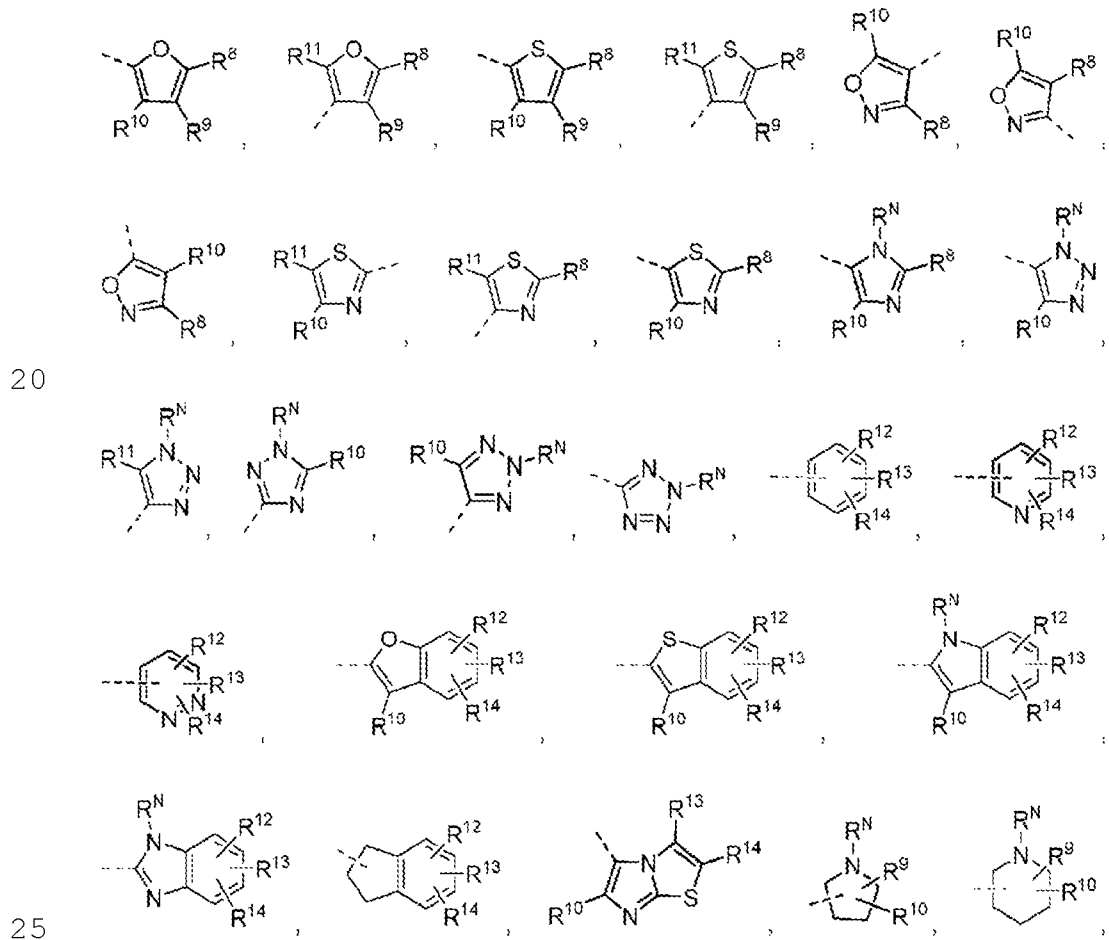
;

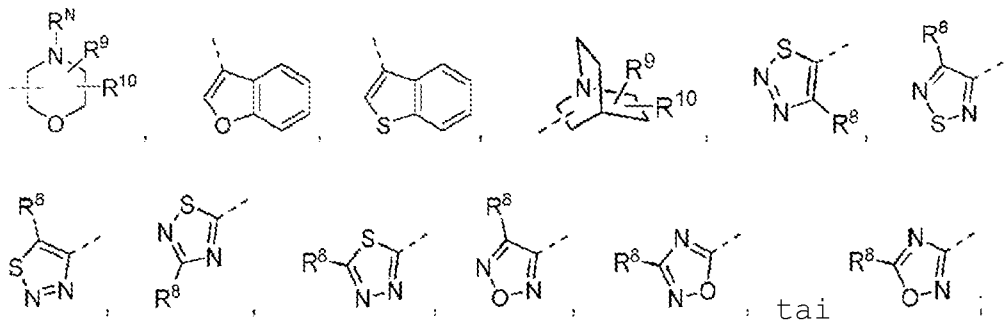
R³ on bisyklo[1.1.1]pentyyli,
 5 bisyklo[2.1.1]heksyyli, bisyklo[2.2.1]heptyyli,
 bisyklo[3.1.1]heptyyli, bisyklo[2.2.2]oktyyli, 4-ho-
 moisotwistyyli, adamantyyli tai diamantyyli, ja edellä
 mainitut tähteet sisältävät valinnaisesti yhden tai use-
 amman C=C kaksoissidoksen ja/tai ne on substituoitu yh-
 10 dellä tai useammalla R^a:sta, R^b:stä, R^c:stä, R^d:stä
 ja R^e:stä;

