



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20191364 T1



HR P20191364 T1

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

(51) MKP:

C07D 413/12 (2006.01)
C07D 417/12 (2006.01)
C07D 513/04 (2006.01)
A61P 11/06 (2006.01)

C07D 498/04 (2006.01)
A61K 31/505 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 01.11.2019.

(21) Broj predmeta: P20191364T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 29.07.2019.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2015055228
Datum podnošenja međunarodne prijave: 12.03.2015.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 15711451.3
Datum podnošenja europske prijave patenta: 12.03.2015.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2015140051
Datum međunarodne objave: 24.09.2015.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3119772 A1
Datum objave europske prijave patenta: 25.01.2017.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3119772 B1
Datum objave europskog patenta: 22.05.2019.

(31) Broj prve prijave: 201461955487 P (32) Datum podnošenja prve prijave: 19.03.2014. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelj patenta:

**Boehringer Ingelheim International GmbH, Binger Strasse 173, 55216
Ingelheim am Rhein, DE**

(72) Izumitelji:

**Georg Dahmann, Boehringer Ingelheim GmbH, Corporate Patents,
Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, DE**
**Matthias Hoffmann, Boehringer Ingelheim GmbH, Corporate Patents,
Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, DE**
**Jasna Klicic, Boehringer Ingelheim GmbH, Corporate Patents, Binger
Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, DE**
**David James Lamb, Boehringer Ingelheim GmbH, Corporate Patents,
Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, DE**
**Clive McCarthy, Enterprise Therapeutics, Sussex Innovation Centre,
University of Sussex, Science Park Square, Falmer, Brighton BN1 9SB,
GB**
**Spencer Napier, Evotec (UK) Ltd., 114 Milton Park, Milton, Abingdon
Oxfordshire OX14 4SA, GB**
**Karen Parrish, Evotec (UK) Ltd., 114 Milton Park, Milton, Abingdon
Oxfordshire OX14 4SA, GB**
**John Scott, Evotec (UK) Ltd., 114 Milton Park, Milton, Abingdon
Oxfordshire OX14 4SA, GB**
**Jennifer L. Swantek Fitzgerald, c/o VP IP Legal, Boehringer Ingelheim
USA Corp., 900 Ridgebury Rd., P.O. Box 368, Ridgefield, Connecticut
06877-0368, US**
**Edward Walker, Evotec (UK) Ltd., 114 Milton Park, Milton, Abingdon
Oxfordshire OX14 4SA, GB**
CPZ - CENTAR ZA PATENTE d.o.o., 10000 Zagreb, HR

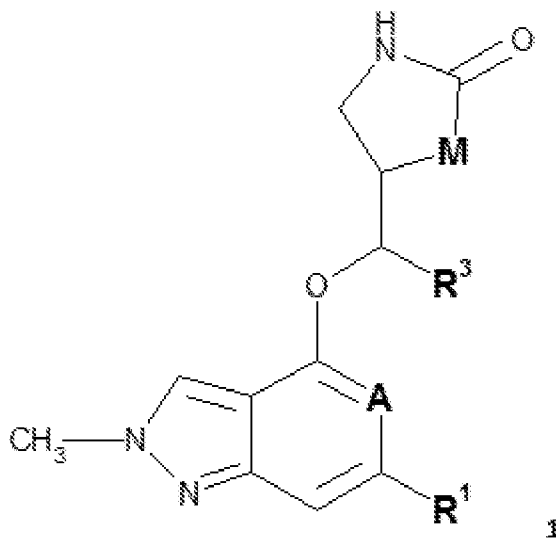
(74) Zastupnik:

(54) Naziv izuma: SIK-INHIBITORI TIPA HETEROARILA

HR P20191364 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

1. Spoj, **naznačen time, da** je predstavljen formulom **1**



u kojoj

A je odabran iz skupine koja se sastoji od N i CH
i u kojoj

M je odabran iz skupine koja se sastoji od -CH₂-, -O-, -NH- i -N(C₁₋₄-alkila)-;

R³ je odabran iz skupine koja se sastoji od metila i etila;

i gdje

R¹ je odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih:

C₆₋₁₀-aril, **Het** i **Hetaril**;

koji je opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta **Z**,

pri čemu je svaki **Z** supstituent odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih:

-OH, okso, -CN, halogen, -C₁₋₆-alkil, -O-C₁₋₆-alkil, -C₁₋₆-haloalkil, tročlani do sedam-člani cikloalkil, **Het**, **Hetaril**, -CO-N(CH₃)₂, -CO-NHCH₃, -CO-NH₂, -(C₁₋₃-alkilen)-O-(C₁₋₃-alkil), -O-**Het**,

koji je opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta **X**,

pri čemu je svaki **X** odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih: halogen, -OH, okso,

-C₁₋₄-alkil, -O-C₁₋₄-alkil, -C₁₋₄-haloalkil, -O-(C₁₋₄-alkilen)-**Het**, **Het**, **Hetaril**, -NH₂, -NH(CH₃), -N(CH₃)₂,

pri čemu je supstituent **X** opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta iz skupine odabrane od okso, -OH, halogena i C₁₋₃-alkila,

i gdje

Het je odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih:

a pet-člani do šest-člani monociklički heterocikl s 1, 2, 3 ili 4 heteroatoma od kojih je svaki neovisno od drugih odabran od N, S i O,

i devet-člani do jedanaest-člani biciklički heterocikl s 1, 2, 3 ili 4 heteroatoma od kojih je svaki neovisno od drugih odabran od N, S i O;

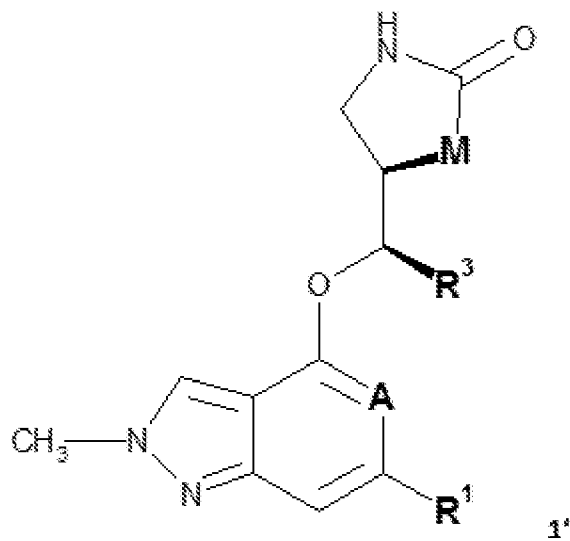
Hetaril je odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih:

pet-člani do šest-člani monociklički heteroaromat s 1, 2, 3 ili 4 heteroatoma od kojih je svaki neovisno od drugih odabran od N, S i O;

i devet-člani do jedanaest-člani biciklički heteroaromat s 1, 2, 3 ili 4 heteroatoma od kojih je svaki neovisno od drugih odabran od N, S i O;

i farmaceutski prihvatljive soli od gore spomenutih spojeva.

2. Spoj, **naznačen time, da** je predstavljen formulom **1'**



gdje su **A**, **M**, **Het**, **Hetaril**, **R¹** i **R³** definirani u skladu sa zahtjevom 1,
i farmaceutski prihvatljive soli od gore spomenutih spojeva.

