



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20100574 T1

HR P20100574 T1

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

(51) MKP:

C07D 519/00 (2006.01)
C07D 471/16 (2006.01)
C07D 487/16 (2006.01)
A61K 31/4985 (2006.01)
A61P 31/00 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 31.12.2010.

(21) Broj predmeta: P20100574T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 19.10.2010.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2008054621
Datum podnošenja međunarodne prijave: 16.04.2008.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 08749580.0
Datum podnošenja europske prijave patenta: 16.04.2008.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2008128942
Datum međunarodne objave: 30.10.2008.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2137196 A1
Datum objave europske prijave patenta: 30.12.2009.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2137196 B1
Datum objave europskog patenta: 06.10.2010.

(31) Broj prve prijave: 0707705
0720569
0805311

(32) Datum podnošenja prve prijave: 20.04.2007.
19.10.2007.
20.03.2008.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: GB
GB
GB

(73) Nositelj patenta:

**Glaxo Group Limited, Glaxo Wellcome House, Berkeley Avenue,
Greenford, Middlesex UB6 0NN, GB**

(72) Izumitelji:

**David Evan Davies, c/o GlaxoSmithKline, Gunnels Wood Road,
Stevenage, Hertfordshire SG1 2NY, GB**
**David Thomas Davies, c/o GlaxoSmithKline, Gunnels Wood Road,
Stevenage, Hertfordshire SG1 2NY, GB**
**Ilaria Giordano, GlaxoSmithKline, Gunnels Wood Road, Stevenage,
Hertfordshire SG1 2NY, GB**
**Alan Joseph Hennessy, GlaxoSmithKline, Gunnels Wood Road,
Stevenage, Hertfordshire SG1 2NY, GB**
**Neil David Pearson, GlaxoSmithKline, 1250 S. Collegeville Road, P.O.
Box 5089, 19426 Collegeville, PA, US**

(74) Zastupnik:

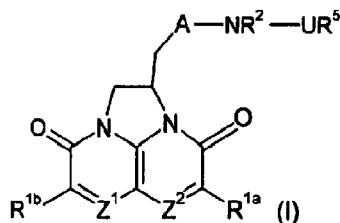
Hraste & Partneri odvjetničko društvo, 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma: **TRICKLIČKI SPOJEVI S DUŠIKOM KAO ANTIBAKTERIJSKA SREDSTVA**

HR P20100574 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

- 5 1. Spoj formule (I) ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol i/ili *N*-oksid:
naznačen time što:



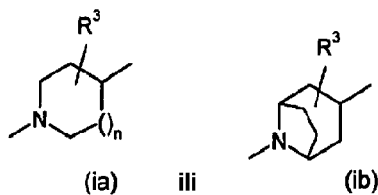
Z^1 i Z^2 se neovisno bira između CH i N;

R^{1a} i R^{1b} se neovisno bira između vodika; halogena; cijano; (C_{1-6}) alkila; (C_{1-6}) alkiltio; trifluormetila; trifluormetoksi; karboksi; hidroksi, izborno supstituiranog s (C_{1-6}) alkilom ili (C_{1-6}) alkoksi-supstituiranim (C_{1-6}) alkilom; (C_{1-6}) alkoksi-supstituiranog (C_{1-6}) alkila; hidroksi (C_{1-6}) alkila; amino skupine, izborno *N*-supstituirane s jednom ili dvije (C_{1-6}) alkilne, formilne, (C_{1-6}) alkilkarbonilne ili (C_{1-6}) alkilsulfonilne skupine; i aminokarbonila, gdje amino skupina je izborno supstituirana s (C_{1-4}) alkilom;

uz uvjet da R^{1a} je H kada Z^2 je N, a R^{1b} je H kada Z^1 je N;

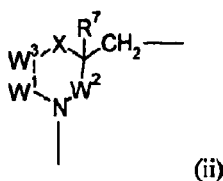
R^2 je vodik ili (C_{1-4}) alkil, ili zajedno s R^6 tvori Y, kao što je definirano niže;

A je skupina (i):



u kojoj: R^3 je kao što je definirano za R^{1a} i R^{1b} ili je okso, a n je 1 ili 2:

ili A je skupina (ii)



gdje:

W^1 , W^2 i W^3 su CR^4R^8 ;

ili W^2 i W^3 su CR^4R^8 , a W^1 predstavlja vezu između W^3 i N;