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

6. Jonkin patenttivaatimuksista 1-5 mukainen
 15 yhdiste, jossa

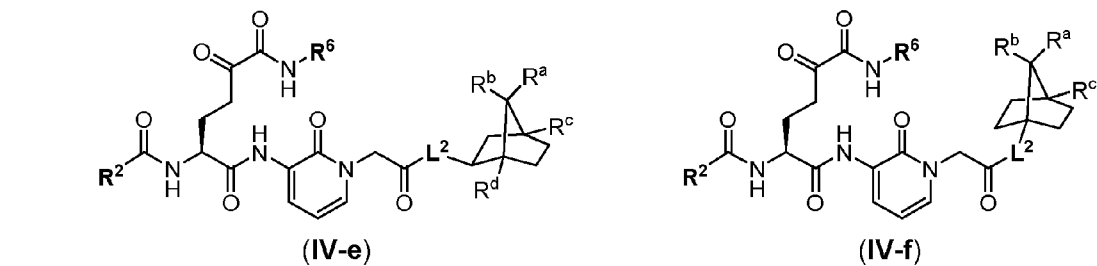
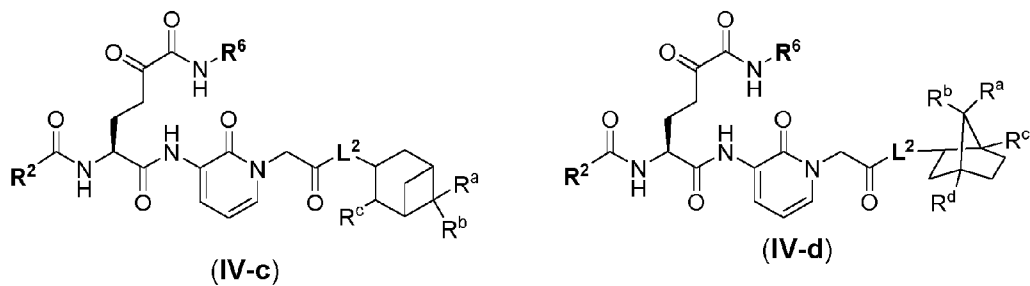
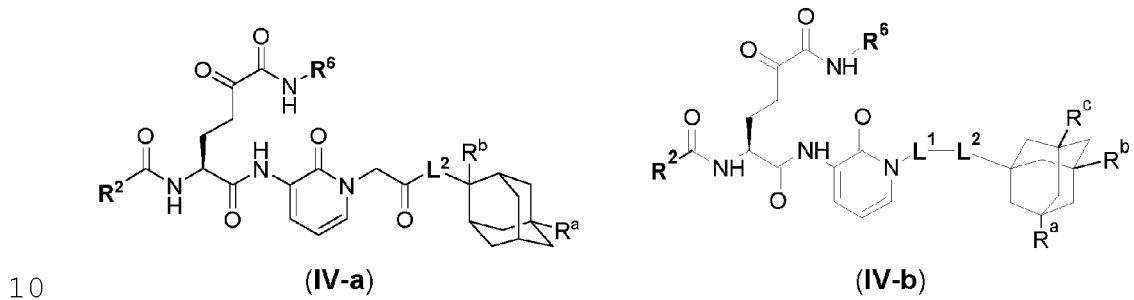
R² on



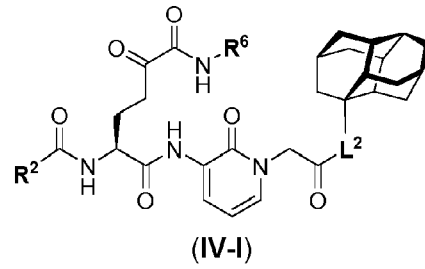
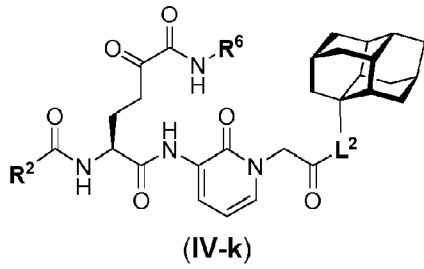
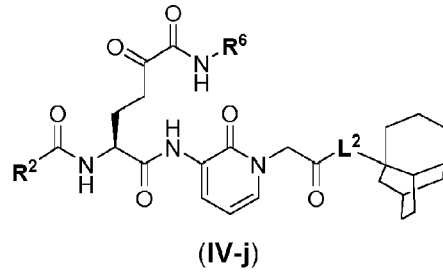
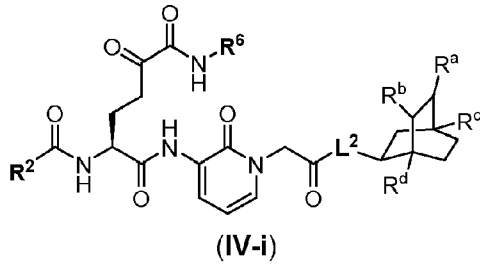
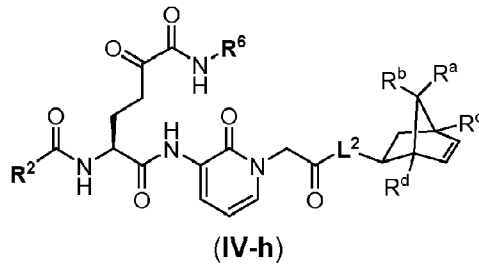
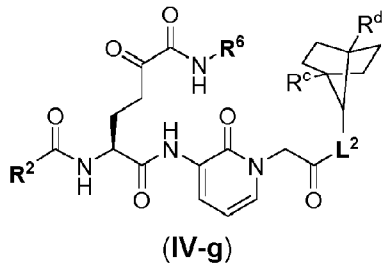


5 ja R^8 - R^{14} :llä ja R^N :llä on patenttivaatimuksessa 1 tai 2 määritellyt merkitykset.

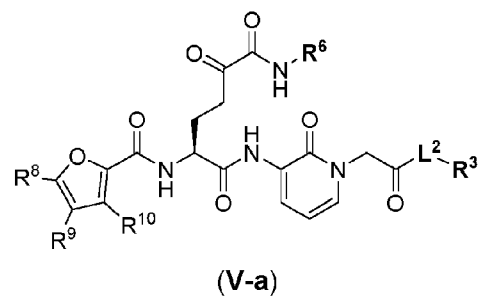
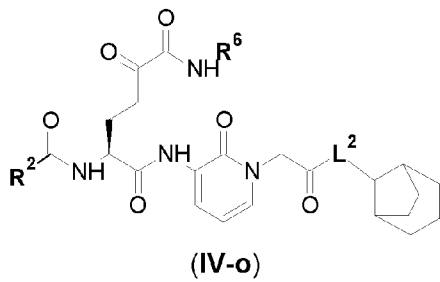
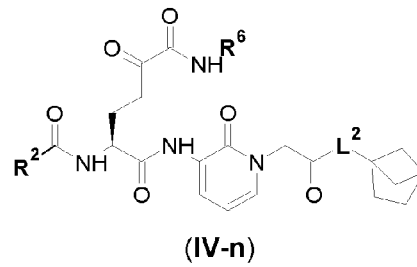
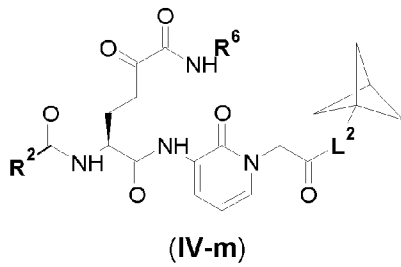
7. Jonkin patenttivaatimuksista 1-6 mukainen yhdiste, jossa yhdisteellä on jokin kaavoista (IV-a)-(IV-o) ja (V-a)-(V-d):