3. Spoj formule **1** u skladu s patentnim zahtjevom 1, ili formule **1'** prema patentnom zahtjevu 2, **naznačen time, da**

M je -CH₂-

i gdje

R³ je metil,

i gdje

R¹ je odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih:

fenil, **Het** i **Hetaril**;

koji je opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta **Z**,

pri čemu je svaki **Z** supstituent odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih:

-OH, okso, -CN, halogen, -C₁₋₆-alkil, -O-C₁₋₆-alkil, -C₁₋₆-haloalkil, tročlani do sedam-člani cikloalkil, **Het**, **Hetaril**,

-CO-N(CH₃)₂, -CO-NHCH₃, -CO-NH₂, -(C₁₋₃-alkilen)-O-(C₁₋₃-alkil),

-O-**Het**,

koji je opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta **X**,

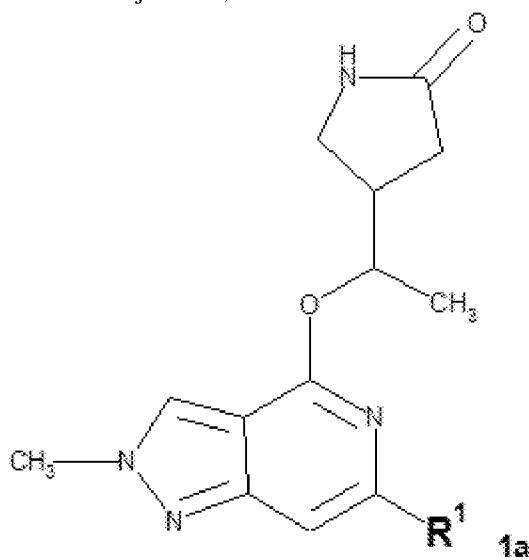
pri čemu je svaki **X** odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih: halogen, okso, -C₁₋₄-alkil, -O-C₁₋₄-alkil, -C₁₋₄-haloalkil, -O-(C₁₋₄-alkilen)-**Het**, **Het**, **Hetaril**, -NH₂,

pri čemu je supstituent **X** opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta iz skupine odabrane od

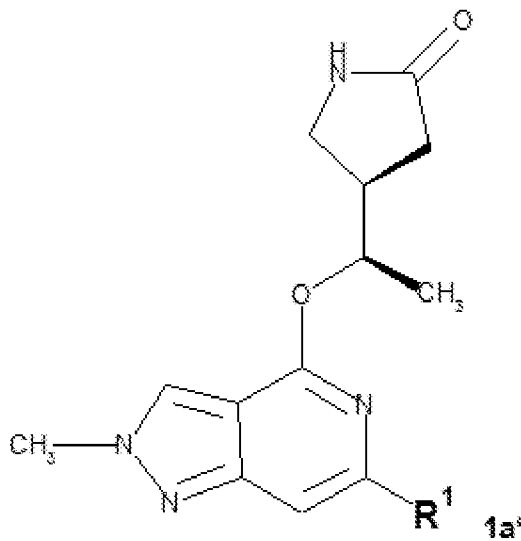
okso, metila, etila, n-propila, izopropila, n-butila, izobutila i tert-butila,

i farmaceutski prihvatljive soli od gore spomenutih spojeva.

4. Spoj formule **1a** u skladu s patentnim zahtjevom 1,



ili formule **1a'** u skladu s patentnim zahtjevom 2,



naznačen time, da

R¹ je odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih:

fenil, **Het** i **Hetaril**;

koji je opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta **Z**,

pri čemu je svaki **Z** supstituent odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih:

-OH, okso, -CN, halogen, -C₁₋₆-alkil, -O-C₁₋₆-alkil, -C₁₋₆-haloalkil, tročlani do sedam-člani cikloalkil, **Het**, **Hetaril**, -CO-N(CH₃)₂, -CO-NHCH₃, -CO-NH₂, -(C₁₋₃-alkilen)-O-(C₁₋₃-alkil), -O-**Het**,

koji je opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta **X**,

pri čemu je svaki **X** odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih: halogen, okso, -C₁₋₄-alkil, -O-C₁₋₄-alkil, -C₁₋₄-haloalkil, -O-(C₁₋₄-alkilen)-**Het**, **Het**, **Hetaril**, -NH₂,

pri čemu je supstituent **X** opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta iz skupine odabrane od okso, metila, etila, n-propila, izopropila, n-butila, izobutila i tert-butila, i farmaceutski prihvatljive soli od gore spomenutih spojeva.

5. Spoj formule **1a** ili formule **1a'** prema patentnom zahtjevu 4, **naznačen time, da**

R¹ je

a) ili odabran iz skupine koja se sastoji od **Heta** i **Hetarila**;

koji je opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta **Z**,

pri čemu je svaki **Z** supstituent odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih: -OH, okso, -CN, halogen, -C₁₋₆-alkil, -O-C₁₋₆-alkil, -C₁₋₆-haloalkil, tročlani do sedam-člani cikloalkil, **Het**, **Hetaril**, -CO-N(CH₃)₂, -CO-NHCH₃, -CO-NH₂,

-(C₁₋₃-alkilen)-O-(C₁₋₃-alkil), -O-**Het**,

koji je opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta **X**,

pri čemu je svaki **X** odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih: halogen, okso,

-C₁₋₄-alkil, -O-C₁₋₄-alkil, -C₁₋₄-haloalkil, -O-(C₁₋₄-alkilen)-**Het**, **Het**, **Hetaril**, -NH₂,

pri čemu je supstituent **X** opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta iz skupine odabrane od okso, metila, etila, n-propila, izopropila, n-butila, izobutila i tert-butila,

ili gdje R¹ je

b) fenil,

koji je opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta **Z**,

pri čemu je svaki **Z** supstituent odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih: -CN, halogen, -C₁₋₆-alkil, -(C₁₋₃-alkilen)-**Hetaril**, -(C₁₋₃-alkilen)-**Het**, -C₁₋₆-haloalkil, tročlani do sedam-člani cikloalkil, **Het**, **Hetaril**,

koji je opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta **X**,

pri čemu je svaki **X** odabran iz skupine koja se sastoji od halogena, okso i -C₁₋₄-alkila,

i farmaceutski prihvatljive soli od gore spomenutih spojeva.

6. Spoj formule **1a** ili formule **1a'** prema jednom od patentnih zahtjeva 4 ili 5, **naznačen time, da**

R¹ je ili

monociklički pet-člani do šest-člani heteroaromat s 1, 2 ili 3 heteroatoma od kojih je svaki neovisno od drugih odabran iz skupine koja se sastoji od N, O i S,

ili 9-člani do 11-člani biciklički heteroaromat s 1, 2, 3 ili 4 heteroatoma od kojih je svaki neovisno od drugih odabran iz skupine koja se sastoji od N, O i S,

gdje je taj R¹-ostatak priključen na preostali dio molekule bilo putem C-atoma ili putem

N-atoma i opcionalno je dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta **Z**,

pri čemu je svaki **Z** supstituent odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih:

-OH, okso, -CN, halogen, -metil, -etil, n-propil, izopropil, n-butil, izobutil, tert-butil,
-O-C₁₋₆-alkil, -C₁₋₆-haloalkil, tročlani do sedam-člani cikloalkil, **Het**, **Hetaril**, -CO-N(CH₃)₂,
-CO-NHCH₃, -CO-NH₂, -(C₁₋₃-alkilen)-O-(C₁₋₃-alkil), -O-**Het**,

koji je opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta **X**,

pri čemu je svaki **X** odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih: halogen, okso, -C₁₋₄-alkil, -O-C₁₋₄-alkil, -C₁₋₄-haloalkil, -O-(C₁₋₄-alkilen)-**Het**, **Het**, **Hetaril**, -NH₂,

pri čemu je supstituent **X** opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta iz skupine odabrane od okso, metila, etila, n-propila, izopropila, n-butila, izobutila i tert-butila,

i farmaceutski prihvatljive soli od gore spomenutih spojeva.