X je O, CR^4R^8 ili NR^6 ;

jedan R^4 je kao što je definirano za R^{1a} i R^{1b} , a ostatak i R^8 su vodici ili jedan R^4 i R^8 su zajedno okso, a ostatak je vodik;

R^6 je vodik ili (C_{1-6}) alkil; ili zajedno s R^2 tvori Y;

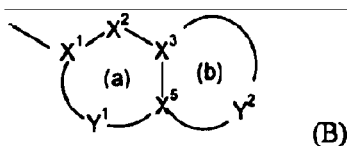
R^7 je vodik; halogen; hidroksi, izborno supstituiran s (C_{1-6}) alkilom; ili (C_{1-6}) alkil;

Y je $CR^4R^8CH_2$; $CH_2CR^4R^8$; $(C=O)$; CR^4R^8 ; $CR^4R^8(C=O)$; ili $(C=O)CR^4R^8$;

ili kada X je CR^4R^8 , R^8 i R^7 zajedno predstavljaju vezu;

U se bira između CO i CH₂; i

R⁵ je izborno supstituiran biciklički karbociklički ili heterociklički prstenasti sustav (B):



koji sadrži do četiri heteroatoma u svakom prstenu, gdje najmanje jedan od prstena (a) i (b) je aromatski;

X¹ je C ili N kada je dio aromatskog prstena, ili CR¹⁴ kada je dio nearomatskog prstena;

X² je N, NR¹³, O, S(O)_x, CO ili CR¹⁴ kada je dio aromatskog ili nearomatskog prstena, ili dodatno može biti CR¹⁴R¹⁵ kada je dio nearomatskog prstena;

X³ i X⁵ su neovisno N ili C;

Y¹ je 0- do 4-atomska spojница, čiji svaki atom se neovisno bira između N, NR¹³, O, S(O)_x, CO i CR¹⁴ kada je dio aromatskog ili nearomatskog prstena, ili dodatno može biti CR¹⁴R¹⁵ kada je dio nearomatskog prstena;

Y² je 2- do 6-atomska spojница, gdje se svaki atom u Y² neovisno bira između N, NR¹³, O, S(O)_x, CO, CR¹⁴ kada je dio aromatskog ili nearomatskog prstena, ili dodatno može biti CR¹⁴R¹⁵ kada je dio nearomatskog prstena;

svakog od R¹⁴ i R¹⁵ se neovisno bira između: H; (C₁₋₄)alkiltio; halogena; karboksi(C₁₋₄)alkila; (C₁₋₄)alkila; (C₁₋₄)alkoksikarbonila; (C₁₋₄)alkilkarbonila; (C₁₋₄)alkoksi(C₁₋₄)alkila; hidroksi; hidroksi(C₁₋₄)alkila; (C₁₋₄)alkoksi; nitro; cijano; karboksi; amino ili aminokarbonila, izborno mono- ili disupstituiranog s (C₁₋₄)alkilom; ili

R¹⁴ i R¹⁵ zajedno mogu predstavljati okso;

svaki R¹³ je neovisno H; trifluorometil; (C₁₋₄)alkil, izborno supstituiran s hidroksi, (C₁₋₆)alkoksi, (C₁₋₆)alkiltio, halogen ili trifluorometil; (C₂₋₄)alkenil; (C₁₋₄)alkoksikarbonil; (C₁₋₄)alkilkarbonil; (C₁₋₆)alkilsulfonil; aminokarbonil, gdje amino skupina je izborno mono- ili disupstituirana s (C₁₋₄)alkilom; i

svaki x je neovisno 0, 1 ili 2.

2. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što:

(i) Z¹ i Z² su oba CH;

(ii) Z¹ je N i Z² je CH; ili

(iii) Z¹ je CH i Z² je N.

3. Spoj u skladu s bilo kojim od prethodnih patentnih zahtjeva, **naznačen time** što R^{1a} je vodik i R^{1b} je vodik.

4. Spoj u skladu s bilo kojim od prethodnih patentnih zahtjeva, **naznačen time** što A je (ia), n je 1 i R³ je H ili hidroksi na položaju 3, A je (ii), X je CR⁴R⁸, gdje R⁸ je H, a R⁴ je H ili OH, ili A je (ii), X je O, R⁷ je H, a svaki od W¹, W² i W³ je CH₂.

5. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 4, **naznačen time** što A je piperidin-4-il ili pirolidin-4-ilmetil.

6. Spoj u skladu s bilo kojim od prethodnih patentnih zahtjeva, **naznačen time** što U je CH₂.

7. Spoj u skladu s bilo kojim od prethodnih patentnih zahtjeva, **naznačen time** što R⁵ je aromatski heterociklički prsten (B) s 8-11 atoma u prstenu, uključujući 2-4 heteroatoma, od kojih najmanje jedan je N ili NR¹³, gdje Y² sadrži 2-3 heteroatoma, od kojih je jedan S, a 1-2 su N, gdje N je vezan na X³, ili heterociklički prsten (B) sadrži aromatski prsten (a), kojeg se bira između izborno supstituiranih benzo, pirido, piridazino i pirimidino, i prsten nearomatski (b), a Y² sadrži 3-5 atoma, uključujući najmanje jedan heteroatom, gdje O, S, CH₂ ili NR¹³ je vezan na X⁵, gdje R¹³ nije vodik, a NHCO je bilo preko N vezan na X³, ili O, S, CH₂ ili NH je vezan na X³.

8. Spoj u skladu s bilo kojim od zahtjeva 1 do 6, **naznačen time** što R⁵ se bira između:

3-okso-3,4-dihidro-2H-pirido[3,2-b][1,4]oksazin-6-ila

3-okso-3,4-dihidro-2H-pirido[3,2-b][1,4]tiazin-6-ila

2,3-dihidro-1,4-dioksino[2,3-c]piridin-7-ila

1,3-oksatiolo[5,4-c]piridin-6-ila

6-fluor-2,3-dihidro-1,4-benzodioksin-7-ila

2,3-dihidro-1,4-oksatiino[2,3-c]piridin-7-ila

3,4-dihidro-2H-pirano[2,3-c]piridin-6-ila

5-fluor-2,3-dihidro-1,4-benzodioksin-7-ila

5-karbonitro-2,3-dihidro-1,4-benzodioksin-7-ila

2,3-dihidrobenzo-1,4-dioksin-6-ila.

9. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što ga se bira imeđu:

1-(4-[(2,3-Dihidro-1,4-dioksino[2,3-*c*]piridin-7-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8*a*-triazacenaftilen-3,8-diona;

1-(4-[(1,3-Oksatiolo[5,4-*c*]piridin-6-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

1-(4-[(2,3-Dihidro-1,4-dioksino[2,3-*c*]piridin-7-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

1-(4-[(7-Bromo-3-okso-3,4-dihidro-2*H*-pirido[3,2-*b*][1,4]tiazin-6-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1*R*)-1-(4-[(1,3-Oksatiolo[5,4-*c*]piridin-6-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1*R*)-1-(4-[(2,3-Dihidro-1,4-oksatiino[2,3-*c*]piridin-7-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1*R*)-1-(4-[(5,6,7,8-Tetrahidro-3-izokinolinilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1*R*)-1-(4-[(6,7-Dihidro-5*H*-ciklopenta[*c*]piridin-3-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1*R*)-1-(4-[(1,3-Dihidrofuro[3,4-*c*]piridin-6-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1*R*)-1-(4-[(3,4-Dihidro-2*H*-pirano[2,3-*c*]piridin-6-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

7-[(1-(4,9-Diokso-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-1-il)metil]-4-piperidinil}amino}metil)-2,3-dihidro-1,4-benzodioksin-5-karbonitrila;

1-(4-[(3-Okso-3,4-dihidro-2*H*-1,4-benzotiazin-6-il)metil]amino)-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1*R*)-1-(4-[(1,3-Oksatiolo[5,4-*c*]piridin-6-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8*a*-triazacenaftilen-3,8-diona;

(1*R*)-1-(4-[(2,3-Dihidro-1,4-oksatiino[2,3-*c*]piridin-7-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8*a*-triazacenaftilen-3,8-diona;

(1*R*)-1-(4-[(2,3-Dihidro-1,4-dioksino[2,3-*c*]piridin-7-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8*a*-triazacenaftilen-3,8-diona;

(2*R*)-2-(4-[(1,3-Oksatiolo[5,4-*c*]piridin-6-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8*a*-triazacenaftilen-3,8-diona;

(2*S*)-2-(4-[(1,3-Oksatiolo[5,4-*c*]piridin-6-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8*a*-triazacenaftilen-3,8-diona;