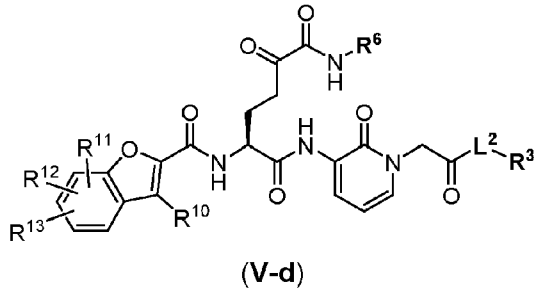
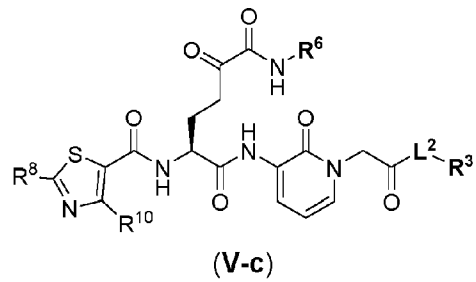
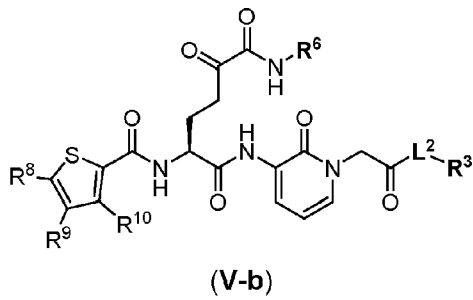
15