7. Spoj formule **1a** ili formule **1a'** prema patentnom zahtjevu 4, **naznačen time, da**

R¹ je odabran iz skupine koja se sastoji od piridinila, pirimidinila, pirazinila, pirolila, imidazolila, pirazolila, tiofenila, furanila, pirazolopiridinila, indazolila, tiazolila, imidazo-piridinila i indolila,

gdje je taj **R¹** –ostatak priključen na preostali dio molekule bilo putem C-atoma ili putem N-atoma i opcionalno je dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta **Z**,

pri čemu je svaki **Z** supstituent odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih:

-OH, okso, -CN, halogen, -metil, -etil, n-propil, izopropil, n-butil, izobutil, tert-butil, -O-metil,
-O-etil, O-propil, O-butil, -C₁₋₃-haloalkil, tročlani, četiri-člani, pet-člani ili šest-člani cikloalkil, **Het**, **Hetaril**, -CO-N(CH₃)₂, -CO-NHCH₃, -CO-NH₂, -(C₁₋₃-alkilen)-O-(C₁₋₃-alkil), -O-**Het**,

koji je opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta **X**,

pri čemu je svaki **X** odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih: halogen, okso, -C₁₋₄-alkil, -O-C₁₋₄-alkil, -C₁₋₄-haloalkil, -O-(C₁₋₄-alkilen)-**Het**, **Het**, **Hetaril**, -NH₂,

pri čemu je supstituent **X** opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta iz skupine odabrane od okso, metila, etila, n-propila, izopropila, n-butila, izobutila i tert-butila,

i farmaceutski prihvatljive soli od gore spomenutih spojeva.

8. Spoj formule **1a** ili formule **1a'** prema patentnom zahtjevu 4, **naznačen time, da**

R¹ je fenil,

koji je opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta **Z**,

pri čemu je svaki **Z** supstituent odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih:

-OH, okso, -CN, halogen, -C₁₋₆-alkil, -O-C₁₋₆-alkil, -C₁₋₆-haloalkil, tročlani do sedam-člani cikloalkil, **Het**, **Hetaril**, -CO-N(CH₃)₂, -CO-NHCH₃, -CO-NH₂, -(C₁₋₃-alkilen)-O-(C₁₋₃-alkil),
-O-**Het**,

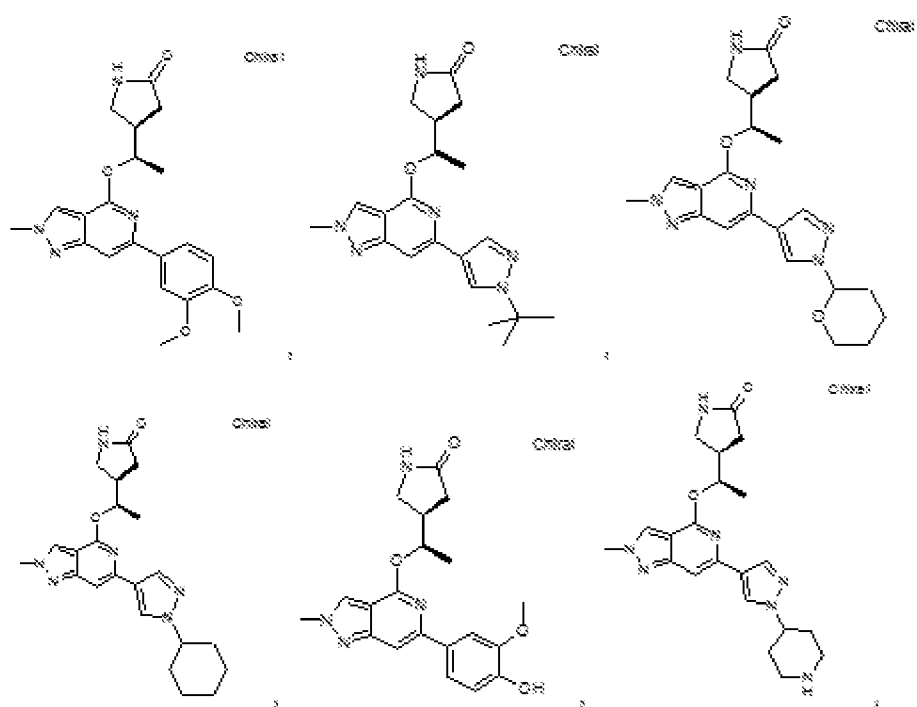
koji je opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta **X**,

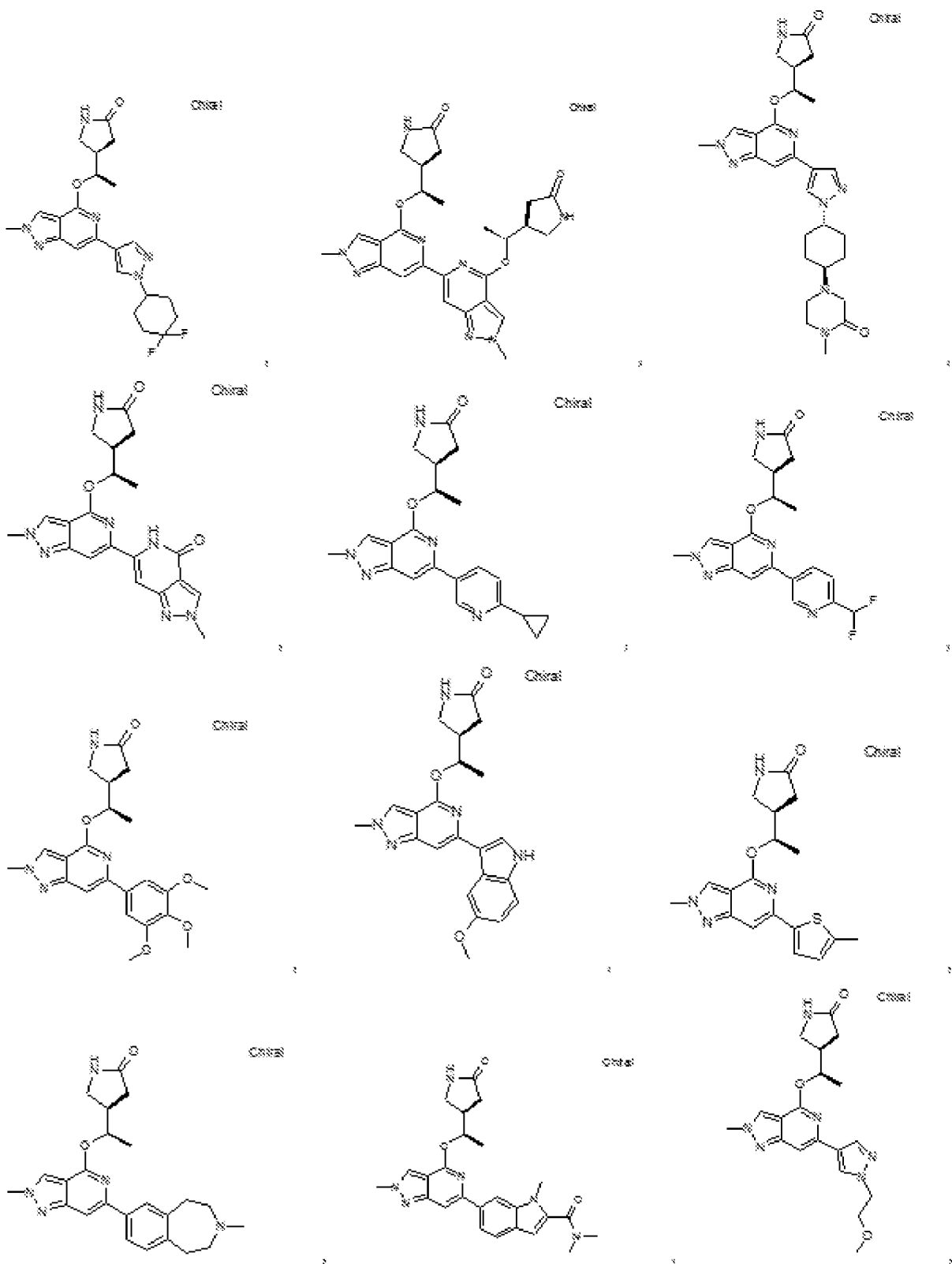
pri čemu je svaki **X** odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih: halogen, okso, -C₁₋₄-alkil, -O-C₁₋₄-alkil, -C₁₋₄-haloalkil, -O-(C₁₋₄-alkilen)-**Het**, **Het**, **Hetaril**, -NH₂,

