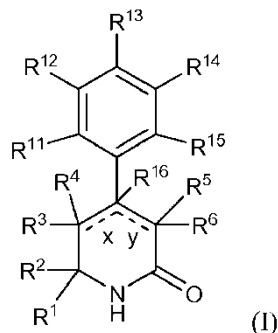


## PATENTNI ZAHTJEVI

## 1. Spoj formule (I):



5 ili njegov stereoisomer, tautomer, farmaceutski prihvatljiva sol ili solvat, u kojem:

--- označava jednogubu ili dvogubu vezu;

x i y oba mogu biti jednoguba veza; kada je x dvoguba veza, tada je y jednoguba veza i R<sup>4</sup> i R<sup>16</sup> su odsutni; kada je y dvoguba veza, tada je x jednoguba veza i R<sup>5</sup> i R<sup>16</sup> su odsutni;

10 R<sup>1</sup> je nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od: -CONH(C<sub>4-18</sub> alkil), -CONHC<sub>2-8</sub> haloalkil, -CONH(CH<sub>2</sub>)<sub>1-8</sub>Ph, -CONHCH<sub>2</sub>COC<sub>2-8</sub> alkil, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-(C<sub>3-10</sub> karbociklus supstituiran sa 0-2 R<sup>b</sup> i 0-2 R<sup>e</sup>), -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-(5-do 6-člani heteroaril koji sadrži: atome ugljika i 1-4 heteroatoma izabrana od N, NR<sup>e</sup>, O i S; pri čemu je navedeni heteroaril supstituiran sa 0-1 R<sup>b</sup> i 0-2 R<sup>e</sup>), i C<sub>1-12</sub> ugljikovodični lanac supstituiran sa 0-3 R<sup>a</sup>; pri čemu navedeni ugljikovodični lanac može biti linearan ili razgranat, zasićen ili nezasićen;

15 R<sup>2</sup> je nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od: C<sub>1-4</sub> alkil, C<sub>3-4</sub> cikloalkil i C<sub>1-4</sub> haloalkil;

R<sup>3</sup> je nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od: H, F, Cl, C<sub>1-4</sub> alkil i CN;

R<sup>4</sup> i R<sup>5</sup> nezavisno su izabrani iz grupe koja se sastoji od: H, F, Cl i C<sub>1-4</sub> alkil;

kada je x jednoguba veza, R<sup>3</sup> i R<sup>4</sup> mogu biti kombinirani sa atomom ugljika za koji su vezani tako da formiraju 3- do 6-člani karbociklus;

20 R<sup>6</sup> je nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od: H, halo, C<sub>1-4</sub> alkil, NO<sub>2</sub>, R<sup>c</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-(X)<sub>t</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>R<sup>c</sup>, NH<sub>2</sub>, -CONH(C<sub>1-6</sub> alkil), -NHCOX<sub>1</sub>SO<sub>2</sub>R<sup>j</sup>, -NHCOCH<sub>2</sub>PO(OEt)<sub>2</sub>, -NHCOCOR<sup>j</sup>, -NHCOCH(OH)R<sup>j</sup>, -NHCOCH<sub>2</sub>COR<sup>j</sup>, -NHCONHR<sup>j</sup> i -OCONR<sup>j</sup>R<sup>j</sup>;

X je nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od: O, S, NH, CONH i NHCO;

X<sub>1</sub> je nezavisno C<sub>1-4</sub> ugljikovodični lanac izborno supstituiran sa C<sub>1-4</sub> alkil ili C<sub>3-4</sub> cikloalkil;

25 kada je y jednoguba veza, R<sup>5</sup> i R<sup>6</sup> mogu biti kombinirani sa atomom ugljika za koji su vezani tako da formiraju 3- do 6-člani karbociklus;

R<sup>11</sup>, R<sup>12</sup>, R<sup>13</sup>, R<sup>14</sup> i R<sup>15</sup> nezavisno su izabrani iz grupe koja se sastoji od: H, halo, C<sub>1-4</sub> alkil supstituiran sa 0-2 R<sup>i</sup>, C<sub>1-4</sub> alkoksi, C<sub>1-4</sub> haloalkil, C<sub>1-4</sub> haloalkoksi, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-C<sub>3-6</sub> cikloalkil, CN, NR<sup>f</sup>R<sup>j</sup>, OR<sup>j</sup>, SR<sup>j</sup>, NHCO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkil), NHSO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkil) i 4- do 6-člani heterociklus koji sadrži: atome ugljika i 1-4 heteroatoma izabrana od N, NR<sup>e</sup>, O i S;

30 alternativno, R<sup>11</sup> i R<sup>12</sup>, zajedno sa atomima ugljika za koje su vezani, kombiniraju se tako da formiraju 5- do 6-člani karbociklični prsten ili 5- do 6-člani heterociklični prsten koji sadrži: atome ugljika i 1-3 heteroatoma izabrana od N, NR<sup>e</sup>, O i S;

alternativno, R<sup>12</sup> i R<sup>13</sup>, zajedno sa atomima ugljika za koje su vezani, kombiniraju se tako da formiraju 5- do 6-člani karbociklični prsten ili 5- do 6-člani heterociklični prsten koji sadrži: atome ugljika i 1-3 heteroatoma izabrana od N, NR<sup>e</sup>, O i S;

35 R<sup>16</sup> je nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od: H i C<sub>1-4</sub> alkil;

R<sup>a</sup> je, u svakom slučaju, nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od: halo, OH, C<sub>1-6</sub> alkoksi, C<sub>1-6</sub> haloalkil, C<sub>1-6</sub> haloalkoksi, N(C<sub>1-4</sub> alkil)<sub>2</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-(X)<sub>t</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>R<sup>c</sup> i -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-(CH<sub>2</sub>O)<sub>m</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>R<sup>f</sup>;

40 R<sup>b</sup> je, u svakom slučaju, nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od: halo, OH, C<sub>1-10</sub> alkil, C<sub>1-10</sub> alkoksi, C<sub>1-10</sub> haloalkil, C<sub>1-10</sub> haloalkoksi, C<sub>1-10</sub> alkiltio, C<sub>1-10</sub> haloalkiltio, N(C<sub>1-4</sub> alkil)<sub>2</sub>, -CONH(CH<sub>2</sub>)<sub>4-20</sub>H, -O(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>O(C<sub>1-6</sub> alkil), R<sup>c</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-(X)<sub>t</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>R<sup>c</sup> i -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-(CH<sub>2</sub>O)<sub>m</sub>-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>R<sup>f</sup>;

R<sup>c</sup> je, u svakom slučaju, nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od: C<sub>3-6</sub> cikloalkila supstituiranog sa 0-2 R<sup>d</sup>, C<sub>3-6</sub> cikloalkenila supstituiranog sa 0-2 R<sup>d</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-(fenila supstituiranog sa 0-3 R<sup>d</sup>) i 5- do 6-članog heterociklusa koji sadrži: atome ugljika i 1-4 heteroatoma izabranih od N, NR<sup>e</sup>, O i S; pri čemu je navedeni heterociklus supstituiran sa 0-2 R<sup>d</sup>;

45 R<sup>d</sup> je, u svakom slučaju, nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od: halo, OH, CN, NO<sub>2</sub>, C<sub>1-4</sub> alkil, C<sub>1-4</sub> alkoksi, C<sub>1-4</sub> haloalkil, C<sub>1-4</sub> haloalkoksi, tetrazolil, OBn i fenil supstituiranog sa 0-2 R<sup>h</sup>;