5



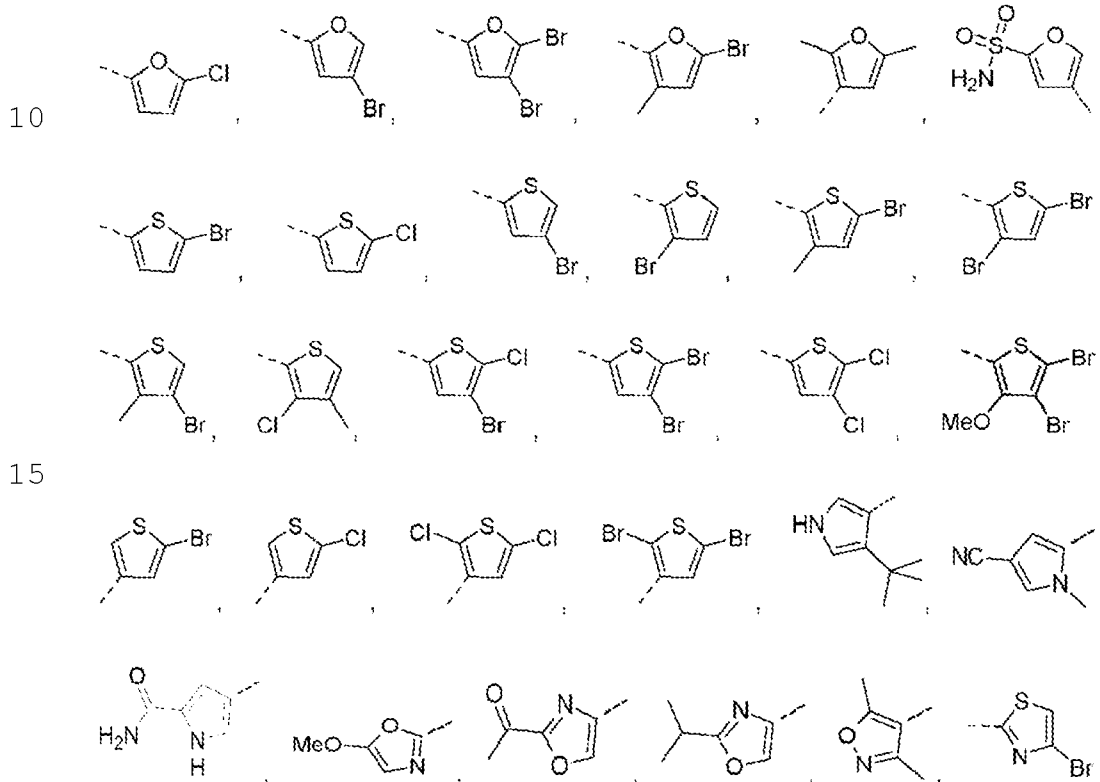
10

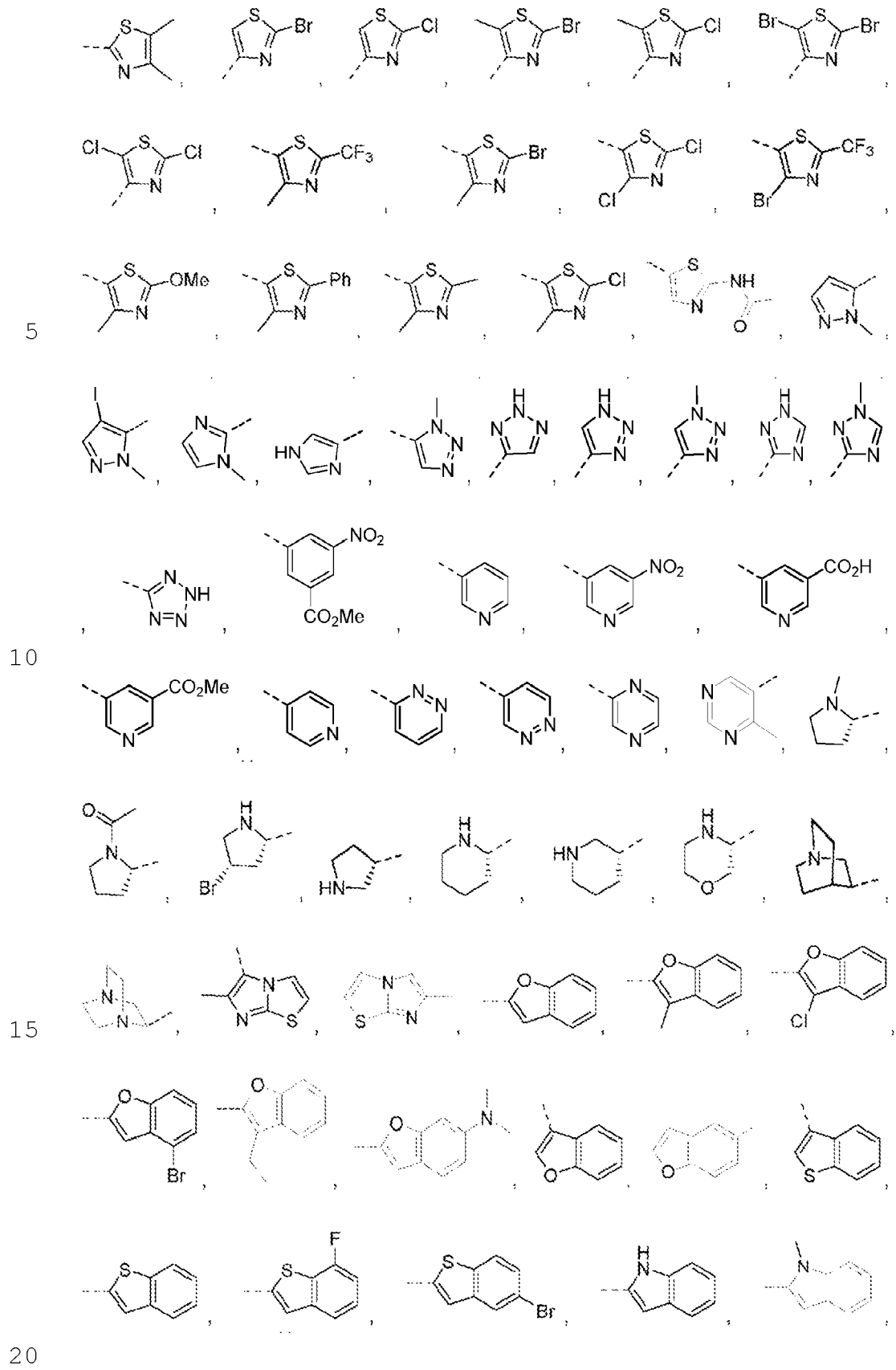


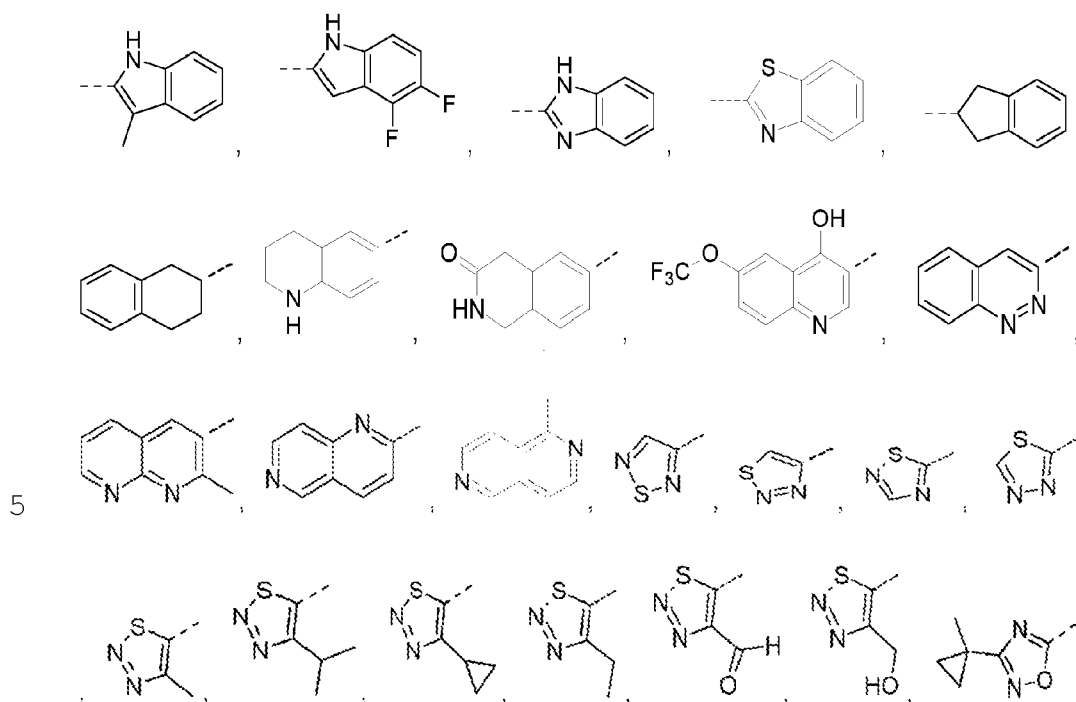
ja R^2 , R^3 , R^6 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^a , R^b ,
 5 R^c , R^d ja L^2 tarkoittavat samaa kuin patenttivaatimuk-
 sessa 1 on määritelty.

8. Jonkin patenttivaatimuksista 1-7 mukainen
 yhdiste, jossa

R^2 on







10

NC1=NC=NC=C1, tai NC1=NC=NC=C1, ja
 R^6 on $-H$, $-CH_3$, $-CH(CH_3)_2$, $-CH_2CH_2CH_3$, $-CH_2CH=CH_2$, $-CH_2CH_2CH_2CH_3$, $-CH_2CH(CH_3)_2$, $-C(CH_3)_3$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$, $-syklo-C_3H_5$, $-syklo-C_5H_9$, $-syklo-C_6H_{11}$ tai $-CH_2-syklo-C_3H_5$.

15

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

Yhdiste	Nimi
II-2:	(S)-2-(bentsofuraani-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-3:	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi

Yhdiste	Nimi
II-4:	(S)-2-(3-klooribentsofuraani-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-5:	(S)-2-(4-bromibentsofuraani-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-6:	(S)-2-(4-bromibentsofuraani-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-7:	(S)-2-(bentso[b]tiofeeni-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-8:	(S)-2-(5-bromibentso[b]tiofeeni-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-9:	(S)-2-(1H-indoli-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-10:	(S)-2-(4,5-difluori-1H-indoli-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-11:	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(3-metyyli-1H-indoli-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi

Yhdiste	Nimi
II-12:	(S)-2-(1H-bentso[d]imidatsoli-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-13:	(S)-2-(2,3-dihydro-1H-indeeni-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-14:	(S)--(2-bromi-4-metyylitiatsoli-5-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-15:	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(4-metyyli-2-(trifluorimetyyli)tiatsoli-5-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-16:	(S)-2-(4-bromi-2-(trifluorimetyyli)tiatsoli-5-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-17:	(S)-2-(2,4-diklooritiatsoli-5-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-18:	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-2-(2-metoksi-4-metyylitiatsoli-5-karboksamido)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-19:	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(4-metyyli-2-fenyylitiatsoli-5-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi