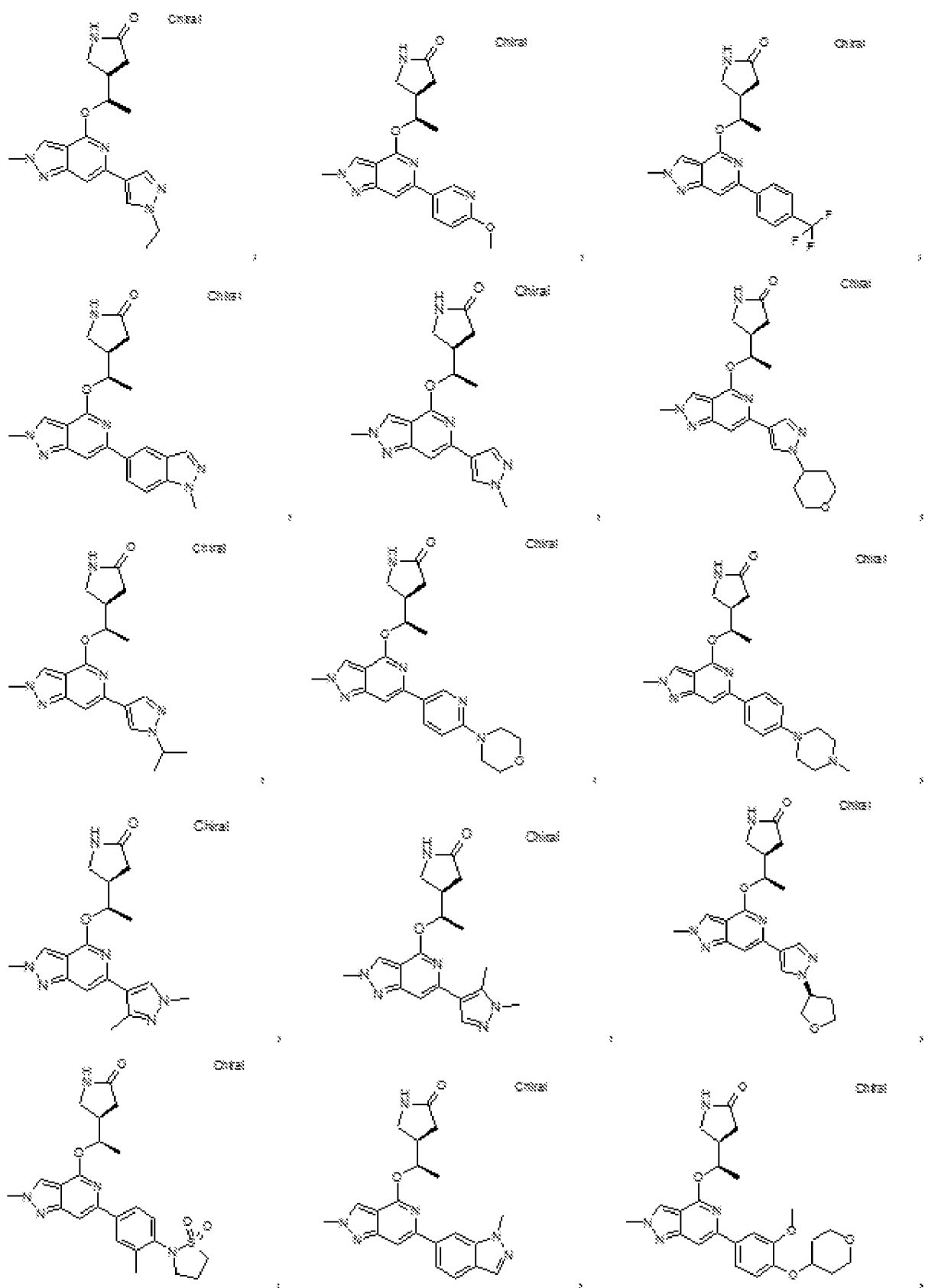
pri čemu je supstituent **X** opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta iz skupine odabrane od okso, metila, etila, n-propila, izopropila, n-butila, izobutila i tert-butila,

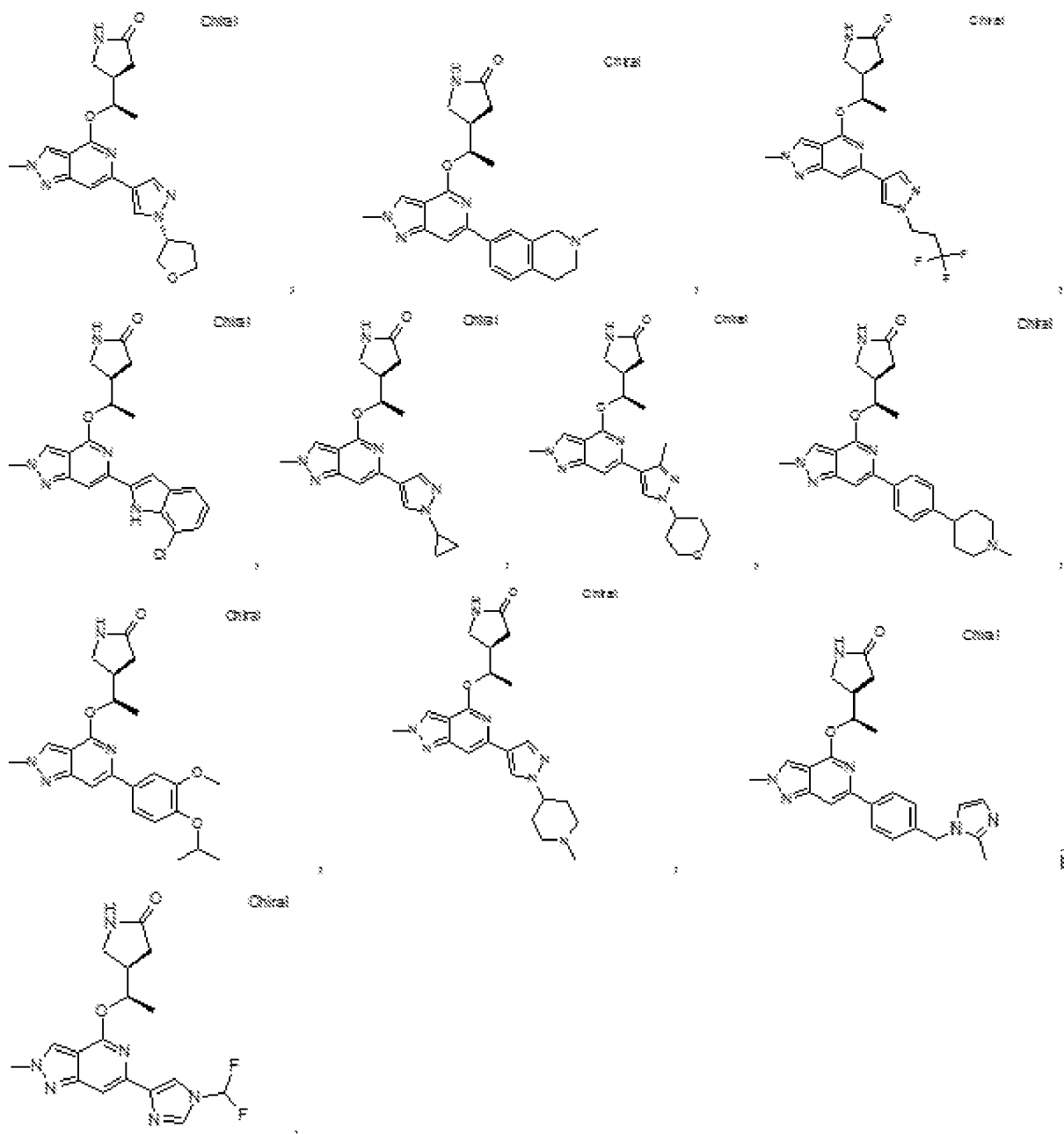
i farmaceutski prihvatljive soli od gore spomenutih spojeva.