$R^e$  je, u svakom slučaju, nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od: H,  $C_{1-8}$  alkil,  $C_{1-8}$  haloalkil, benzil izbornu supstituiranog sa  $C_{1-4}$  alkoksi,  $CO(C_{1-4}$  alkil) i COBn;

$R^f$  je, u svakom slučaju, nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od: H i  $C_{1-4}$  alkil;

$R^g$ ,  $R^h$  i  $R^i$  su, u svakom slučaju, nezavisno izabrani iz grupe koja se sastoji od: halo,  $C_{1-4}$  alkil,  $C_{1-4}$  alkoksi,  $C_{1-4}$  haloalkil i  $C_{1-4}$  haloalkoksi;

RJ je, u svakom slučaju, nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od:  $C_{1-4}$  alkil,  $C_{3-4}$  cikloalkil i fenil;

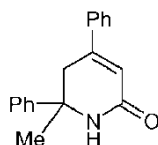
n, u svakom slučaju, je nezavisno 0 ili 1;

m, u svakom slučaju, je nezavisno 0, 1, 2, 3 ili 4

s, u svakom slučaju, je nezavisno 1, 2 ili 3; i

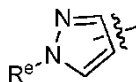
t, u svakom slučaju, je nezavisno 0 ili 1;

uz uvjet da je slijedeći spoj isključen:



2. Spoj prema patentnom zahtjevu 1, u kojem:

$R^1$  je nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od:  $-CONHC_{4-18}$  alkil,  $-CONH(CH_2)_{1-8}$  Ph,  $C_{1-12}$  alkil supstituiran sa 0-2  $R^a$ ,  $C_{1-12}$  alkenil supstituiran sa 0-2  $R^a$ ,  $C_{1-12}$  alkinil supstituiran sa 0-2  $R^a$ ,  $-(CH_2)_m$ - (fenil supstituiran sa 0-1  $R^b$  i 0-2  $R^g$ ),  $-(CH_2)_m$ - ( $C_{3-6}$  cikloalkil supstituiran sa 0-1  $R^b$ ) i  $-(CH_2)_m$ - (5- do 6-člani heteroaril supstituiran sa 0-1  $R^b$  i 0-2  $R^g$ ), pri čemu je navedeni heteroaril izabran od: piridil, oksazolil, tiazolil i



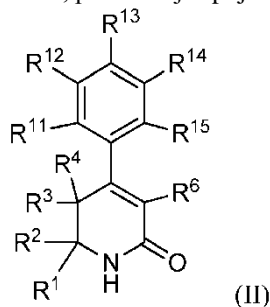
3. Spoj prema patentnom zahtjevu 1 ili patentnom zahtjevu 2, u kojem:

$R^{11}$  i  $R^{15}$  nezavisno su izabrani iz grupe koja se sastoji od: H,  $C_{1-4}$  alkil i halo;

$R^{12}$  i  $R^{14}$  nezavisno su izabrani iz grupe koja se sastoji od: H, halo,  $C_{1-4}$  alkil i  $C_{1-4}$  alkoksi; i

$R^{13}$  je nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od: H, halo,  $C_{1-4}$  alkil supstituiran sa 0-1  $R^i$ ,  $C_{1-4}$  alkoksi,  $C_{1-4}$  haloalkil,  $C_{1-4}$  haloalkoksi,  $-(CH_2)_m$ -  $C_{3-4}$  cikloalkil, CN,  $NR^j$ ,  $SR^j$ ,  $NHCO_2(C_{1-4}$  alkil),  $NHSO_2(C_{1-4}$  alkil), i 4- do 6-člani heterociklus koji sadrži: atome ugljika i 1-4 heteroatoma izabrana od N,  $NR^e$ , O i S.

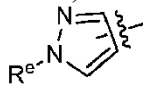
4. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 3, pri čemu je spoj formule (II):



ili njegov stereoisomer, tautomer, farmaceutski prihvatljiva sol ili solvat.

5. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 4, u kojem:

$R^1$  je nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od:  $C_{1-6}$  alkil,  $C_{3-6}$  cikloalkil,  $-CONHC_{4-18}$  alkil,  $-CONHC_{2-8}$  haloalkil,  $-CONH(CH_2)_{1-8}$  Ph,  $-(CH_2)_m$ - (fenil supstituiran sa 1  $R^b$  i 0-2  $R^g$ ), i 5- do 6-člani heteroaril supstituiran sa 0-1  $R^b$  i 0-2  $R^g$ , pri čemu je navedeni heteroaril izabran od: piridil, oksazolil, tiazolil i



$R^2$  je nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od:  $C_{1-4}$  alkil i  $C_{1-4}$  haloalkil;

$R^3$  je nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od: H i F;

$R^4$  je nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od: H i F;

$R^6$  je nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od:  $NH_2$ ,  $-CONH(C_{1-6}$  alkil),  $R^c$ ,  $-(CH_2)_n$ -  $(X)_t$ -  $(CH_2)_m$ -  $R^c$ ,  $-NHCO(CH_2)_2SO_2(C_{1-4}$  alkil),  $-NHCOCH_2PO(OEt)_2$ ,  $-NHCOCO(C_{1-4}$  alkil),  $-NHCOCH(OH)(C_{1-4}$  alkil),  $-NHCOCH_2CO(C_{1-4}$  alkil),  $-NHCONH(C_{1-4}$  alkil), i  $-OCONH(C_{1-4}$  alkil);

$R^{11}$  i  $R^{15}$  nezavisno su izabrani iz grupe koja se sastoji od: H,  $C_{1-4}$  alkil i halo;

$R^{12}$  i  $R^{14}$  nezavisno su izabrani iz grupe koja se sastoji od: H, halo,  $C_{1-4}$  alkil i  $C_{1-4}$  alkoksi;

$R^{13}$  je nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od: H, halo,  $C_{1-4}$  alkil supstituiran sa 0-1  $C_{1-4}$  alkoksi,  $C_{1-4}$  haloalkil,  $C_{1-4}$  haloalkoksi,  $-(CH_2)_m-C_{3-4}$  cikloalkil, CN,  $N(C_{1-4} \text{ alkil})_2$ ,  $NHCO_2(C_{1-4} \text{ alkil})$ ,  $NHSO_2(C_{1-4} \text{ alkil})$ , pirazolil i morfolinil;

alternativno,  $R^{12}$  i  $R^{13}$ , zajedno sa atomima ugljika za koje su vezani, kombiniraju se tako da formiraju 5- do 6-člani karbociklični prsten ili 5- do 6-člani heterociklični prsten koji sadrži: atome ugljika i 1-3 heteroatoma izabrana od N,  $NR^e$ , O i S;

$R^b$  je, u svakom slučaju, nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od: halo, OH,  $C_{1-8}$  alkil,  $C_{1-8}$  alkoksi,  $C_{1-8}$  haloalkil,  $C_{1-10}$  haloalkoksi,  $-O(CH_2)_sO(C_{1-6} \text{ alkil})$ ,  $N(C_{1-4} \text{ alkil})_2$ ,  $-CONH(CH_2)_{6-20}H$ ,  $-(CH_2)_m(C_{3-6} \text{ cikloalkil})$ ,  $-(CH_2)_m(C_{4-6} \text{ cikloalkenil})$ ,  $-O(CH_2)_m(C_{3-6} \text{ cikloalkil})$ , 4- $C_{1-4}$  alkoksi-Ph,  $-O(CH_2)_mPh$ , morfolinil, piridil, 2- $C_{1-4}$  alkoksi-piridin-5-il, pirimidinil, pirazinil i -O-pirimidinil;

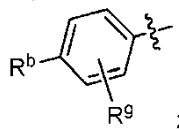
$R^g$  je, u svakom slučaju, nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od: halo,  $C_{1-4}$  alkil,  $C_{1-4}$  alkoksi,  $C_{1-4}$  haloalkil i  $C_{1-4}$  haloalkoksi;

m, u svakom slučaju, je nezavisno 0, 1, 2 ili 3; i

s, u svakom slučaju, je nezavisno 1, 2 ili 3.

6. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 5, u kojem:

$R^1$  je nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od:  $C_{1-6}$  alkil,  $-CONHC_{4-18}$  alkil,  $-CONH(CH_2)_{1-8}Ph$ , i



$R^6$  je nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od:  $NH_2$ ,  $-CONH(C_{1-6} \text{ alkil})$ ,  $-NHCOCH_2PO(OEt)_2$ ,  $-NHCO(CH_2)SO_2(C_{1-4} \text{ alkil})$ ,  $R^c$ ,  $OR^c$ ,  $-CONHR^c$  i  $-NHCOR^c$ ;

$R^{12}$  je nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od: H, halo,  $C_{1-4}$  alkil i  $C_{1-4}$  alkoksi;

$R^{13}$  je nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od: H, halo,  $C_{1-4}$  alkil supstituiran sa 0-1  $C_{1-4}$  alkoksi,  $C_{1-4}$  haloalkil,  $C_{1-4}$  haloalkoksi,  $-(CH_2)_m-C_{3-4}$  cikloalkil, CN,  $N(C_{1-4} \text{ alkil})_2$ ,  $NHCO_2(C_{1-4} \text{ alkil})$ ,  $NHSO_2(C_{1-4} \text{ alkil})$ , pirazolil i morfolinil;

alternativno,  $R^{12}$  i  $R^{13}$ , zajedno sa atomima ugljika za koje su vezani, kombiniraju se tako da formiraju 5- do 6-člani karbociklični prsten ili 5- do 6-člani zasićeni heterociklični prsten koji sadrži: atome ugljika i 1-2 atoma kisika;

$R^{14}$  je nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od: H i  $C_{1-4}$  alkoksi;

$R^b$  je, u svakom slučaju, nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od: halo,  $C_{1-6}$  alkil,  $C_{1-6}$  alkoksi,  $C_{1-6}$  haloalkil,  $C_{1-10}$  haloalkoksi,  $-O(CH_2)_sO(C_{1-6} \text{ alkil})$ ,  $-CONH(CH_2)_{6-20}H$ ,  $-(CH_2)_m(C_{3-6} \text{ cikloalkil})$ ,  $-(CH_2)_m(C_{4-6} \text{ cikloalkenil})$ ,  $-O(CH_2)_m(C_{3-6} \text{ cikloalkil})$ , fenoksi, benzoksi, morfolinil, 2- $C_{1-4}$  alkoksi-piridin-5-il, pirimidin-5-il, pirazin-2-il i -O-pirimidinil; i

$R^c$  je, u svakom slučaju, nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od:  $C_{3-6}$  cikloalkil supstituiran sa 0-2  $R^d$ ,  $-(CH_2)_m$  (fenil supstituiran sa 0-3  $R^d$ ) i heteroaril izabran od: oksazolil, izoksazolil, toazolil, pirazolil, imidazolil, oksadiazolil, triazolil, tetrazolil, piridil i pirazinil; pri čemu je navedeni heteroaril supstituiran sa 0-2  $R^d$ .

7. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1-6, u kojem:

$R^2$  je nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od:  $CF_3$  i Me;

$R^3$  je nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od: H i F;

$R^4$  je nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od: H i F;

$R^6$  je nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od:  $NH_2$ ,  $-CONHMe$ , OPh,  $-CONH(\text{ciklopropil})$ ,  $-CONH(\text{ciklobutil})$ ,  $-CONH(\text{ciklopentil})$ ,  $-CONH(\text{cikloheksil})$ ,  $-CONHPh$ ,  $-CONH(4-F-Ph)$ ,  $-CONH(2-Cl-Ph)$ ,  $-CONH(4-Cl-Ph)$ ,  $-CONH(4-Me-Ph)$ ,  $-CONH(4-OH-Ph)$ ,  $-CONH(3-OMe-Ph)$ ,  $-CONH(4-OMe-Ph)$ ,  $-CONH(4-CF_3-Ph)$ ,  $-CONH(4-OCF_3-Ph)$ ,  $-CONH(1-Me-pirazol-3-il)$ ,  $-CONH(4-(1H-tetrazol-2-il)-Ph)$ ,  $-CONH(4-(2H-tetrazol-5-il)-Ph)$ ,  $-CONH(3-F-4-Me-Ph)$ ,  $-CONH(3-F-4-OMe-Ph)$ ,  $-CONH(CH_2)_2Ph$ ,  $-CONH(5-OMe-pirid-2-il)$ ,  $-CONH(6-OMe-pirid-3-il)$ ,  $-CONH(5-OMe-pirazin-2-il)$ ,  $-CONH(6-OMe-piridazin-3-il)$ ,  $NHCO(CH_2)SO_2Me$ ,  $-NHCOPh$ ,  $-NHCO(2-Me-Ph)$ ,  $-NHCO(3-Me-Ph)$ ,  $-NHCO(4-Me-Ph)$ ,  $-NHCO(2-Cl-Ph)$ ,  $-NHCO(3-Cl-Ph)$ ,  $-NHCO(2-Cl-4-F-Ph)$ ,  $-NHCO(2-Cl-5-F-Ph)$ ,  $-NHCO(\text{izoksazol-5-il})$ ,  $-NHCO(3-Me-izoksazol-5-il)$ ,  $-NHCO(4-Me-izoksazol-5-il)$ ,  $-NHCO(3-OMe-izoksazol-5-il)$ ,  $-NHCO(3-Br-izoksazol-5-il)$ ,  $-NHCO(3-(2-Cl-Ph)-izoksazol-5-il)$ ,  $-NHCO(3-(3-F-Ph)-izoksazol-5-il)$ ,  $-NHCO(3-OBn-izoksazol-5-il)$ ,  $1H$ -imidazol-1-il,  $-NHCO(5-Me-1,3,4\text{-oksadiazol-2-il})$ ,  $-NHCO(1-Me-1,2,3\text{-triazol-4-il})$ ,  $-NHCO(6-OMe-pirid-3-il)$ ,  $-NHCO(6-Cl-piridazin-3-il)$ ,  $5-CF_3-1,3,4\text{-oksadiazol-2-il}$ ,  $1H$ -tetrazol-1-il,  $1H$ -tetrazol-3-il i  $2H$ -tetrazol-5-il;

$R^{11}$  i  $R^{15}$  nezavisno su izabrani iz grupe koja se sastoji od: H, Me, F i Cl;

$R^{12}$  je nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od: H, F, Cl, Me i OMe;

$R^{13}$  je nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od: H, F, Cl, Br, Me, OMe, OEt,  $CH_2OMe$ ,  $CF_3$ ,  $CH_2CF_3$ ,  $OCHF_2$ ,  $OCF_3$ , CN,  $N(Me)_2$ , ciklopropil i ciklopropilmetil;

alternativno,  $R^{12}$  i  $R^{13}$ , zajedno sa atomima ugljika za koje su vezani, kombiniraju se tako da formiraju 5- do 6-člani karbociklični prsten ili 5- do 6-člani zasićeni heterociklični prsten koji sadrži: atome ugljika i 1-2 atoma kisika;

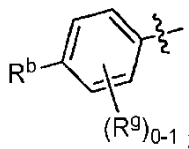
R<sup>14</sup> je H;

R<sup>b</sup> je, u svakom slučaju, nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od: n-pentil, metoksi, n-butoksi, i-butoksi, i-pentoksi, -O(CH<sub>2</sub>)<sub>1-6</sub>CF<sub>3</sub>, -O(CH<sub>2</sub>)<sub>1-4</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CONH(CH<sub>2</sub>)<sub>6-20</sub>H, ciklopropil, ciklopent-1-en-1-il, cikloheks-1-en-1-il, -O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>(ciklopentil), fenoksi, benzoksi, pirimidin-5-il, pirazin-2-il i -O-pirimidin-2-il; i

R<sup>g</sup> je F.