Yhdiste	Nimi
II-20:	(S)-2-(2,4-dimetyylitiatsoli-5-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-21:	(S)-2-(5-bromi-3-metyylitiofeeni-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-22:	(S)-2-(3,5-dibromitiofeeni-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-23:	(S)-2-(5-bromitiofeeni-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-24:	(S)-2-(5-klooritiofeeni-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-25:	(S)-2-(5-bromi-3-metyylifuraani-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-26:	(S)-2-(5-kloorifuraani-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-27:	(S)-2-(5-klooritiofeeni-3-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi

Yhdiste	Nimi
II-28:	(S)-2-(2,5-diklooritiofeeni-3-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-29:	(S)-2-(2,5-dibromitiofeeni-3-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-30:	(S)-2-(5-bromitiofeeni-3-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-31:	(S)-2-(2-kloori-5-metyylitiatsoli-4-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-32:	(S)-2-(2,5-diklooritiatsoli-4-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-33:	(S)-2-(2,5-dibromitiatsoli-4-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-34:	(S)-2-(2-bromi-5-metyylitiatsoli-4-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-35:	(S)-2-(2-bromitiatsoli-4-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi

Yhdiste	Nimi
II-36:	(S)-2-(2-klooritiatsoli-4-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-37:	(S)-2-(2,5-dimetyylifuraani-3-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-38:	(S)-2-(4,5-dimetyylitiatsoli-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-39:	(S)-2-(4-bromitiatsoli-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-40:	(S)-2-(4-bromitiofeeni-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-41:	(S)-2-(4-bromi-3-metyylitiofeeni-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-42:	(S)-2-(3-bromitiofeeni-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-43:	(S)-2-(3-kloori-4-metyylitiofeeni-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi

Yhdiste	Nimi
II-44:	(S)-2-(4-bromi-5-klooritiofeeni-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-45:	(S)-2-(4,5-dibromitiofeeni-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-46:	(S)-2-(4,5-dibromi-3-metoksitiofeeni-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-47:	(S)-2-(4-bromifuraani-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-48:	(S)-2-(4,5-dibromifuraani-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-49:	(S)-2-(4,5-diklooritiofeeni-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-50:	(S)-2-((S)-1-asetyylipyrrolidiini-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-51:	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(1-metyyli-1H-1,2,3-triatsoli-5-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi

Yhdiste	Nimi
II-52:	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-okso-2-(2H-tetratsoli-5-karboksamido)heksaanidiamidi
II-53:	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-okso-2-(pyratsiini-2-karboksamido)heksaanidiamidi
II-54:	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-((S)-1-metyylipyrrolidiini-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-55:	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-okso-2-((S)-pyrrolidiini-3-karboksamido)heksaanidiamidi
II-56:	(S)-2-((2S,4S)-4-bromipyrrolidiini-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-58:	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-okso-2-((S)-piperidiini-2-karboksamido)heksaanidiamidi
II-59:	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-okso-2-((R)-piperidiini-3-karboksamido)heksaanidiamidi
II-60:	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-((R)-morfoliini-3-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi

Yhdiste	Nimi
II-61:	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-okso-2-(kinuklidiini-3-karboksamido)heksaanidiamidi
II-62:	(S)-metyyli-3-(1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(metyyliamino)-1,5,6-trioksoheksan-2-yylikarbamoyyli)-5-nitrobentsoatti
II-63:	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(5-nitronikotiiniamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-64:	(S)-5-(1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(metyyliamino)-1,5,6-trioksoheksan-2-yylikarbamoyyli)nikotiinihappo
II-65:	(S)-metyyli-5-(1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(metyyliamino)-1,5,6-trioksoheksan-2-yylikarbamoyyli)nikotinaatti
II-66:	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(6-metyyli-imidatso[2,1-b]tiatsoli-5-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-67:	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyli(metyyli)amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(3-metyyllibentsofuraani-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-68:	(S)-N1-(1-(2-(5-hydroksiadamantaani-2-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(3-metyyllibentsofuraani-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi

Yhdiste	Nimi
II-69:	(S)-N1-(1-(2-(5-fluoriadamantaani-2-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(3-metyyllibentsofuraani-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-70:	(S)-N1-(1-(2-(5-klooriadamantaani-2-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(3-metyyllibentsofuraani-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-71:	(S)-N1-(1-(2-(5-bromiadamantaani-2-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(3-metyyllibentsofuraani-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-72:	(S)-N1-(1-(2-(5-metyyliadamantaani-2-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(3-metyyllibentsofuraani-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-73:	(S)-N1-(1-(2-(2-karbonitriiliadamantaani-2-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(3-metyyllibentsofuraani-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-74:	(S)-N1-(1-(2-(2-metyyliadamantaani-2-karboksylaatti-2-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(3-metyyllibentsofuraani-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-87:	(S)-N1-(1-(2-(1-adamantyyylimetyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(3-metyyllibentsofuraani-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-88:	(S)-N1-(1-(2-(1-(1-adamantyyyli)etaaniamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(3-metyyllibentsofuraani-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi

Yhdiste	Nimi
II-90:	(S)-N1-(1-(2-((1R,2S,4S)-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-92:	(S)-N1-metyyli-5-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-2-okso-N6-(2-okso-1-(2-okso-2-((1S,2S,4R)-1,7,7-trimetyylibisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)etyyli)-1,2-dihydropyridin-3-yyli)heksaanidiamidi
II-94:	(S)-N1-(1-(2-((1R,2R,4S)-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-95:	(S)-N1-(1-(2-(bisyklo[2.2.1]heptan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-96:	(S)-N1-(1-(2-(bisyklo[2.2.1]heptan-7-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-97:	(S)-N1-(1-(2-(bisyklo[2.2.1]hept-5-en-2-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-98:	(2S)-N1-(1-(2-(bisyklo[2.2.2]oktan-2-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-99:	(S)-N1-metyyli-5-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-2-okso-N6-(2-okso-1-(2-okso-2-((1R,2R,4R)-1,7,7-

