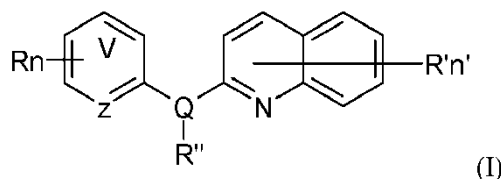
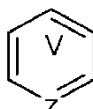


PATENTNI ZAHTJEVI

1. Derivat kinolina formule (I)



5 naznačen time što:
z predstavlja N ili C,



znači aromatski prsten pri čemu V je C ili N i kada V je N, V je u orto, meta ili para položaju o z, tj. tvori odgovarajuću skupinu piridazin, pirimidin ili pirazin,

R neovisno predstavlja vodikov atom, halogeni atom ili skupinu odabranu iz niza koji čine skupina -CN, hidroksilna skupina, skupina -COOR₁, skupina (C₁-C₃)fluoroalkil, skupina (C₁-C₃)fluoroalkoksi, skupina (C₃-C₆)cikloalkil, skupina -NO₂, skupina -NR₁R₂, skupina (C₁-C₄)alkoksi, skupina fenoksi, skupina -NR₁-SO₂-NR₁R₂, skupina -NR₁-SO₂-R₁, skupina -NR₁-C(=O)-R₁, skupina -NR₁-C(=O)-NR₁R₂, skupina -SO₂-NR₁R₂, skupina -SO₃H, skupina -O-SO₂-OR₃, skupina -O-P(=O)-(OR₃)(OR₄), skupina -O-CH₂-COOR₃ i skupina (C₁-C₃)alkil, navedeni alkil je po izboru mono-supstituiran s hidroksilnom skupinom,

Q je N ili O, pod uvjetom da R'' ne postoji kada Q je O,

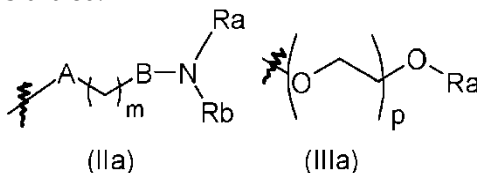
R₁ i R₂ su neovisno vodikov atom ili skupina (C₁-C₃)alkil,

R₃ i R₄ neovisno predstavljaju vodikov atom, Li⁺, Na⁺, K⁺, N⁺(Ra)₄ ili benzilnu skupinu,

n je 1, 2 ili 3,

n' je 1, 2 ili 3,

R' neovisno predstavljaju vodikov atom ili skupinu odabranu iz niza koji čine skupina (C₁-C₃)alkil, halogeni atom, hidroksilna skupina, skupina -COOR₁, skupina -NO₂, skupina -NR₁R₂, skupina morfolinil ili skupina morfolino, skupina N-metilpiperazinil, skupina (C₁-C₃)fluoroalkil, skupina (C₁-C₄)alkoksi i skupina -CN, te nadalje može biti skupina izabrana od:



A je kovalentna veza, kisikov atom ili NH,

B je kovalentna veza ili NH,

m je 1, 2, 3, 4 ili 5,

p je 1, 2 ili 3,

Ra i Rb neovisno predstavljaju vodikov atom, skupinu (C₁-C₅)alkil ili skupinu (C₃-C₆)cikloalkil,

Ra i Rb mogu dalje tvoriti zajedno s atomom dušika na koji su vezani zasićeni 5- ili 6-člani heterocikl koji po izboru sadrži daljnji heteroatom odabran od N, O i S, pri čemu je navedeni heterocikl po izboru supstituiran jednim ili više Ra, pod uvjetom da kada R' je skupina (IIa) ili (IIIa), n' može biti 2 ili 3 samo ako se druge R' skupine razlikuju od navedene skupine (IIa) ili (IIIa),

R'' je vodikov atom, skupina (C₁-C₄)alkil ili je skupina (IIa) kako je gore definirano,

ili bilo koja od njegovih farmaceutskih soli, ili njegov N-glukuronidni metabolit,

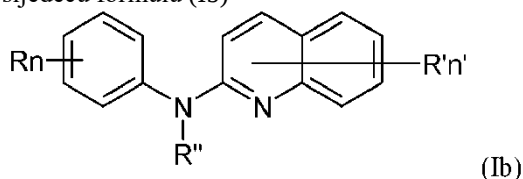
za uporabu za liječenje ili prevenciju retrovirusne infekcije, naročito HIV infekcije ili AIDS-a kod pacijenta kod kojeg je utvrđena neučinkovitost ili pad prethodne učinkovitosti anti-retrovirusnog liječenja.

2. Derivat kinolina formule (I) kako je definiran u zahtjevu 1, ili bilo koja od njegovih farmaceutskih soli ili N-glukuronidni metabolit, za uporabu za liječenje ili prevenciju retrovirusne infekcije, naročito HIV infekcije ili AIDS-a kod pacijenta, pri čemu je pacijent zaražen sojem virusa otpornim na lijekove, i točnije sojem HIV-a otpornim na lijekove.