9. Spoj formule **1a** ili formule **1a'** prema patentnom zahtjevu 4, **naznačen time, da** je odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih:



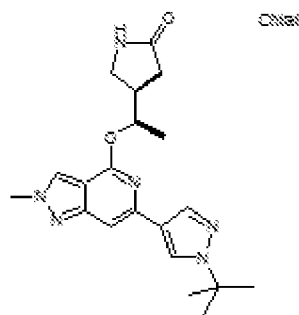




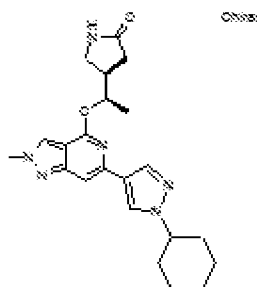


i farmaceutski prihvatljive soli od gore spomenutih spojeva.

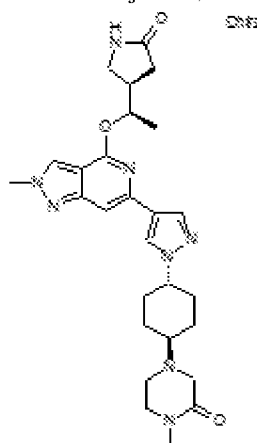
10. Spoj formule **1a** ili formule **1a'** prema patentnom zahtjevu 4, **naznačen time, da je**



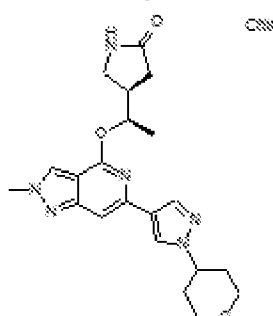
11. Spoj formule **1a** ili formule **1a'** prema patentnom zahtjevu 4, **naznačen time, da je**



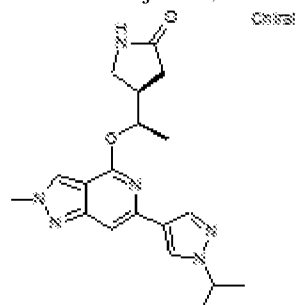
12. Spoj formule **1a** ili formule **1a'** prema patentnom zahtjevu 4, **naznačen time**, da je



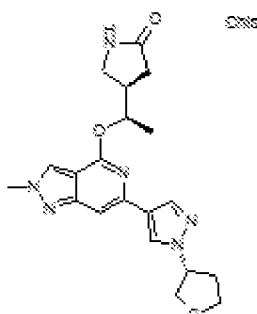
13. Spoj formule **1a** ili formule **1a'** prema patentnom zahtjevu 4, **naznačen time**, da je



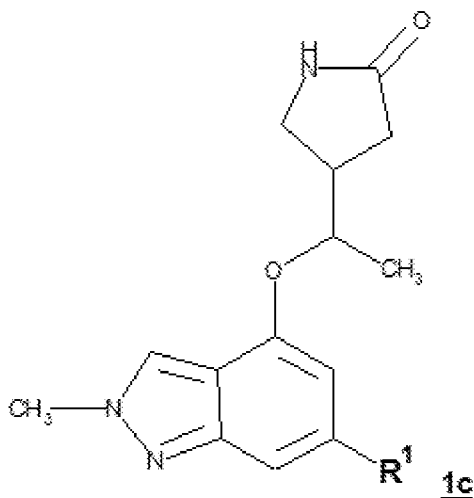
- 5 14. Spoj formule **1a** ili formule **1a'** prema patentnom zahtjevu 4, **naznačen time**, da je



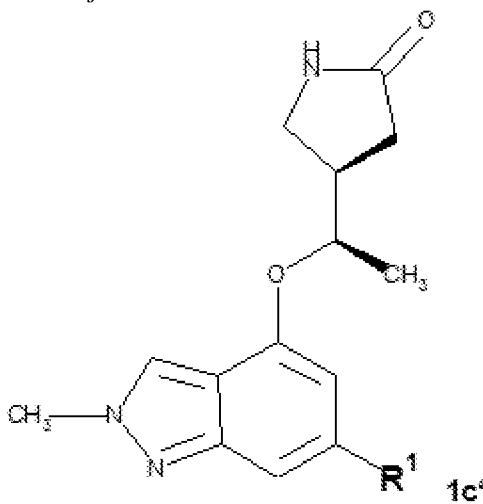
15. Spoj formule **1a** ili formule **1a'** prema patentnom zahtjevu 4, **naznačen time**, da je



16. Farmaceutski prihvatljiva sol, **naznačena time, da** je od bilo kojeg od spojeva iz patentnih zahtjeva 11, 12, 13, 14 ili 15.
17. Spoj formule **1c** prema patentnom zahtjevu 1



ili formule **1c'** u skladu s patentnim zahtjevom 2



naznačen time, da

R¹ je odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih:

fenil, **Het** i **Hetaril**;

koji je opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta **Z**,

pri čemu je svaki **Z** supstituent odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih:

-OH, okso, -CN, halogen, -C₁₋₆-alkil, -O-C₁₋₆-alkil, -C₁₋₆-haloalkil, tročlani do sedam-člani cikloalkil, **Het**, **Hetaril**, -CO-N(CH₃)₂, -CO-NHCH₃, -CO-NH₂, -(C₁₋₃-alkilen)-O-(C₁₋₃-alkil), -O-**Het**,

koji je opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta **X**,

pri čemu je svaki **X** odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih: halogen, okso, -C₁₋₄-alkil, -O-C₁₋₄-alkil, -C₁₋₄-haloalkil, -O-(C₁₋₄-alkilen)-**Het**, **Het**, -NH₂,

pri čemu je supstituent **X** opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta iz skupine odabrane od okso, metila, etila, n-propila, izopropila, n-butila, izobutila i tert-butila, i farmaceutski prihvatljive soli od gore spomenutih spojeva.