Yhdiste	Nimi
	trimetyylibisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino) etyyli)-1,2-dihydropyridin-3-yyli) heksaanidiamidi
II-100:	(S)-N1-metyyli-5-(3-metyyllibentsofuraani-2-karboksamido)-2-okso-N6-(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-yyli) heksaanidiamidi
II-101:	(S)-N1-metyyli-5-(3-metyyllibentsofuraani-2-karboksamido)-2-okso-N6-(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-yyli) heksaanidiamidi
II-103:	(S)-N1-(1-(2-(4-homoisotwistaani-3-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(3-metyyllibentsofuraani-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-104:	(S)-N1-(1-(2-(diamantaani-1-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(3-metyyllibentsofuraani-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-105:	(S)-N1-(1-(2-(diamantaani-4-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(3-metyyllibentsofuraani-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-107:	(S)-N1-(1-(1-adamantyylimetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(3-metyyllibentsofuraani-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-108:	(2S)-N1-(1-((3-hydroksi-1-adamantyyli)metyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(3-metyyllibentsofuraani-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi

Yhdiste	Nimi
II-109:	(2S)-N1-(1-((3-bromi-1-adamantyyli)metyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(3-metyyllibentsofuraani-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-110:	(S)-N1-(1-(2-adamantyylimetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(3-metyyllibentsofuraani-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-111:	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(nikotiiniamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-112:	(S)-2-(isonikotiiniamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-113:	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-okso-2-(pyridatsiini-4-karboksamido)heksaanidiamidi
II-114:	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-okso-2-(pyridatsiini-3-karboksamido)heksaanidiamidi
II-115:	(S)-N1-sykloproppyli-N6-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-5-(3-metyyllibentsofuraani-2-karboksamido)-2-oksoheksaanidiamidi
II-116:	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-2-(3-metyyllibentsofuraani-2-karboksamido)-5-okso-N6-pentyyliheksaanidiamidi

Yhdiste	Nimi
II-117:	(S)-N1-allyyli-N6-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-5-(3-metyyllibentsofuraani-2-karboksamido)-2-oksoheksaanidiamidi
II-118:	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-2-(3-metyyllibentsofuraani-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-119:	(S)-N1-allyyli-5-(bentsofuraani-2-karboksamido)-N6-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-2-oksoheksaanidiamidi
II-120:	(S)-2-(bentsofuraani-2-karboksamido)-N6-isopropyyli-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-5-oksoheksaanidiamidi
II-121:	(S)-2-(bentsofuraani-2-karboksamido)-N6-syklopropyyli-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-5-oksoheksaanidiamidi
II-122:	(S)-2-(bentsofuraani-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-5-okso-N6-fenyyliheksaanidiamidi
II-123:	(S)-2-(bentsofuraani-2-karboksamido)-N6-bentsyyli-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-5-oksoheksaanidiamidi
II-124:	(S)-2-(bentsofuraani-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-5-oksoheksaanidiamidi
II-125:	(S)-2-(2,5-diklooritiofeeni-3-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-

Yhdiste	Nimi
	okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-5-oksoheksaanidiamidi
II-126:	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-2-(4-metyyli-2-(trifluorimetyyli)tiatsoli-5-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-127:	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-2-(1-metyyli-1H-1,2,3-triatsoli-5-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-128:	(2S)-N1-(1-(2-((1R,2R,4S)-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-2-(2,5-diklooritiofeeni-3-karboksamido)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-129:	(2S)-N1-(1-(2-((1R,2R,4S)-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(4-metyyli-2-(trifluorimetyyli)tiatsoli-5-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-130:	(2S)-N1-(1-(2-((1R,2R,4S)-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(1-metyyli-1H-1,2,3-triatsoli-5-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-131:	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-okso-2-(2H-1,2,3-triatsoli-4-karboksamido)heksaanidiamidi
II-132:	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-okso-2-(1H-1,2,3-triatsoli-4-karboksamido)heksaanidiamidi

Yhdiste	Nimi
II-133:	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(1-metyyli-1H-1,2,3-triatsoli-4-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-134:	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-okso-2-(1H-1,2,4-triatsoli-3-karboksamido)heksaanidiamidi
II-135:	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(1-metyyli-1H-1,2,4-triatsoli-3-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-136:	(S)-2-(bentsofuraani-3-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-137:	(S)-2-(bentso[b]tiofeeni-3-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-138	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(1-metyyli-1H-pyratsoli-3-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-139	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(1-metyyli-1H-pyratsoli-4-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-140	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(1-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi

Yhdiste	Nimi
II-141	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(4-metyyli-1,2,3-tiadiatsoli-5-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-142	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-okso-2-(1,2,5-tiadiatsoli-3-karboksamido)heksaanidiamidi
II-143	(S)-2-(4-jodi-1-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-144	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-2-(1-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-145	(S)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-2-(4-metyyli-1,2,3-tiadiatsoli-5-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-146	(S)-2-(bentsofuraani-2-karboksamido)-N1-(1-(2-((1R,2R,4S)-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-5-oksoheksaanidiamidi
II-147	(S)-N1-(1-(2-((1R,2R,4S)-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-2-(3-metyylibentsofuraani-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-148	(S)-2-(bentsofuraani-2-karboksamido)-N1-(1-(2-((1S,2R,4R)-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-5-oksoheksaanidiamidi

Yhdiste	Nimi
II-149	(S)-N1-(1-(2-((1S,2R,4R)-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-2-(3-metyyllibentsofuraani-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-150	(S)-2-(bentsofuraani-2-karboksamido)-5-okso-N1-(2-okso-1-(2-okso-2-((1R,2S,4R)-1,7,7-trimetyyllibisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)etyyli)-1,2-dihydropyridin-3-yyli)heksaanidiamidi
II-151	(S)-2-(3-metyyllibentsofuraani-2-karboksamido)-5-okso-N1-(2-okso-1-(2-okso-2-((1R,2S,4R)-1,7,7-trimetyyllibisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)etyyli)-1,2-dihydropyridin-3-yyli)heksaanidiamidi
II-152	(S)-N1-(1-(2-((1R,2R,4S)-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(4-metyyli-1,2,3-tiadiatsoli-5-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-153	(S)-N1-(1-(2-((1R,2R,4S)-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(1-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-154	(S)-N1-(1-(2-((1S,2R,4R)-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(4-metyyli-2-(trifluorimetyyli)tiatsoli-5-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-155	(S)-N1-(1-(2-((1S,2R,4R)-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-2-(2,5-diklooritiofeeni-3-karboksamido)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-156	(S)-N1-(1-(2-((1S,2R,4R)-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-