2-(4-[(1,3-Oksatiolo[5,4-*c*]piridin-6-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8*a*-triazacenaftilen-3,8-diona;

(2*R*)-2-(4-[(2,3-Dihidro-1,4-oksatiino[2,3-*c*]piridin-7-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8*a*-triazacenaftilen-3,8-diona;

2-(4-[(2,3-Dihidro-1,4-oksatiino[2,3-*c*]piridin-7-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8*a*-triazacenaftilen-3,8-diona;

(2*S*)-2-(4-[(2,3-Dihidro-1,4-oksatiino[2,3-*c*]piridin-7-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8*a*-triazacenaftilen-3,8-diona;

2-(4-[(2,3-Dihidro-1,4-dioksino[2,3-*c*]piridin-7-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8*a*-triazacenaftilen-3,8-diona;

(1*R*)-1-(4-[(2,3-Dihidro-1,4-oksatiino[2,3-*c*]piridin-7-ilmetil)amino]-4-metil-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1*R*)-1-(4-Metil-4-[(1,3-Oksatiolo[5,4-*c*]piridin-6-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(2*R*)-2-(4-[(2,1,3-Benzotiadiazol-5-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8*a*-triazacenaftilen-3,8-diona;

(2*R*)-2-[(4-[(7-Fluor-2,3-dihidro-1,4-benzodioksin-6-il)metil]amino)-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8*a*-triazacenaftilen-3,8-diona;

(2*R*)-2-(4-[(3,4-Dihidro-2*H*-[1,4]oksatiopino[2,3-*c*]piridin-8-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8*a*-triazacenaftilen-3,8-diona;

(2*R*)-2-(4-[(1,3-Oksatiolo[4,5-*c*]piridin-6-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8*a*-triazacenaftilen-3,8-diona;

(2*R*)-2-[(4-[(3-Okso-3,4-dihidro-2*H*-pirido[3,2-*b*][1,4]tiazin-6-il)metil]amino)-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8*a*-triazacenaftilen-3,8-diona;

(1*R*)-1-(4-[(2,3-Dihidro-1,4-benzodioksin-6-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1R)-1-[(4-{[(8-Fluor-2,3-dihidro-1,4-benzodioksin-6-il)metil]amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1R)-1-[(4-{[(7-Klor-3-okso-3,4-dihidro-2*H*-pirido[3,2-*b*][1,4]oksazin-6-il)metil]amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

5 (1R)-1-[(4-{[(4-Klor-7-okso-6,7-dihidro-1*H*-pirimido[5,4-*b*][1,4]oksazin-2-il)metil]amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1R)-1-[(4-{[(7-Okso-6,7-dihidro-1*H*-pirimido[5,4-*b*][1,4]tiazin-2-il)metil]amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

10 (1R)-1-[(4-{(1,2,3-Benzotiadiazol-5-ilmetil)amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1R)-1-[(4-{(2,3-Dihidro-1-benzofuran-5-ilmetil)amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1R)-1-[(4-{(3,4-Dihidro-2*H*-pirano[2,3-*c*]piridin-6-ilmetil)amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8a-triazaacenaftilen-3,8-diona;

15 (1R)-1-[(4-{(2,3-Dihidrofuro[2,3-*c*]piridin-5-ilmetil)amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8a-triazaacenaftilen-3,8-diona;

(2R)-2-[(4-{(2,3-Dihidro-1,4-benzodioksin-6-ilmetil)amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8a-triazaacenaftilen-3,8-diona;

20 (2R)-2-[(4-{[(8-Fluor-2,3-dihidro-1,4-benzodioksin-6-il)metil]amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8a-triazaacenaftilen-3,8-diona;

7-[(1-{[(2R)-3,8-Diokso-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8a-triazaacenaftilen-2-*i*]metil}-4-piperidinil)amino]metil]-2,3-dihidro-1,4-benzodioksin-5-karbonitrila;

(2R)-2-[(4-{(2,3-Dihidrofuro[2,3-*c*]piridin-5-ilmetil)amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8a-triazaacenaftilen-3,8-diona;

25 (1R)-1-[(4-{(2,3-Dihidro-1,4-benzodioksin-6-ilmetil)amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8a-triazaacenaftilen-3,8-diona;

(1R)-1-[(4-{(1,2,5-Tiadiazolo[3,4-*b*]piridin-6-ilmetil)amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