8. Spoj prema patentnom zahtjevu 4 ili patentnom zahtjevu 5, u kojem:

R<sup>1</sup> je



R<sup>2</sup> je nezavisno izabran od CF<sub>3</sub> i CH<sub>3</sub>;

R<sup>6</sup> je nezavisno izabran od: R<sup>c</sup>, -CONHR<sup>c</sup>, -NHCOR<sup>c</sup> i -NHCOCH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>(C<sub>1-4</sub> alkil);

R<sup>b</sup> je nezavisno izabran od: -O(CH<sub>2</sub>)<sub>1-6</sub>CF<sub>3</sub>, -O(CH<sub>2</sub>)<sub>1-4</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CONH(CH<sub>2</sub>)<sub>6-20</sub>H, ciklopent-1-en-1-il, cikloheks-1-en-1-il, -O(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>(ciklopentil), fenoksi, benzoksi, pirimidin-5-il, pirazin-2-il i -O-pirimidin-2-il;

R<sup>c</sup> je, u svakom slučaju, nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od: -(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>-(fenil supstituiran sa 0-3 R<sup>d</sup>), i heteroaril izabran od: oksazolil, izoksazolil, pirazolil, imidazolil, oksadiazolil, triazolil, tetrazolil, piridil i pirazinil; pri čemu je navedeni heteroaril supstituiran sa 0-2 R<sup>d</sup>; i

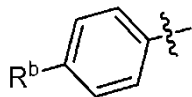
R<sup>d</sup> je, u svakom slučaju, nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od: halo, OH, CN, C<sub>1-4</sub> alkil, C<sub>1-4</sub> alkoksi, C<sub>1-4</sub> haloalkil, C<sub>1-4</sub> haloalkoksi, tetrazolil i OBn.

9. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1-6 ili 8, u kojem:

R<sup>13</sup> je nezavisno izabran iz grupe koja se sastoji od: H, halo, C<sub>1-4</sub> alkil supstituiran sa 0-1 C<sub>1-4</sub> alkoksi, C<sub>1-4</sub> alkoksi, C<sub>1-4</sub> haloalkil, C<sub>1-4</sub> haloalkoksi, CN ili C<sub>3-4</sub> cikloalkil.

10. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1-5, 8 ili 9 u kojem:

R<sup>1</sup> je nezavisno



11. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1-10, u kojem: R<sup>b</sup> je nezavisno izabran od: -O(CH<sub>2</sub>)<sub>1-6</sub>CF<sub>3</sub>, i -O(CH<sub>2</sub>)<sub>1-4</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>.

12. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1-5, u kojem: R<sup>6</sup> je nezavisno 5-člani dušikov heteroaril.

13. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1-12, u kojem: R<sup>6</sup> je nezavisno: 1*H*-imidazol-1-il, 1*H*-tetrazol-1-il, 1*H*-tetrazol-3-il ili 2*H*-tetrazol-5-il.

14. Spoj prema patentnom zahtjevu 1, naznačen time što je spoj izabran od:

3-(1*H*-Tetrazol-5-il)-4-*p*-tolil-6-(4-(4,4,4-trifluorobutoksi)fenil)-6-(trifluorometil)-5,6-dihidropiridin-2(1*H*)-on;

(*S*)-3-(1*H*-Tetrazol-5-il)-4-*p*-tolil-6-(4-(4,4,4-trifluorobutoksi)fenil)-6-(trifluorometil)-5,6-dihidropiridin-2(1*H*)-on;

(*R*)-3-(1*H*-Tetrazol-5-il)-4-*p*-tolil-6-(4-(4,4,4-trifluorobutoksi)fenil)-6-(trifluorometil)-5,6-dihidropiridin-2(1*H*)-on;

*N*-(4-Metoksifenil)-2-okso-4-*p*-tolil-6-(4-(4,4,4-trifluorobutoksi)fenil)-6-(trifluoro-metil)-1,2,5,6-tetrahidropiridin-3-karboksamid;

(*R*)-*N*-(4-Metoksifenil)-2-okso-4-*p*-tolil-6-(4-(4,4,4-trifluorobutoksi)fenil)-6-(trifluoro-metil)-1,2,5,6-tetrahidropiridin-3-karboksamid;

(*S*)-*N*-(4-Metoksifenil)-2-okso-4-*p*-tolil-6-(4-(4,4,4-trifluorobutoksi)fenil)-6-(trifluoro-metil)-1,2,5,6-tetrahidropiridin-3-karboksamid;

(*S*)-3-(2*H*-Tetrazol-5-il)-4-*p*-tolil-6-(4-(6,6,6-trifluoroheksiloksi)fenil)-6-(trifluorometil)-5,6-dihidropiridin-2(1*H*)-on;

3-(2-Etil-2*H*-tetrazol-5-il)-4-*p*-tolil-6-(4-(4,4,4-trifluorobutoksi)fenil)-6-(trifluorometil)-5,6-dihidropiridin-2(1*H*)-on;

4-*p*-Tolil-6-(4-(4,4,4-trifluorobutoksi)fenil)-6-(trifluorometil)-3-(5-(trifluorometil)-1,3,4-oksadiazol-2-il)-5,6-dihidropiridin-2(1*H*)-on;

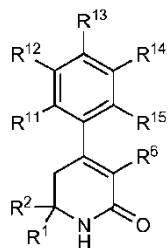
6-Metil-2-okso-4-*p*-tolil-6-(4-(4,4,4-trifluorobutoksi)fenil)-*N*-(4-(trifluorometoksi)-fenil)-1,2,5,6-tetrahidropiridin-3-karboksamid;

3-(2*H*-Tetrazol-5-il)-4-*p*-tolil-6-(trifluorometil)-6-(1-(5,5,5-trifluoropentil)-1*H*-pirazol-4-il)-5,6-dihidropiridin-2(1*H*)-on;

3-Nitro-4-*p*-tolil-6-(4-(4,4,4-trifluorobutoksi)fenil)-6-(trifluorometil)-5,6-dihidropiridin-2(1*H*)-on;

*N*-(4-Metoksifenil)-2-okso-4-*p*-tolil-6-(4-(4,4,4-trifluorobutoksi)fenil)-6-(trifluorometil)piperidin-3-karboksamid;

spojevi formule (IIa)