Yhdiste	Nimi
	dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(4-metyyli-1,2,3-tiadiatsoli-5-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-157	(S)-N1-(1-(2-((1S,2R,4R)-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(1-metyyli-1H-1,2,3-triatsoli-5-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-158	(S)-N1-(1-(2-((1S,2R,4R)-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(1-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-159	(S)-N1-metyyli-5-(4-metyyli-2-(trifluorimetyyli)tiatsoli-5-karboksamido)-2-okso-N6-(2-okso-1-(2-okso-2-((1R,2S,4R)-1,7,7-trimetyyli-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)etyyli)-1,2-dihydropyridin-3-yyli)heksaanidiamidi
II-160	(S)-2-(2,5-diklooritiofeeni-3-karboksamido)-N6-metyyli-5-okso-N1-(2-okso-1-(2-okso-2-((1R,2S,4R)-1,7,7-trimetyyllibisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)etyyli)-1,2-dihydropyridin-3-yyli)heksaanidiamidi
II-161	(S)-N1-metyyli-5-(4-metyyli-1,2,3-tiadiatsoli-5-karboksamido)-2-okso-N6-(2-okso-1-(2-okso-2-((1R,2S,4R)-1,7,7-trimetyyllibisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)etyyli)-1,2-dihydropyridin-3-yyli)heksaanidiamidi
II-162	(S)-N1-metyyli-5-(1-metyyli-1H-1,2,3-triatsoli-5-karboksamido)-2-okso-N6-(2-okso-1-(2-okso-2-((1R,2S,4R)-1,7,7-trimetyyli-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)etyyli)-1,2-dihydropyridin-3-yyli)heksaanidiamidi

Yhdiste	Nimi
II-163	(S)-N1-metyyli-5-(1-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-2-okso-N6-(2-okso-1-(2-okso-2-((1R,2S,4R)-1,7,7-trimetyyllibisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)etyyli)-1,2-dihydropyridin-3-yyli)heksaanidiamidi
II-164	(2S)-2-(4-tert-butyli-1H-pyrroli-3-karboksamido)-N6-metyyli-N1-(1-(2-(1-adamantyyliamino)etyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-5-oksoheksaanidiamidi
II-165	(2S)-2-(4-syano-1-metyyli-1H-pyrroli-2-karboksamido)-N6-metyyli-N1-(1-(3-(1-adamantyyliamino)propyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-5-oksoheksaanidiamidi
II-166	(S)-N1-(1-(3-(2-adamantyyliamino)-3-oksopropyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-2-(5-metoksioksatsoli-2-karboksamido)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-167	(S)-N1-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(3-metyyllibentsofuraani-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-168	(S)-2-(2-asetyylioksatsoli-4-karboksamido)-N1-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-169	(S)-N1-(1-(2-(bisyklo[2.1.1]heksan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(3-metyyllibentsofuraani-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-170	(S)-N1-(1-(2-(bisyklo[2.1.1]heksan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-2-(2-isopropyylioksatsoli-5-karboksamido)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi

Yhdiste	Nimi
II-171	(2S)-2-(bentsofuraani-2-karboksamido)-N1-(1-(2-(bisyklo[3.2.1]oktan-8-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-172	(2S)-N1-(1-(2-(bisyklo[3.2.1]oktan-8-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-2-(3,5-dimetyyli-isoksatsoli-4-karboksamido)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-173	(S)-N1-(1-(2-(5-karboksi-2-aminoadamantaani)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(4-metyylipyrimidiini-5-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-174	(2S)-N1-(1-(2-(4-aminoadamantaani-N,N-dimetyyli-1-karboksamidi)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-okso-2-(1,2,3,4-tetrahydronaftaleeni-2-karboksamido)heksaanidiamidi
II-175	(S)-2-((S)-1,4-diatsabisyklo[2.2.2]oktaani-2-karboksamido)-N6-tert-butyli-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-5-oksoheksaanidiamidi
II-176	(S)-N1-tert-butyli-5-(1H-indoli-3-karboksamido)-N6-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-2-oksoheksaanidiamidi
II-177	(S)-N1-tert-butyli-N6-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-5-(6-metyyli-imidatso[2,1-b]tiatsoli-3-karboksamido)-2-oksoheksaanidiamidi
II-178	(S)-2-(bentso[d]tiatsoli-2-karboksamido)-N1-(1-(2-((1S,2R,4R)-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-syklopentyyli-5-oksoheksaanidiamidi

Yhdiste	Nimi
II-179	(S)-N1-(1-(2-((1S,2R,4R)-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-syklopentyyli-2-(imidatso[2,1-b]tiatsoli-6-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-180	(S)-N1-(1-(2-((1S,2R,4R)-bisyklo[2.2.1]heptan-2-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-syklopentyyli-2-(4-hydroksi-6-(trifluorimetoksi)kinoliini-3-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-181	(S)-N1-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-2-(kinnoliini-3-karboksamido)-N6-sykloheksyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-182	(S)-N1-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-sykloheksyyli-2-(3-etyylibentsofuraani-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-183	(S)-N1-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-sykloheksyyli-2-(1-etyyli-1H-indoli-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-184	(S)-N1-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-sykloheksyyli-2-(2-metyyli-1,8-naftyridiini-3-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-185	(S)-N1-(1-(2-(bisyklo[2.1.1]heksan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-okso-2-(1,2,3,4-tetrahydrokinoliini-6-karboksamido)heksaanidiamidi

Yhdiste	Nimi
II-186	(S)-N1-(1-(2-(2-karboksi-2-amino-5-(trifluorimetyyli)adamantaani)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-okso-2-(3-okso-1,2,3,4-tetrahydroisokinoliini-6-karboksamido)heksaanidiamidi
II-187	(S)-N1-(1-(2-(5-etyyliadamantaani-2-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(1,6-naftyridiini-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-188	(S)-N1-(1-(2-(bisyklo[2.1.1]heksan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(2,6-naftyridiini-1-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-189	(S)-2-(4-amino-1,2,5-oksadiatsoli-3-karboksamido)-N1-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-190	(S)-N1-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-2-(6-(dimetyyliamino)bentsofuraani-2-karboksamido)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-191	(S)-2-(2-asetamidotiatsoli-5-karboksamido)-N1-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-192	(S)-N4-(1-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyliamino)-6-(metyyliamino)-1,5,6-trioksoheksan-2-yyli)-1H-pyrroli-2,4-dikarboksamidi
II-193	(S)-N1-(1-(2-(1-asetyyliamino-4-aminoadamantaani)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-okso-2-(5-sulfamoyylifuraani-3-karboksamido)heksaanidiamidi