18. Spoj formule **1c** ili formule **1c'** prema patentnom zahtjevu 17, **naznačen time, da** **R¹** je

a) ili odabran iz skupine koja se sastoji od **Heta** i **Hetarila**;

koji je opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta **Z**,

pri čemu je svaki **Z** supstituent odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih: -OH, okso, -CN, halogen, -C₁₋₆-alkil, -O-C₁₋₆-alkil, -C₁₋₆-haloalkil, tročlani do sedam-člani cikloalkil, **Het**, **Hetaril**, -CO-N(CH₃)₂, -CO-NHCH₃, -CO-NH₂,

-(C₁₋₃-alkilen)-O-(C₁₋₃-alkil), -O-**Het**,

koji je opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta **X**,

pri čemu je svaki **X** odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih: halogen, okso,

-C₁₋₄-alkil, -O-C₁₋₄-alkil, -C₁₋₄-haloalkil, -O-(C₁₋₄-alkilen)-**Het**, **Het**, **Hetaril**, -NH₂,

pri čemu je supstituent **X** opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta iz skupine odabrane od okso, metila, etila, n-propila, izopropila, n-butila, izobutila i tert-butila,

ili gdje **R**¹ is

b) fenil,

koji je opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta **Z**,

pri čemu je svaki **Z** supstituent odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih: -CN, halogen, -C₁₋₆-alkil, -(C₁₋₃-alkilen)-**Hetaril**, -(C₁₋₃-alkilen)-**Het**, -C₁₋₆-haloalkil, tročlani do sedam-člani cikloalkil, **Het**, **Hetaril**,

koji je opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta **X**,

pri čemu je svaki **X** odabran iz skupine koja se sastoji od halogena, okso i -C₁₋₄-alkila,

i farmaceutski prihvatljive soli od gore spomenutih spojeva.

19. Spoj formule **1c** ili formule **1c'** prema jednom od patentnih zahtjeva 17 ili 18, **naznačen time, da**

R¹ je ili

monociklički pet-člani do šest-člani heteroaromat s 1, 2 ili 3 heteroatoma od kojih je svaki neovisno od drugih odabran iz skupine koja se sastoji od N, O i S,

ili 9-člani do 11-člani biciklički heteroaromat s 1, 2, 3 ili 4 heteroatoma od kojih je svaki neovisno od drugih odabran iz skupine koja se sastoji od N, O i S,

gdje je taj **R**¹ –ostatak priključen na preostali dio molekule bilo putem C-atoma ili putem N-atoma i opcionalno je dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta **Z**,

pri čemu je svaki **Z** supstituent odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih:

-OH, okso, -CN, halogen, -metil, -etil, n-propil, izopropil, n-butil, izobutil, tert-butil,

-O-C₁₋₆-alkil, -C₁₋₆-haloalkil, tročlani do sedam-člani cikloalkil, **Het**, **Hetaril**,

-CO-N(CH₃)₂, -CO-NHCH₃, -CO-NH₂, -(C₁₋₃-alkilen)-O-(C₁₋₃-alkil), -O-**Het**,

koji je opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta **X**,

pri čemu je svaki **X** odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih: halogen, okso, -C₁₋₄-alkil, -O-C₁₋₄-alkil, -C₁₋₄-haloalkil, -O-(C₁₋₄-alkilen)-**Het**, **Het**, -NH₂,

pri čemu je supstituent **X** opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta iz skupine odabrane od okso, metila, etila, n-propila, izopropila, n-butila, izobutila i tert-butila,

i farmaceutski prihvatljive soli od gore spomenutih spojeva.

20. Spoj formule **1c** ili formule **1c'** prema patentnom zahtjevu 17, **naznačen time, da**

R¹ je odabran iz skupine koja se sastoji od piridinila, pirimidinila, pirazinila, pirolila, imidazolila, pirazolila, tiofenila, furanila, pirazolopiridinila, indazolila, tiazolila, imidazo-piridinila i indolila,

gdje je taj **R**¹ –ostatak priključen na preostali dio molekule bilo putem C-atoma ili putem N-atoma i opcionalno je dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta **Z**,

pri čemu je svaki **Z** supstituent odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih:

-OH, okso, -CN, halogen, -metil, -etil, n-propil, izopropil, n-butil, izobutil, tert-butil,

-O-metil, -O-etil, O-propil, O-butil, -C₁₋₃-haloalkil, tročlani, četiri-člani, pet-člani ili šest-člani cikloalkil, **Het**,

Hetaril, -CO-N(CH₃)₂, -CO-NHCH₃, -CO-NH₂, -(C₁₋₃-alkilen)-O-(C₁₋₃-alkil),

-O-**Het**,

koji je opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta **X**,

pri čemu je svaki **X** odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih: halogen, okso, -C₁₋₄-alkil, -O-C₁₋₄-alkil, -C₁₋₄-haloalkil, -O-(C₁₋₄-alkilen)-**Het**, **Het**, -NH₂,

pri čemu je supstituent **X** opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta iz skupine odabrane od okso, metila, etila, n-propila, izopropila, n-butila, izobutila i tert-butila,

i farmaceutski prihvatljive soli od gore spomenutih spojeva.

21. Spoj formule **1c** ili formule **1c'** prema patentnom zahtjevu 17, **naznačen time, da**

R¹ je fenil,

koji je opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta **Z**,

pri čemu je svaki **Z** supstituent odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih:

-OH, okso, -CN, halogen, -C₁₋₆-alkil, -O-C₁₋₆-alkil, -C₁₋₆-haloalkil, tročlani do sedam-člani cikloalkil, **Het**, **Hetaril**,

-CO-N(CH₃)₂, -CO-NHCH₃, -CO-NH₂, -(C₁₋₃-alkilen)-O-(C₁₋₃-alkil),

-O-**Het**,

koji je opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta **X**,

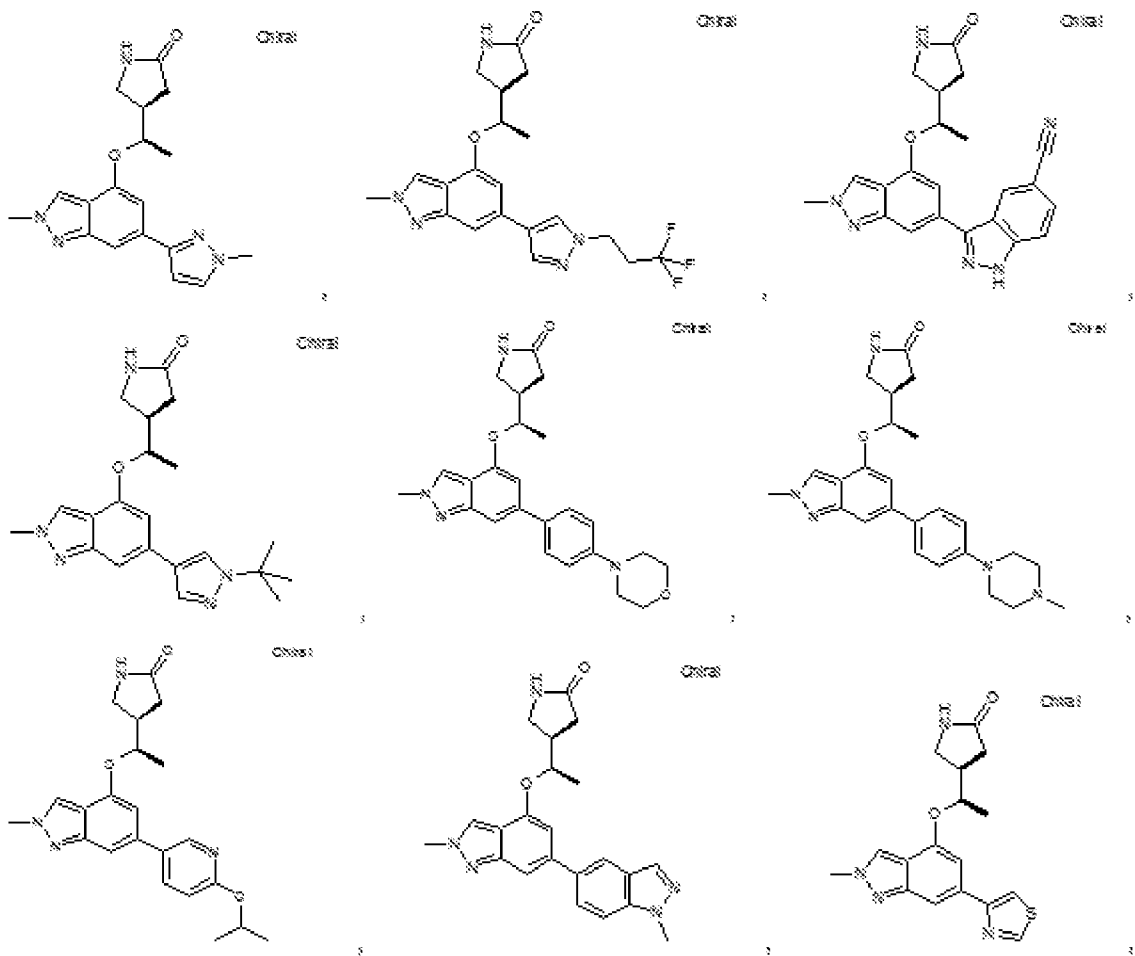
pri čemu je svaki **X** odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih: halogen, okso, -C₁₋₄-alkil, -O-C₁₋₄-alkil, -C₁₋₄-haloalkil, -O-(C₁₋₄-alkilen)-**Het**, **Het**, -NH₂,