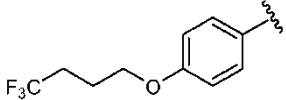
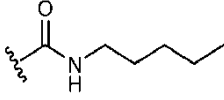
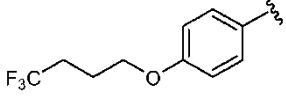
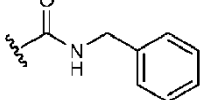
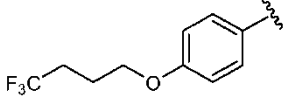
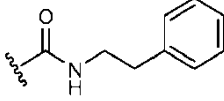
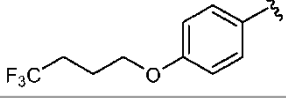
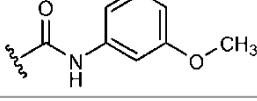
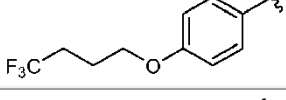
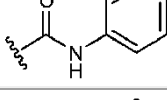
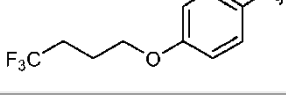
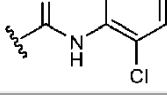
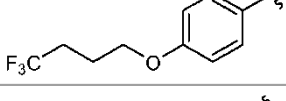
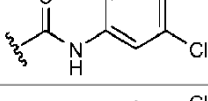
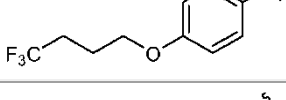
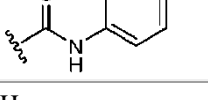
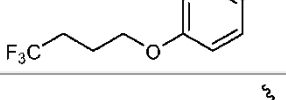
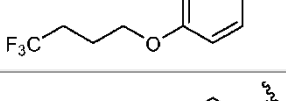
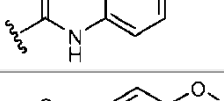
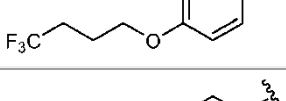
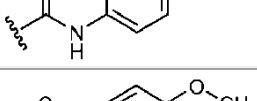
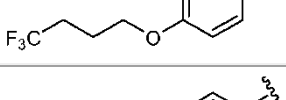
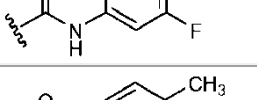
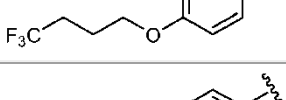
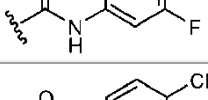
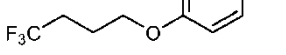
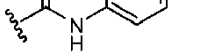


(IIa)

u kojima su  $R^1$ ,  $R^2$  i  $R^6$  supstituenti navedeni u tabeli u daljnjem tekstu, i u kojima  $R^{11}$  do  $R^{15}$  su vodik, osim ukoliko nije drugačije naznačeno u tabeli u daljnjem tekstu:

	$R^1$	$R^2$	$R^6$	$R^{11}-R^{15}$
Rac		$CH_3$		$R^{13} = CH_3$
Rac		$CF_3$		$R^{13} = CH_3$
Rac		$CF_3$		$R^{13} = CH_3$
Rac		$CF_3$		$R^{13} = CH_3$
Rac		$CF_3$		$R^{13} = CH_3$
Rac		$CF_3$		$R^{13} = CH_3$
Rac		$CF_3$		$R^{13} = CH_3$
Rac		$CF_3$		$R^{13} = CH_3$
Rac		$CF_3$		$R^{13} = CH_3$

HR P20161011 T1

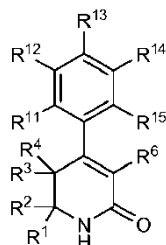
	R <sup>1</sup>	R <sub>2</sub>	R <sub>6</sub>	R <sup>11</sup> -R <sup>15</sup>
Rac		CF <sub>3</sub>		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>	H	R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>

	R <sup>1</sup>	R <sub>2</sub>	R <sub>6</sub>	R <sup>11</sup> -R <sup>15</sup>
Rac S-izomer		CF <sub>3</sub>		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>		R <sup>13</sup> = OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>		R <sup>13</sup> = OCHF <sub>2</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>		R <sup>11</sup> = F R <sup>13</sup> = OCH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>		R <sup>12</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>		All H
Rac		CF <sub>3</sub>		R <sup>13</sup> = CF <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>		R <sup>12</sup> = Cl
Rac		CF <sub>3</sub>		R <sup>12</sup> = OCH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>		R <sup>13</sup> = Cl

*N*<sup>5</sup>-(4-Metoksifenil)-2-metil-6-okso-4-*p*-tolil-*N*<sup>2</sup>-(4,4,4-trifluorobutil)-1,2,3,6-tetrahidropiridin-2,5-dikarboksamid;

*N*-(4-Cijanofenil)-5,5-difluoro-2-okso-4-*p*-tolil-6-(4-(4,4,4-trifluorobutoksi)fenil)-6-(trifluorometil)-1,2,5,6-tetrahidropiridin-3-karboksamid;  
 (*S*)-3-Amino-4-*p*-tolil-6-(4-(4,4,4-trifluorobutoksi)fenil)-6-(trifluorometil)-5,6-dihidropiridin-2(*1H*)-on;  
 (*S*)-2-Metil-*N*-(2-okso-4-*p*-tolil-6-(4-(4,4,4-trifluorobutoksi)fenil)-6-(trifluorometil)-1,2,5,6-tetrahidropiridin-3-il)benzamid;  
 (*S*)-3-fenoksi-4-*p*-tolil-6-(4-(4,4,4-trifluorobutoksi)fenil)-6-(trifluorometil)-5,6-dihidropiridin-2(*1H*)-on; i

spojevi formule (II)



(II)

u kojima  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  i  $R^6$  su susptituenti navedeni u tabeli u daljnjem tekstu, i u kojima  $R^1$  do  $R^{15}$  su vodik, osim ukoliko nije drugačije naznačeno u tabeli u daljnjem tekstu:

	$R^1$	R2	$R^3 = R^6$ $R^4$		$R^{11}-R^{15}$
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		$R^{13} = \text{CH}_3$
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		$R^{13} = \text{CH}_3$
Rac		CF <sub>3</sub>	H		$R^{13} = \text{CH}_3$
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		$R^{13} = \text{CH}_3$
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		$R^{13} = \text{CH}_3$
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		$R^{13} = \text{CH}_3$
Rac		CF <sub>3</sub>	H		$R^{13} = \text{CH}_3$
Rac		CF <sub>3</sub>	H		$R^{13} = \text{CH}_3$

HR P20161011 T1

	R <sup>1</sup>	R <sub>2</sub>	R <sup>3</sup> R <sup>4</sup>	= R <sub>6</sub>	R <sup>11</sup> -R <sup>15</sup>
Rac		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>	F		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>

HR P20161011 T1

	R <sup>1</sup>	R <sub>2</sub>	R <sup>3</sup> R <sup>4</sup>	= R <sub>6</sub>	R <sup>11</sup> -R <sup>15</sup>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>	F		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>	F		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>	F		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>	F		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>	F		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>11</sup> = F R <sup>13</sup> = OCH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = OCH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>11</sup> = CH <sub>3</sub> R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>

HR P20161011 T1

	R <sup>1</sup>	R <sub>2</sub>	R <sup>3</sup> R <sup>4</sup>	= R <sub>6</sub>	R <sup>11</sup> -R <sup>15</sup>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = OCHF <sub>2</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	F		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CH <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>11</sup> = CH <sub>3</sub> R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CH <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>