30 (1R)-1-[(4-{[(4-Fluor-1*H*-benzimidazol-2-il)metil]amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1R)-1-[(2*S*)-2-[(1,3-Oksatiolo[5,4-*c*]piridin-6-ilmetil)amino]metil]-4-morpholinil)metil]-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1R)-1-[(2*S*)-2-[(7-Klor-3-okso-3,4-dihidro-2*H*-pirido[3,2-*b*][1,4]oksazin-6-il)metil]amino}metil]-4-morpholinil)metil]-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

35 (2R)-2-[(4-{(1,2,5-Tiadiazolo[3,4-*b*]piridin-6-ilmetil)amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8a-triazaacenaftilen-3,8-diona;

(1R)-1-[(4-{(3,4-Dihidro-2*H*-kromen-7-ilmetil)amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

40 (1R)-1-[(4-{(2,3-Dihidro-1-benzofuran-6-ilmetil)amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1R)-1-[(4-{(3,4-Dihidro-2*H*-kromen-6-ilmetil)amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(2R)-2-[(4-{[(5-Fluor-2,3-dihidro-1,4-benzodioksin-6-il)metil]amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8a-triazaacenaftilen-3,8-diona;

45 (1R)-1-[(2*S*)-2-[(7-Fluor-2,3-dihidro-1,4-benzodioksin-6-il)metil]amino}metil]-4-morpholinil)metil]-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1R)-1-[(3*S*)-3-[(1,3-Oksatiolo[5,4-*c*]piridin-6-ilmetil)amino]metil]-1-pirolidinil)metil]-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

7-[(1-{[(1R)-3,8-Diokso-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8a-triazaacenaftilen-1-*i*]metil}-4-piperidinil)amino]metil]-2,3-dihidro-1,4-benzodioksin-5-karbonitrila;

50 (1R)-1-[(4-{[(7-Fluor-2,3-dihidro-1,4-benzodioksin-6-il)metil]amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8a-triazaacenaftilen-3,8-diona;

(1R)-1-[(4-{[(8-Fluor-2,3-dihidro-1,4-benzodioksin-6-il)metil]amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8a-triazaacenaftilen-3,8-diona;

55 (1R)-1-[(4-{[(2-Okso-2*H*-kromen-7-il)metil]amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1R)-1-[(4-{[(7-Klor-3,4-dihidro-2*H*-pirido[3,2-*b*][1,4]oksazin-6-il)metil]amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

(1R)-1-[(4-{[(7-Klor-3,4-dihidro-2*H*-pirido[3,2-*b*][1,4]tiazin-6-il)metil]amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

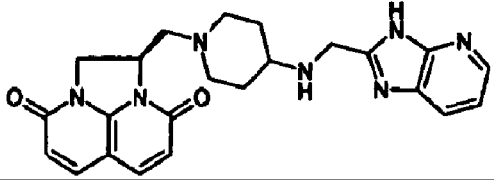
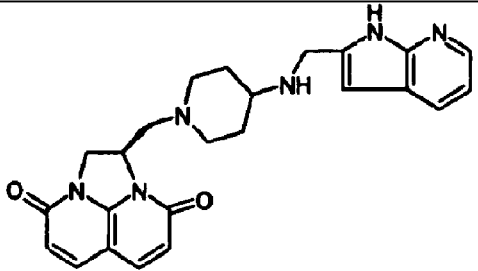
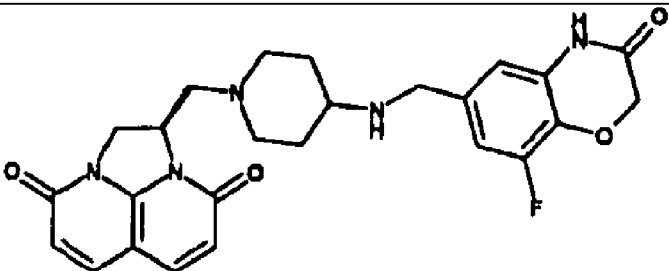
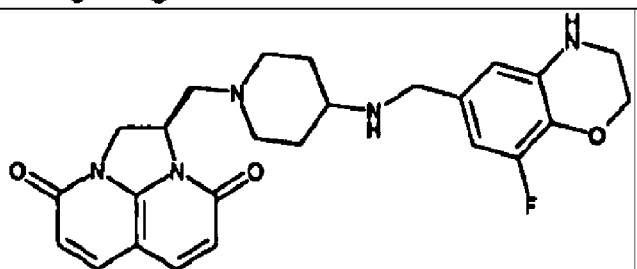
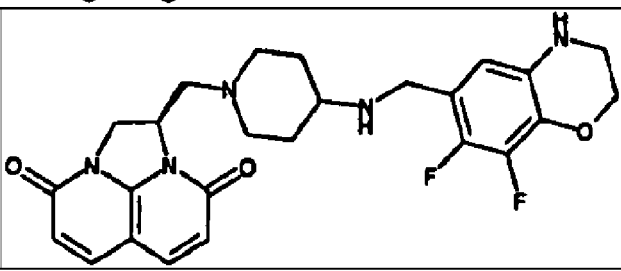
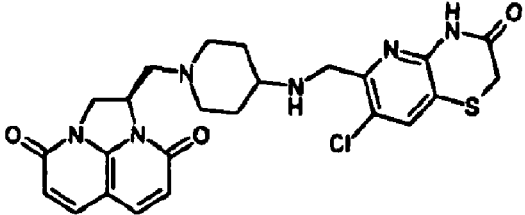
60 (1R)-1-[(4-{(3,4-Dihidro-2*H*-pirido[3,2-*b*][1,4]tiazin-6-ilmetil)amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