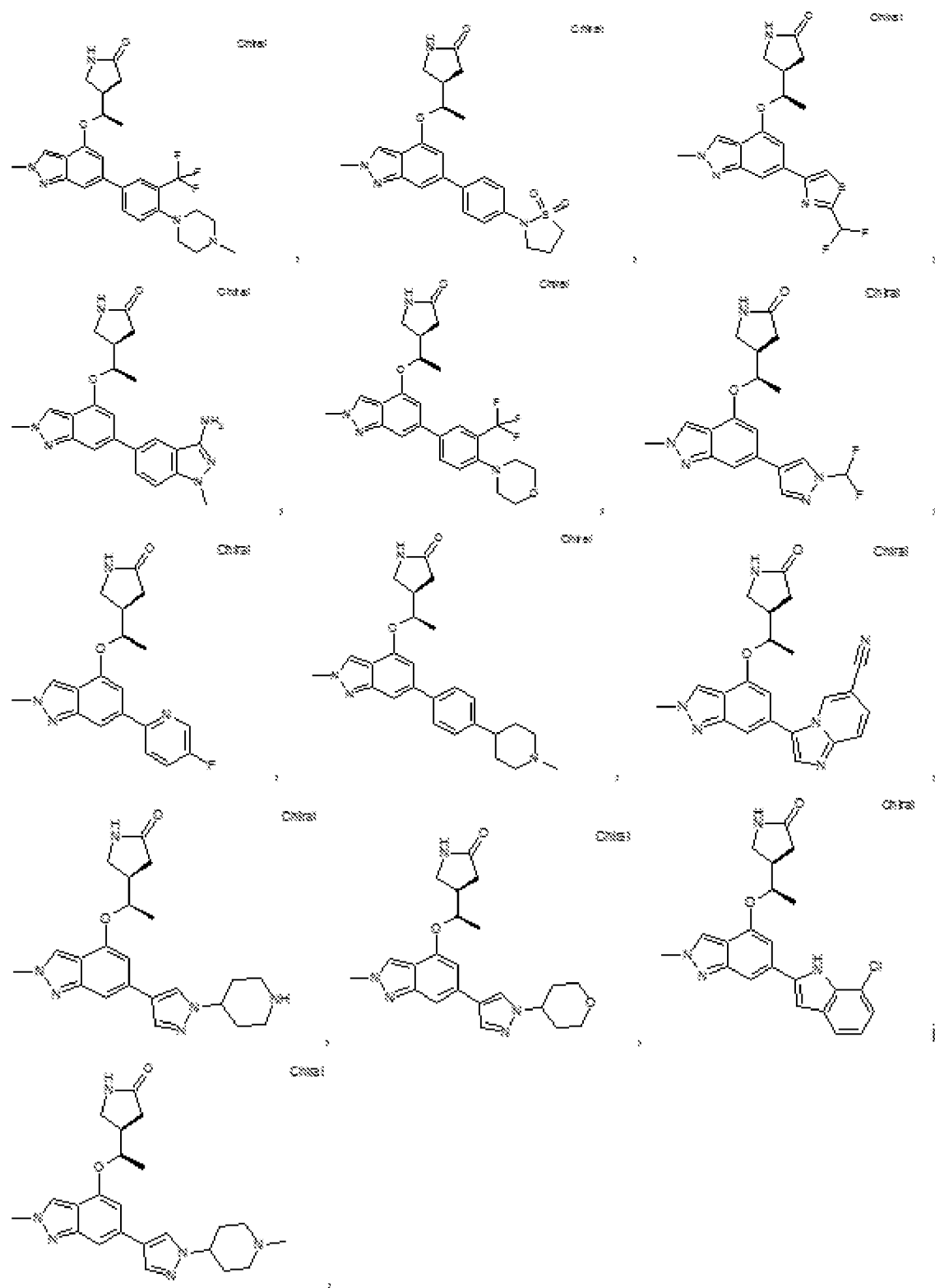
pri čemu je supstituent **X** opcionalno dalje supstituiran s jednim, dva ili tri supstituenta iz skupine odabrane od okso, metila, etila, n-propila, izopropila, n-butila, izobutila i tert-butila,

i farmaceutski prihvatljive soli od gore spomenutih spojeva.

22. Spoj formule **1c** ili formule **1c'** prema patentnom zahtjevu 17, **naznačen time, da**

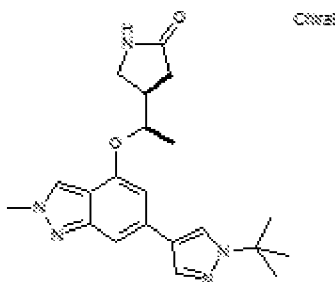
je odabran iz skupine koja se sastoji od sljedećih:



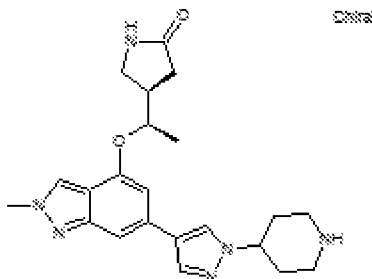


i farmaceutski prihvatljive soli od gore spomenutih spojeva.

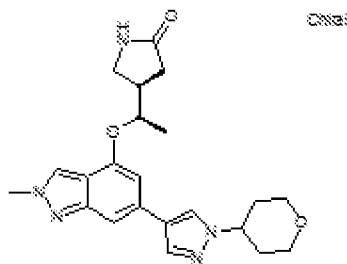
23. Spoj formule **1c** ili formule **1c'** prema patentnom zahtjevu 17, **naznačen time, da je**



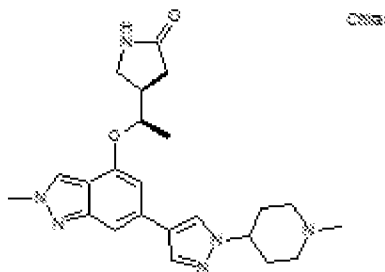
24. Spoj formule **1c** ili formule **1c'** prema patentnom zahtjevu 17, **naznačen time, da je**