HR P20161011 T1

	R <sup>1</sup>	R <sub>2</sub>	R <sup>3</sup> R <sup>4</sup>	= R <sub>6</sub>	R <sup>11</sup> -R <sup>15</sup>
Rac		CF <sub>3</sub>	F		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>	F		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>	F		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CH <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = OHCF <sub>2</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = OCH <sub>3</sub>
Rac		CH <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>

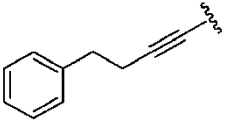
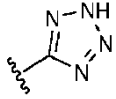
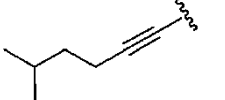
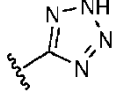
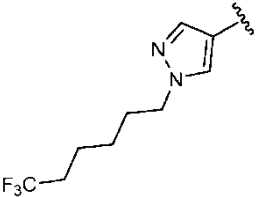
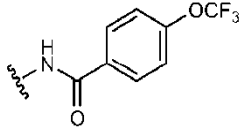
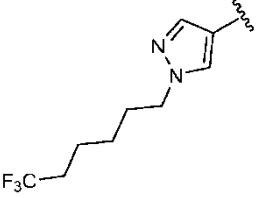
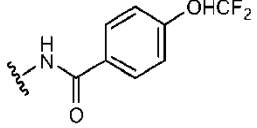
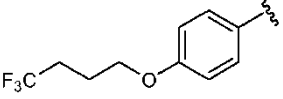
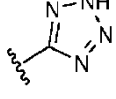
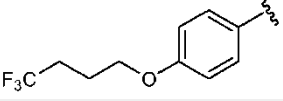
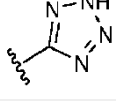
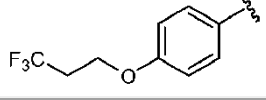
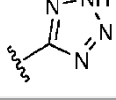
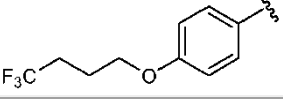
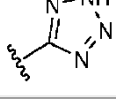
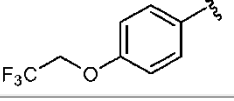
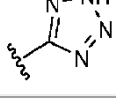
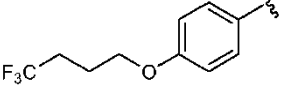
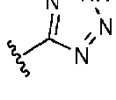
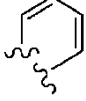
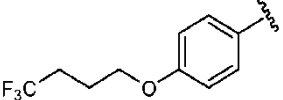
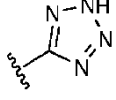


HR P20161011 T1

	R <sup>1</sup>	R <sub>2</sub>	R <sup>3</sup> R <sup>4</sup>	= R <sub>6</sub>	R <sup>11</sup> -R <sup>15</sup>
Rac		CH <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CH <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = OCH <sub>3</sub>
Rac		CH <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>	F		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac izomer	S- 	CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>

HR P20161011 T1

	R <sup>1</sup>	R <sub>2</sub>	R <sup>3</sup> R <sup>4</sup>	= R <sub>6</sub>	R <sup>11</sup> -R <sup>15</sup>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CH <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CH <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CH <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = OCH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
R-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>

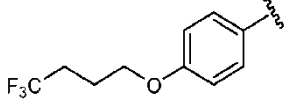
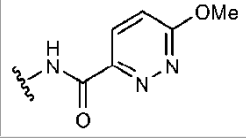
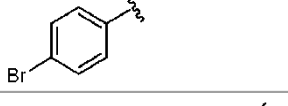
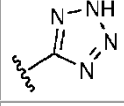
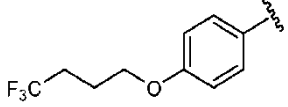
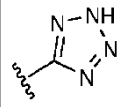
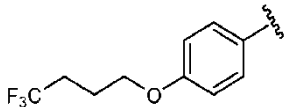
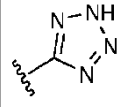

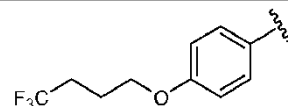
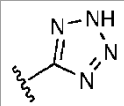
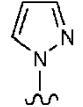
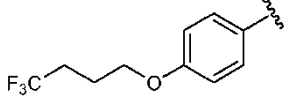
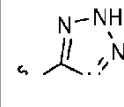
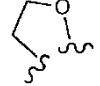
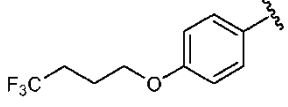
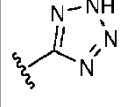

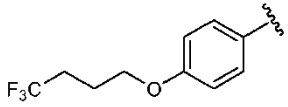
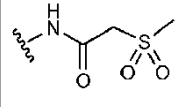
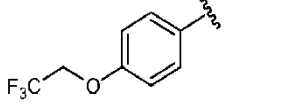
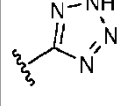
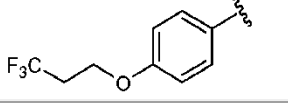
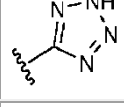
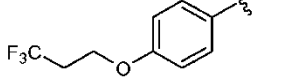
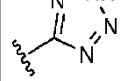
HR P20161011 T1

	R <sup>1</sup>	R <sub>2</sub>	R <sup>3</sup> R <sup>4</sup>	R <sub>6</sub>	R <sup>11</sup> -R <sup>15</sup>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>12</sup> = F R <sup>13</sup> = OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = OCHF <sub>2</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>12</sup> R <sup>13</sup> =
					
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>12</sup> R <sup>13</sup> =

HR P20161011 T1

	R <sup>1</sup>	R <sub>2</sub>	R <sup>3</sup> R <sup>4</sup>	= R <sub>6</sub>	R <sup>11</sup> -R <sup>15</sup>
S-isomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>12</sup> R <sup>13</sup> =
S-isomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>12</sup> R <sup>13</sup> =
S-isomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>11</sup> R <sub>12</sub> =
					R <sup>13</sup> = OCH <sub>3</sub>
S-isomer		CHF <sub>2</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
R-isomer		H	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-isomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>

HR P20161011 T1

	R <sup>1</sup>	R <sub>2</sub>	R <sup>3</sup> R <sup>4</sup>	= R <sub>6</sub>	R <sup>11</sup> -R <sup>15</sup>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = Br
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		 R <sup>13</sup> =
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = 
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H	EMBED ChemDraw.Dokument 	R <sup>12</sup> R <sup>13</sup> = 
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = 
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = OCH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = OCH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = OCF <sub>3</sub>

HR P20161011 T1

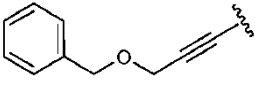
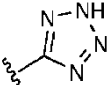
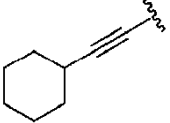
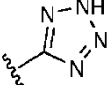
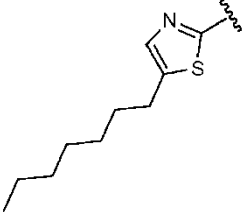
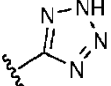
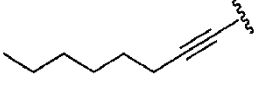
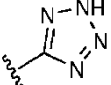
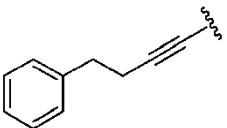
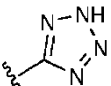
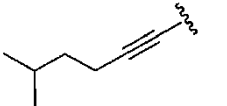
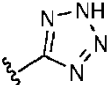
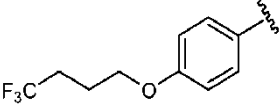
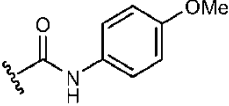
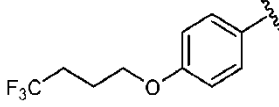
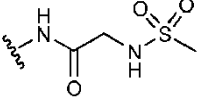
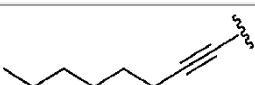
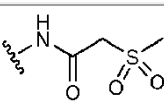
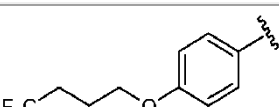
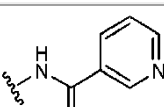