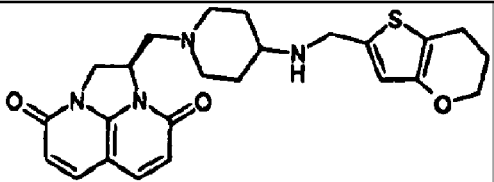
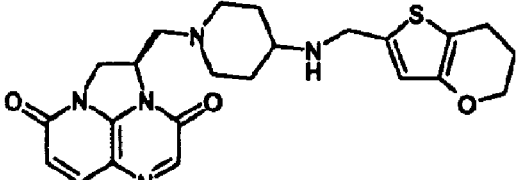
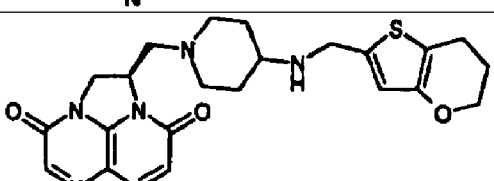
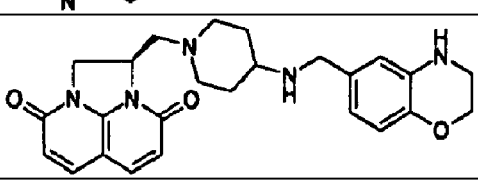
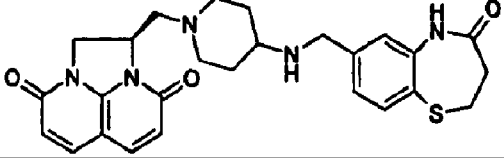
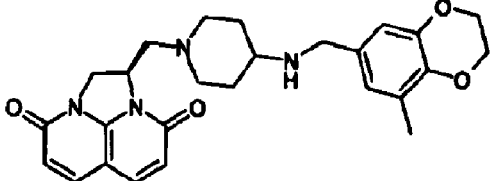
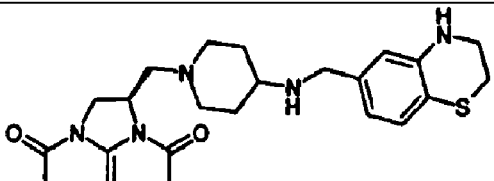
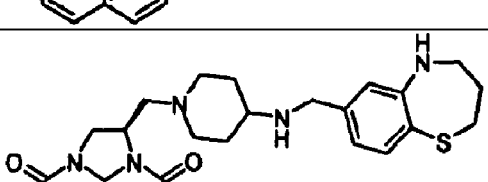
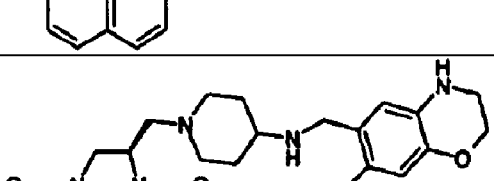
1-[(4-{[(2,3-Dihidro-1,4-oksatiino[2,3-*c*]piridin-7-il)metil]amino}-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