3. Derivat kinolina formule (I) kako je definiran u zahtjevu 1, ili bilo koja od njegovih farmaceutskih soli ili N-glukuronidni metabolit, za uporabu za liječenje ili prevenciju retrovirusne infekcije, naročito HIV infekcije ili AIDS-a kod pacijenta; pri čemu se održava nisko ili neotkriveno virusno opterećenje i/ili se broj CD4⁺ stanica održava ili obnavlja nakon završetka liječenja.

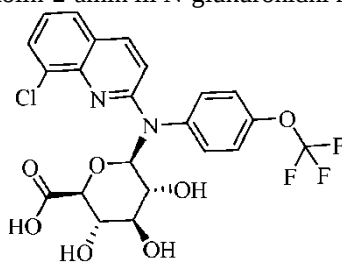
4. Derivat kinolina formule (I) kako je definiran u zahtjevu 1, ili bilo koja od njegovih farmaceutskih soli i N-glukuronidni metabolit, za uporabu prema zahtjevu 3, naznačen time što je virusno opterećenje malo ako je ispod 500 kopija/mL plazme, virusna niska vrijednost se ne može otkriti ako je ispod 40 kopija/mL plazme, a razina broja CD4⁺ stanica se obnavlja ako je jednaka ili viša od 500 CD4⁺ stanica/mm³ plazme.

5. Derivat kinolina formule (I) kako je definiran u zahtjevu 1, ili bilo koja od njegovih farmaceutskih soli i N-glukuronidni metabolit, za uporabu prema zahtjevu 2, naznačen time što je soj HIV-a otporan na lijek otporan na lijek odabran od ART i/ili HAART liječenja.
6. Derivat kinolina formule (I) kako je definiran u zahtjevu 1, ili bilo koja od njegovih farmaceutskih soli i N-glukuronidni metabolit, za uporabu prema zahtjevu 2, pri čemu je soj HIV otporan na lijek koji je odabran iz niza koji čine: Zidovudin, Lamivudin, Emtricitabin, Didanozin, Stavudin, Abakavir, Zalcitabin, Tenofovir, Racivir, Amdoksovir, Apricitabin, Elvucitabin, Efavirenz, Nevirapin, Etravirin, Delavirdin, Rilpivirin, Tenofovir, Foslovudin, Amprenavir, Tipranavir, Indinavir, Sakvinavir, Fosamprenavir, Ritonavir, Darunavir, Atazanavir, Nelfinavir, Lopinavir, Raltegravir, Elvitegravir, Dolutegravir, Enfuvirtid, Maravirok, Vicrivirok, i njihove kombinacije.
7. Derivat kinolina formule (I) kako je definiran u zahtjevu 1, ili bilo koja od njegovih farmaceutskih soli i N-glukuronidni metabolit, za uporabu prema zahtjevu 2 ili 3, naznačen time što pacijent prethodno nije bio liječen sa anti-retrovirusnim liječenjem.
8. Derivat kinolina formule (I) kako je definiran u zahtjevu 1, ili bilo koja od njegovih farmaceutskih soli i N-glukuronidni metabolit, za uporabu prema bilo kojem od prethodnih zahtjeva, naznačen time što se navedeni derivat kinolina ili njegov N-glukuronidni metabolit, primjenjuje jednom dnevno, jednom u tri dana, jednom tjedno, jednom u dva tjedna ili jednom mjesečno, naročito u dozama od koje se mijenjaju od 25 do 500 mg, naročito se mijenjaju od 25 do 300 mg, točnije od 25 do 200 mg, na primjer od 25 do 150 mg, tijekom razdoblja liječenja ili kao neprekidno liječenje.
9. Derivat kinolina formule (I) kako je definiran u zahtjevu 1, ili bilo koja od njegovih farmaceutskih soli i N-glukuronidni metabolit, za uporabu prema prethodnom patentnom zahtjevu, naznačen time što razdoblje liječenja varira od 2 do 8 tjedana.
10. Derivat kinolina formule (I) kako je definiran u zahtjevu 1, ili bilo koja od njegovih farmaceutskih soli i N-glukuronidni metabolit, za uporabu prema bilo kojem od prethodnih patentnih zahtjeva, naznačen time što navedeni derivat kinolina ima sljedeću formulu (Ib)



pri čemu R, R', R'', n i n' su kako je definirano u zahtjevu 1, ili bilo koja od njegovih farmaceutskih soli, ili bilo koji njegov N-glukuronidni metabolit.

11. Derivat kinolina formule (I) kako je definiran u zahtjevu 1, ili bilo koja od njegovih farmaceutskih soli i N-glukuronidni metabolit, za uporabu prema bilo kojem od prethodnih patentnih zahtjeva, naznačen time što je 8-kloro-N-(4-(trifluorometoksi)fenil)kinolin-2-amin ili N-glukuronidni metabolit



12. Derivat kinolina formule (I) kako je definiran u zahtjevu 1, ili bilo koja od njegovih farmaceutskih soli i N-glukuronidni metabolit, za uporabu prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 3, naznačen time što je retrovirusna infekcija HIV infekcija ili AIDS.