25. Spoj formule **1c** ili formule **1c'** prema patentnom zahtjevu 17, **naznačen time, da je**

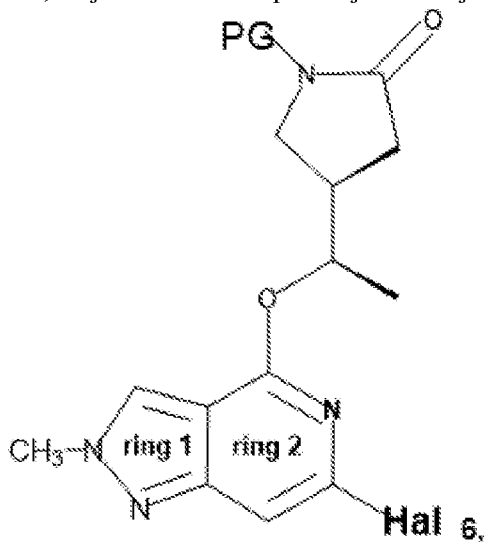


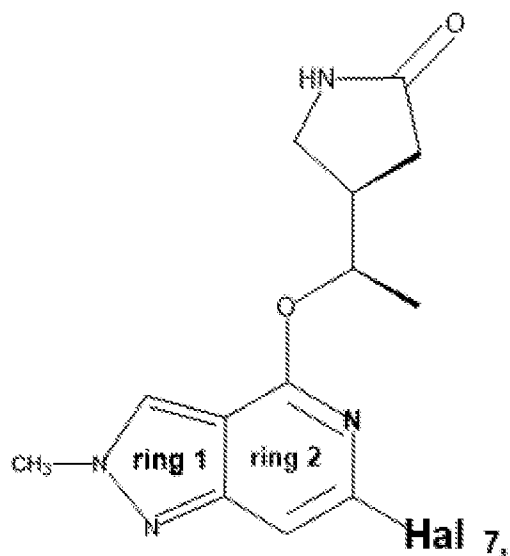
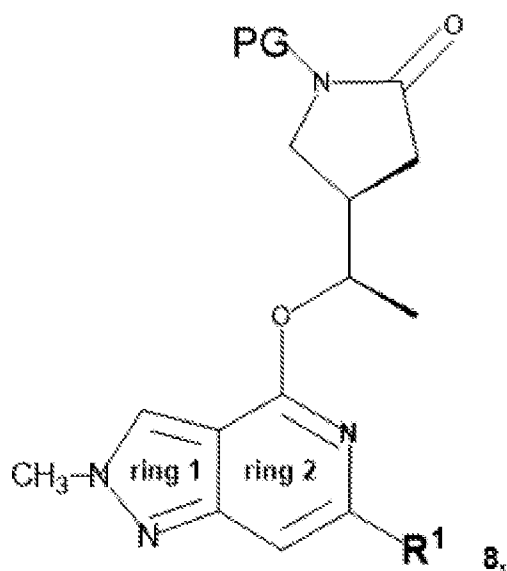
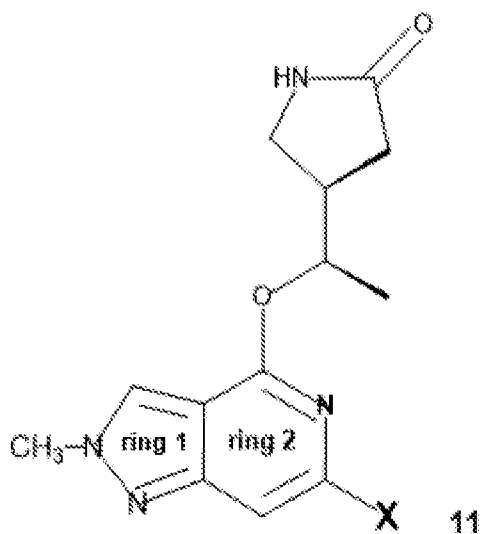
26. Spoj formule **1c** ili formule **1c'** prema patentnom zahtjevu 17, **naznačen time, da je**



27. Farmaceutski prihvatljiva sol, **naznačena time, da je** od bilo kojeg spoja prema patentnim zahtjevima 23, 24, 25 ili 26.

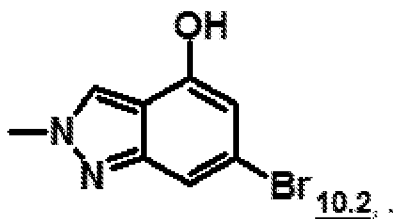
28. Intermedijaran spoj, **naznačen time, da je** odabran iz skupine koja se sastoji od formule **6**



formule 7formule 85 i formule 11

gdje **R¹** je definiran isto kao u patentnom zahtjevu 1 i gdje **Hal** je Cl ili Br,
 i gdje **X** je -B(OH)₂, -pinakolester borne kiseline, -trifluoroborat ili -SnBu₃,
 i gdje **PG** je zaštitna skupina odabrana iz skupine koja se sastoji od benzila, 1-feniletila, 1-(4-metoksifenil)etila.

10 29. Intermedijaran spoj, **naznačen time, da** je predstavljen formulom 10.2



30. Spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 27, **naznačen time, da** se upotrebljava za liječenje bolesti odabrane iz skupine koja se sastoji od alergijskog rinitisa, astme, KOPB-a, sindroma opasnog respiratornog poremećaja kod odraslih, bronhitisa, limfoma B-stanice, dermatitisa i kontaktnog dermatitisa, alergijskog dermatitisa, alergijskog rinokonjunktivitisa, reumatoidnog artritisa, anti-fosfolipidnog sindroma, Bergerove bolesti, Evansovog sindroma, ulcerativnog kolitisa, alergijskog glomerulonefritisa na bazi protutijela, granulocitopenije, Goodpastureovog sindroma, hepatitisa, Henoch-Schönleinove purpure, hipersenzitivnog vaskulitisa, imunohemolitičke anemije, autoimune hemolitičke anemije, idiopatske trombocitopenijske purpure, Kawasaki-sindroma, alergijskog konjunktivitisa, lupus eritematode, lupus nefritisa, limfoma stanica omotača, neutropenije, neporodične lateralne skleroze, arterioskleroze, Crohnove bolesti, multiple skleroze, mijastenije gravis, osteoporoze, osteolitičkih bolesti, osteopenije, psorijaze, Sjögrenovog sindroma, skleroderme, limfoma T-stanice, urtikarije / angioedema, Wegenerove granulomatoze i celijakije.
31. Spoj za uporabu u liječenju bolesti u skladu s patentnim zahtjevom 30, **naznačen time, da** je bolest odabrana iz skupine koja se sastoji od astme, KOPB-a, alergijskog rinitisa, sindroma opasnog respiratornog poremećaja kod odraslih, bronhitisa, alergijskog dermatitisa, kontaktnog dermatitisa, idiopatske trombocitopenijske purpure, reumatoidnog artritisa, lupus eritematode, lupus nefritisa i alergijskog rinokonjunktivitisa.
32. Spoj za uporabu u liječenju bolesti u skladu s jednim od patentnih zahtjeva 30 ili 31, **naznačen time, da** je bolest odabrana iz skupine koja se sastoji od astme, KOPB-a, alergijskog rinitisa, alergijskog dermatitisa, lupus eritematode, lupus nefritisa i reumatoidnog artritisa.
33. Farmaceutski pripravci, **naznačeni time, da** oni sadrže jedan ili više spojeva u skladu s jednim od patentnih zahtjeva 1 do 27 i farmaceutski prihvatljivo pomoćno sredstvo.
34. Farmaceutski pripravci, **naznačeni time, da** oni sadrže jedan ili više spojeva u skladu s jednim od patentnih zahtjeva 1 do 27 u kombinaciji s djelatnom tvari odabranom iz skupine koja se sastoji od antikolinergika, betamimetika, kortikosteroida, PDE4-inhibitora, EGFR-inhibitora, LTD4-antagonista, CCR3-inhibitora, iNOS-inhibitora, CRTH2-antagonista, inhibitora reduktaze HMG-CoA i NSAID-a.