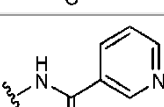
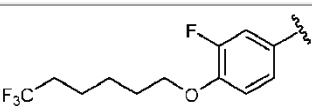
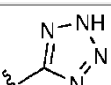
	R <sup>1</sup>	R <sub>2</sub>	R <sup>3</sup> R <sup>4</sup>	= R <sub>6</sub>	R <sup>11</sup> -R <sup>15</sup>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = OCF <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = OCH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = OCHCF <sub>2</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = OCH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = OCHCF <sub>2</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = OCHCF <sub>2</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = OCH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = OCHCF <sub>2</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>

	R <sup>1</sup>	R <sub>2</sub>	R <sup>3</sup> R <sup>4</sup>	= R <sub>6</sub>	R <sup>11</sup> -R <sup>15</sup>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
R-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = OCHF <sub>2</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = OCHF <sub>2</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>12</sup> R <sup>13</sup> = 
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>15</sup> = 

HR P20161011 T1

	R <sup>1</sup>	R <sub>2</sub>	R <sup>3</sup> R <sup>4</sup>	= R <sub>6</sub>	R <sup>11</sup> -R <sup>15</sup>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = OCHF <sub>2</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>11</sup> = F R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>

HR P20161011 T1

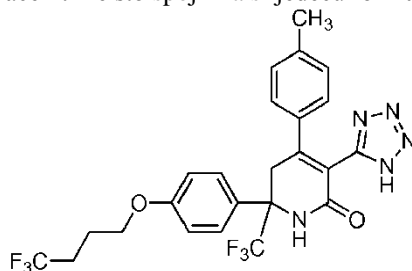
	R <sup>1</sup>	R <sub>2</sub>	R <sup>3</sup> R <sup>4</sup>	= R <sub>6</sub>	R <sup>11</sup> -R <sup>15</sup>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
Rac		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = OCH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = OCH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>11</sup> = F R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = OCHF <sub>2</sub>

HR P20161011 T1

	R <sup>1</sup>	R <sub>2</sub>	R <sup>3</sup> R <sup>4</sup>	= R <sub>6</sub>	R <sup>11</sup> -R <sup>15</sup>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>12</sup> R <sup>13</sup> = 
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = OCHF <sub>2</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>12</sup> R <sup>13</sup> = 
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = OCHF <sub>2</sub>
S-izomer		CF <sub>3</sub>	H		R <sup>13</sup> = CH <sub>3</sub>

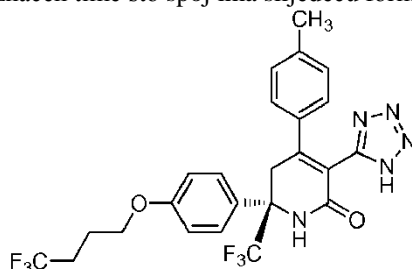
ili njegov stereoizomer, tautomer, farmaceutski prihvatljiva sol ili solvat.

15. Spoj prema patentnom zahtjevu 1, naznačen time što spoj ima sljedeću formulu:



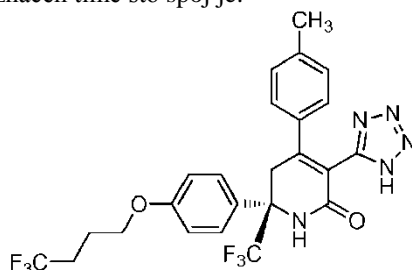
5 ili njegov stereoizomer, tautomer ili farmaceutski prihvatljiva sol ili solvat.

16. Spoj prema patentnom zahtjevu 15, naznačen time što spoj ima sljedeću formulu:



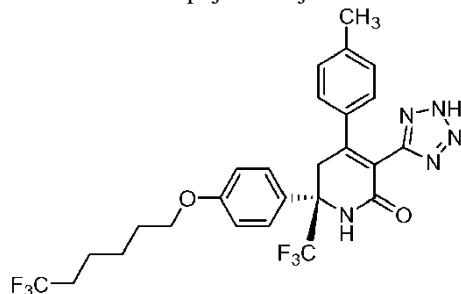
ili njegov tautomer ili farmaceutski prihvatljiva sol.

17. Spoj prema patentnom zahtjevu 15, naznačen time što spoj je:



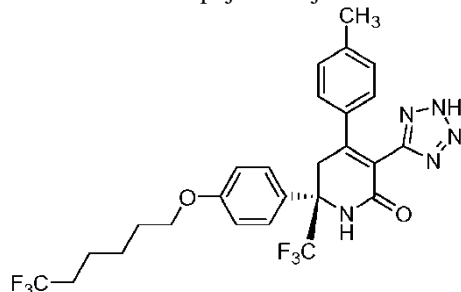
10 18. Farmaceutski prihvatljiva sol spoja prema patentnom zahtjevu 15 ili patentnom zahtjevu 16.

19. Spoj prema patentnom zahtjevu 1, naznačen time što spoj ima sljedeću formulu:



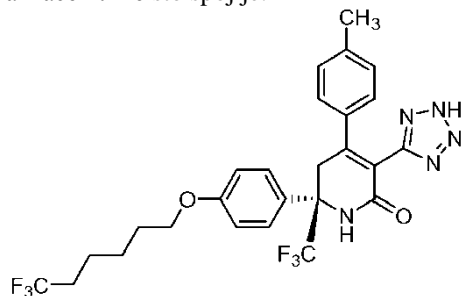
ili njegov stereoizomer, tautomer ili farmaceutski prihvatljiva sol.

15 20. Spoj prema patentnom zahtjevu 19, naznačen time što spoj ima sljedeću formulu:

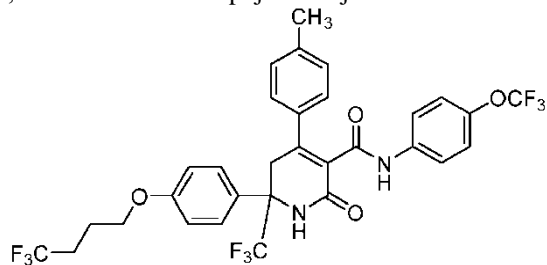


ili njegov tautomer ili farmaceutski prihvatljiva sol.