1-({4-[(1,3-Oksatiolo[5,4-*c*]piridin-6-il)metil]amino}-1-piperidinil)metil)-1,2-dihidro-4*H*,9*H*-imidazo[1,2,3-*ij*]-1,8-naftiridin-4,9-diona;

5

ili slobodne baze spojeva iz Tablice 1:

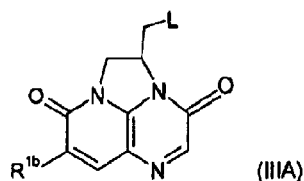
Struktura







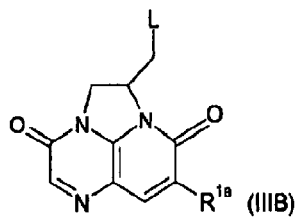
ili njihovih farmaceutske prihvatljivih soli.

10. Spoj, **naznačen time** što je (2*R*)-2-({4-[(3,4-dihidro-2*H*-pirano[2,3-*c*]piridin-6-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8*a*-triazacenaftilen-3,8-dion, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol.

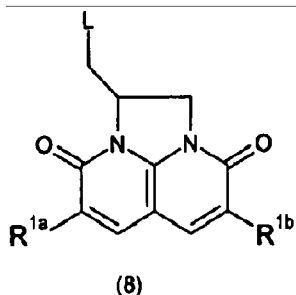
11. Spoj, **naznačen time** što je (2*R*)-2-({4-[(3,4-dihidro-2*H*-pirano[2,3-*c*]piridin-6-ilmetil)amino]-1-piperidinil}metil)-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8*a*-triazacenaftilen-3,8-dion-hidroklorid.
12. Upotreba spoja u skladu s bilo kojim od zahtjeva 1 do 11, **naznačena time** što je navedeni spoj namijenjen proizvodnji medikamenta namijenjenog upotrebi u liječenju bakterijskih infekcija kod sisavaca.
- 5 13. Upotreba u skladu s patentnim zahtjevom 12, **naznačena time** što je navedeni spoj namijenjen liječenju infekcija gornjeg i/ili donjeg dišnog sustava, infekcija kože i mekih tkiva, infekcije mokraćnog sustava i/ili tuberkuloze.
14. Upotreba spoja u skladu s patentnim zahtjevom 10 ili 11, **naznačena time** što je navedeni spoj namijenjen proizvodnji medikamenta namijenjenog upotrebi u liječenju bakterijskih infekcija kod sisavaca, gdje bakterijsku infekciju uzrokuje Gram-pozitivni organizam, kojeg se bira između bakterija *Staphylococcus aureus*, *Streptococcus pneumoniae*, *Streptococcus pyogenes*, *Enterococcus faecalis* i *Enterococcus faecium*; ili Gram-negativni organizam, kojeg se bira između bakterija *Haemophilus influenzae*, *Moraxella catarrhalis*, *Escherichia coli*, *Pseudomonas aeruginosa*, *Proteus mirabilis*, *Enterobacter cloacae*, *Enterobacter aerogenes*, *Klebsiella pneumoniae* i *Stenotrophomonas maltophilia*; ili *Mycobacterium tuberculosis*.
- 10 15. Spoj u skladu s bilo kojim od zahtjeva 1 do 11, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi u terapiji.
16. Spoj u skladu s bilo kojim od zahtjeva 1 do 11, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi u liječenju bakterijskih infekcija kod sisavaca.
17. Farmaceutski pripravak, **naznačen time** što sadrži spoj u skladu s bilo kojim od zahtjeva 1 do 9 i farmaceutski prihvatljivu podlogu.
18. Farmaceutski pripravak, **naznačen time** što sadrži spoj u skladu s patentnim zahtjevom 10 ili 11 i farmaceutski prihvatljivu podlogu.
- 20 19. Spoj formule (IIIA):



formule (IIIB):



ili formule (8)



naznačen time što L je -A-N(R²⁰)R²¹, gdje R²⁰ je vodik, R²¹ je R² ili skupina koju se može prevesti u istu, a A, R², R^{1a} i R^{1b} su kao što je definirano u patentnom zahtjevu 1.

20. Spoj, **naznačen time** što je (2*R*)-2-[(4-amino-1-piperidinil)metil]-1,2-dihidro-3*H*,8*H*-2*a*,5,8*a*-triazacenaftilen-3,8-dion.