Yhdiste	Nimi
II-194	(S)-2-(bentsofuraani-5-karboksamido)-N1-(1-(2-(1-asetyyliamino-4-aminoadamantaani)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-195	(S)-2-(bentsofuraani-6-karboksamido)-N1-(1-(2-(4-aminoadamantaani-1-karboksamidi)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-196	(S)-N1-(1-(2-(4-aminoadamantaani-1-karboksamidi)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(3-(1-metyylisyklopropyyli)-1,2,4-oksadiatsoli-5-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-197	(S)-N1-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(5-metyyli-1,2,4-oksadiatsoli-3-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-198	(S)-N1-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-okso-2-(1,2,3-tiadiatsoli-4-karboksamido)heksaanidiamidi
II-199	(S)-N1-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-okso-2-(1,2,4-tiadiatsoli-5-karboksamido)heksaanidiamidi
II-200	(S)-N1-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-okso-2-(1,3,4-tiadiatsoli-2-karboksamido)heksaanidiamidi
II-201	(S)-N1-(1-(2-(bisyklo[1.1.1]pentan-1-yyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-2-(4-syklopropyyli-1,2,3-

Yhdiste	Nimi
	tiadiatsoli-5-karboksamido)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-202	(S)-2-(4-syklopropyyli-1,2,3-tiadiatsoli-5-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-203	(S)-2-(4-isopropyyli-1,2,3-tiadiatsoli-5-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-204	(S)-2-(4-etyyli-1,2,3-tiadiatsoli-5-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-205	(S)-2-(4-formyyli-1,2,3-tiadiatsoli-5-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-206	(S)-2-(4-(hydroksimetyyli)-1,2,3-tiadiatsoli-5-karboksamido)-N1-(1-(2-(2-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-207	(S)-N1-(1-(2-(1-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(1-metyyli-1H-imidatsoli-5-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-208	(S)-N1-(1-(2-(((1S,2R,5S)-6,6-dimetyyli-bisyklo[3.1.1]heptan-2-yyli)metyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(1-metyyli-1H-imidatsoli-2-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-209	(S)-N1-(1-(2-(((1R,2R,5R)-6,6-dimetyyli-bisyklo[3.1.1]heptan-2-yyli)metyyliamino)-2-

Yhdiste	Nimi
	oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-2-(1H-imidatsoli-4-karboksamido)-N6-metyyli-5-oksoheksaanidiamidi
II-210	(S)-N1-(1-(2-(3,5-dimetyyliadamantaani-1-amino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(1-metyyli-1H-imidatsoli-5-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi
II-211	(S)-N1-(1-(2-(3,5,7-trimetyyli-1-adamantyyliamino)-2-oksoetyyli)-2-okso-1,2-dihydropyridin-3-yyli)-N6-metyyli-2-(1-metyyli-1H-imidatsoli-5-karboksamido)-5-oksoheksaanidiamidi

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 ihohäiriöiden hoidossa tai ennaltaehkäisyssä.

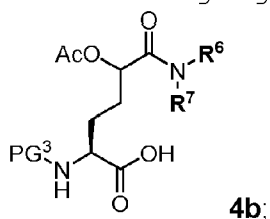
13. Yhdiste tai farmaseuttinen koostumus käytettäväksi patenttivaatimuksen 12 mukaisesti, jossa autoimmuuni- ja tulehdussairaudet käsittävät multippeliskleroosin, keliakian, Duhring-Brocqin taudin (dermatitis herpetiformis), gluteeniataksian, gluteeni-neuropatian, diabeteksen, nivelreuman, Gravesin taudin, tulehdussellisen 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, makularappeuman tai uveiitin; ja jossa ihohäiriöt käsittävät aknen, psoriaasin, arpeutumisen ja ihon ikääntymisen.

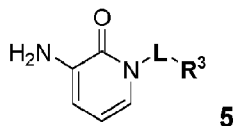
14. Yhdiste tai farmaseuttinen koostumus käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksista 12 ja 13 mukaisesti keliakian hoidossa tai ennaltaehkäisyssä.

15. Menetelmä patenttivaatimuksen 1 tai 4 mukaisen kaavan (Ib) mukaisen yhdisteen tuottamiseksi, käsittäen:

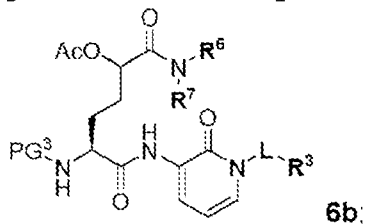
Vaihe 1B: järjestetään yhdiste 4b



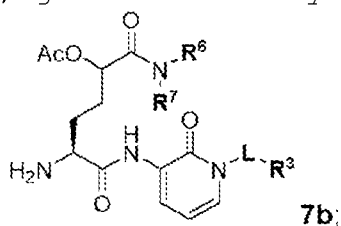
Vaihe 2B: suoritetaan yhdisteen 4b kytkentäreaktio yhdisteen 5 kanssa



jotta saadaan yhdiste 6b

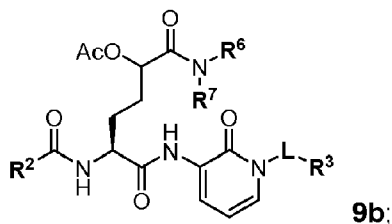


Vaihe 3B: poistetaan suojaus aminosuojaryhmästä PG³, jotta saadaan yhdiste 7b



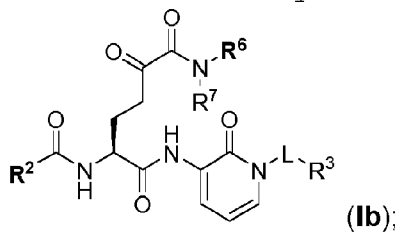
5

Vaihe 4B: suoritetaan yhdisteen 7b kytkentäreaktio karboksyylihapon (R²-CO₂H 8) kanssa, jotta saadaan yhdiste 9b



10

Vaihe 5B: suoritetaan yhdisteen 9b hapetusreaktio, jotta tuotetaan yhdiste, jolla on kaava (Ib)



15 jossa L, R², R³, R⁶ ja R⁷ tarkoittavat samaa kuin patenttivaatimuksessa 1 on määritelty, ja PG³ on aminosuojaryhmä.