21. Spoj prema patentnom zahtjevu 19, naznačen time što spoj je:

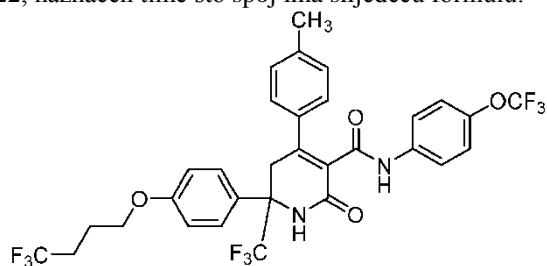


22. Spoj prema patentnom zahtjevu 1, naznačen time što spoj ima sljedeću formulu:



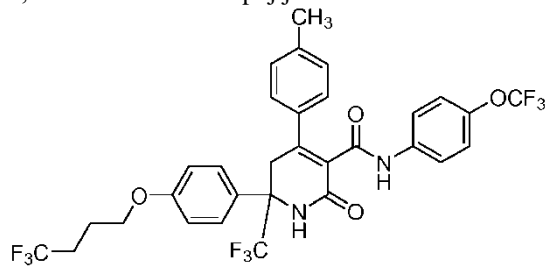
5 ili njegov stereoizomer, tautomer ili farmaceutski prihvatljiva sol.

23. Spoj prema patentnom zahtjevu 22, naznačen time što spoj ima sljedeću formulu:

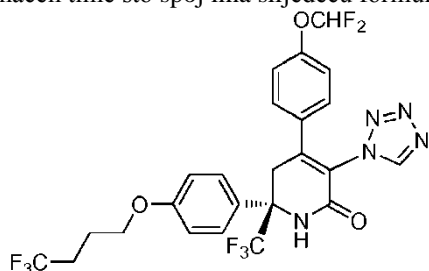


ili njegov tautomer ili farmaceutski prihvatljiva sol.

24. Spoj prema patentnom zahtjevu 22, naznačen time što spoj je:

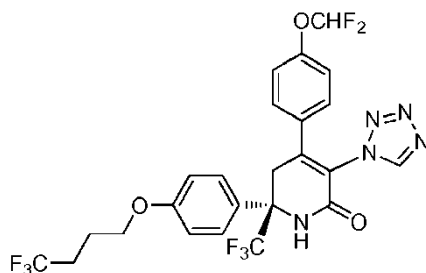


10 25. Spoj prema patentnom zahtjevu 1, naznačen time što spoj ima sljedeću formulu:



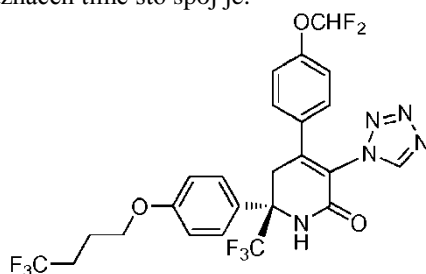
ili njegov stereoizomer, tautomer ili farmaceutski prihvatljiva sol.

26. Spoj prema patentnom zahtjevu 25, naznačen time što spoj ima sljedeću formulu:

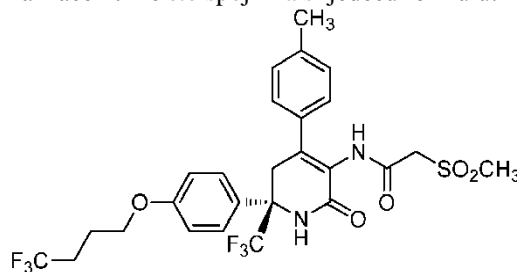


ili njegov tautomer ili farmaceutski prihvatljiva sol.

27. Spoj prema patentnom zahtjevu 25, naznačen time što spoj je:

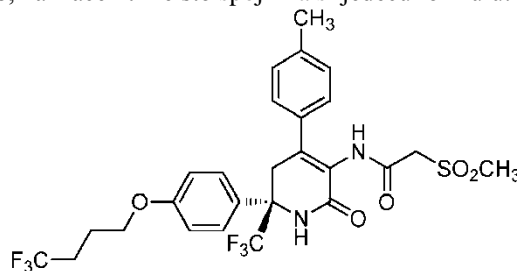


5 28. Spoj prema patentnom zahtjevu 1, naznačen time što spoj ima slijedeću formulu:



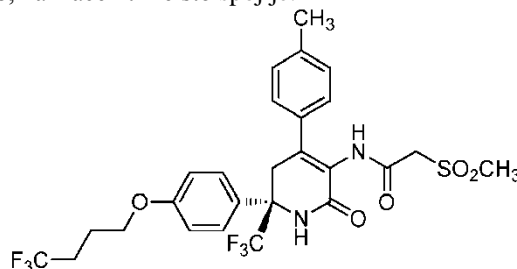
ili njegov stereoizomer, tautomer ili farmaceutski prihvatljiva sol.

29. Spoj prema patentnom zahtjevu 28, naznačen time što spoj ima slijedeću formulu:



10 ili njegov tautomer ili farmaceutski prihvatljiva sol.

30. Spoj prema patentnom zahtjevu 28, naznačen time što spoj je:



15 31. Farmaceutska kompozicija, koja sadrži: farmaceutski prihvatljiv nosač i spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 30, ili njegov stereoizomer, tautomer ili farmaceutski prihvatljivu sol, i izborno jedan ili više dodatnih terapijskih sredstava.

32. Farmaceutska kompozicija prema patentnom zahtjevu 31, koja dalje sadrži jedno ili više drugih pogodnih terapijskih sredstava izabranih od: anti-dijabetičkih sredstava, anti-hiperglikemijskih sredstava, anti-hiperinsulinemijskih sredstava, anti-retinopatskih sredstava, anti-neuropatskih sredstava, anti-nefropatijski sredstava, anti-aterosklerotičnih sredstava, anti-ishemijskih sredstava, anti-hipertenzivnih sredstava, sredstava protiv debljine, anti-dislipidemijskih sredstava, anti-

hiperlipidemijskih sredstava, anti-hipertrigliceridemijskih sredstava, anti-hiperkolesterolemijskih sredstava, anti-restenotičnih sredstava, sredstava za snižavanje lipida, anorektičkih sredstava i supresanata apetita.

33. Farmaceutska kompozicija prema patentnom zahtjevu 31, koja dalje sadrži jedno ili više drugih pogodnih terapijskih sredstava izabranih od: inhibitora dipeptidil peptidaze-IV, inhibitora transportera 2 natrij glukoze i inhibitora 11b-HSD-1.

5

34. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1-30, ili njegov stereoizomer, tautomer, farmaceutski prihvatljiva sol ili solvat, ili kompozicija prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 18-20, za uporabu u terapiji, izborno istovremeno, odvojeno ili uzastopno sa jednim ili više dodatnih terapijskih sredstava.

35. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 30, ili njegov stereoizomer, tautomer, farmaceutski prihvatljiva sol ili solvat, ili kompozicija prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 18-20, za uporabu u prevenciji, modulaciji ili liječenju dijabetesa, hiperglikemije, smanjene tolerancije glukoze, gestacionog dijabetesa, insulinske rezistencije, hiperinsulinemije, bolesti nealkoholne masne jetre (NAFLD) uključujući nealkoholni steatohepatitis (NASH), retinopatije, neuropatije, nefropatije, odloženog zarastanja rana, ateroskleroze i njenih sekvela, abnormalne srčane funkcije, ishemije miokarda, moždanog udara, metaboličkog sindroma, povišenog krvnog tlaka, debljine, dislipidemije, dislipidemije, hiperlipidemije, hipertrigliceridemije, hiperholesterolemije, niskog nivoa lipoproteina visoke gustoće (HDL), visoke razine lipoproteina niske gustoće (LDL), ne-srčane ishemije, poremećaja lipida i glaukoma, izborno za uporabu istovremeno, odvojeno ili uzastopno s jednim ili više dodatnih terapijskih sredstava.

10

15