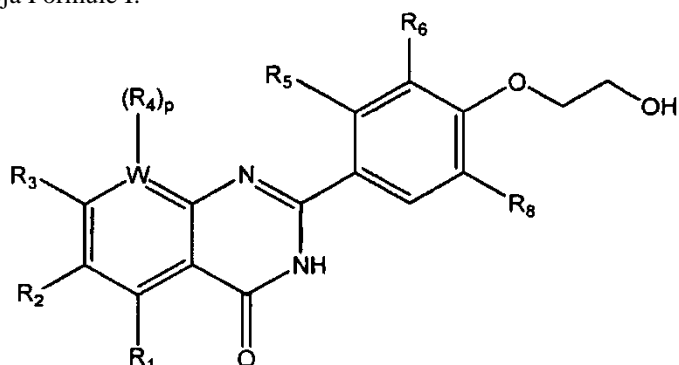


PATENTNI ZAHTJEVI

- 5 1. Postupak dobivanja spoja Formule I:



Formula I

i njegovih solvata, hidrata, tautomera i farmaceutski prihvatljivih soli, gdje:

svaki od R_1 , R_2 , R_3 i R_4 se neovisno bira između alkoksi, alkila, amido, ariloksi, cikloalkila, halogena, heterociklila, vodika i nitro;

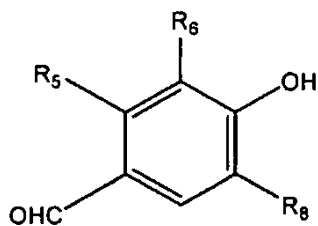
R_6 se bira između alkila, alkoksi i halogena;

R_5 je vodik, ili se R_5 i R_6 može uzeti zajedno s atomima ugljika s kojima su vezani, kako bi se dobilo prsten koji se bira između arila, cikloalkila i heterociklila;

R_8 se bira između alkila, alkoksi i halogena;

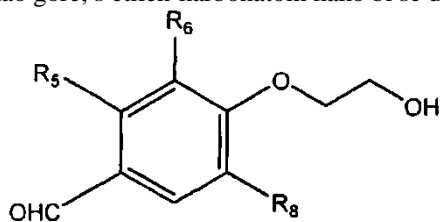
W je C ili N, gdje ako je W N, p je 0, a ako je W C, p je 1; **naznačen time** što se sastoji u

a) reakciji aldehida Formule II:



Formula II

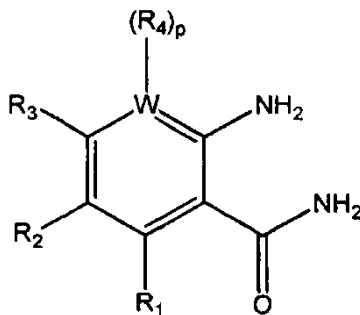
gdje su R_5 , R_6 i R_8 definirani kao gore, s etilen-karbonatom kako bi se dobilo spoj Formule III:



Formula III

i

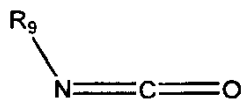
b) reakciji spoja Formule III sa spojem Formule IV:



Formula IV

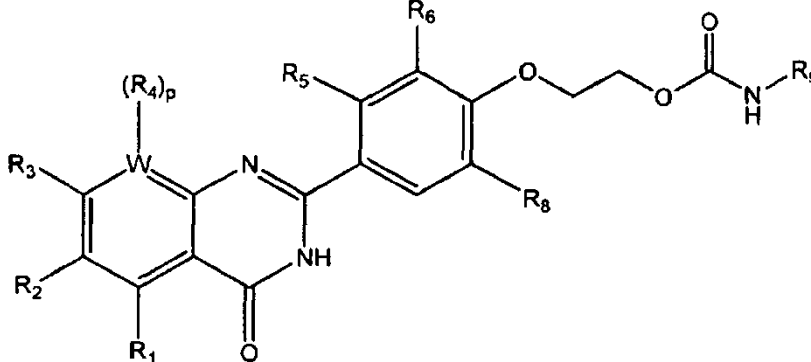
gdje su R_1 , R_2 , R_3 i R_4 definirani kao gore, kako bi se dobilo spoj Formule I.

2. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što se svaki od R_6 i R_8 neovisno bira između alkila i halogena; gdje je svaki od R_6 i R_8 po mogućnosti metil.
3. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 1 ili patentnim zahtjevom 2, **naznačen time** što se svaki od R_1 i R_3 neovisno bira između alkoksi, alkila, halogena i vodika; gdje je svaki od R_1 i R_3 po mogućnosti metoksi.
4. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što spoj Formule I se bira između:
 - 2-(4-(2-hidroksietoksi)-3,5-dimetilfenil)kinazolin-4(3H)-ona;
 - 2-(4-(2-hidroksietoksi)-3,5-dimetilfenil)-5,7-dimetoksikinazolin-4(3H)-ona;
 - 2-(4-(2-hidroksietoksi)-3,5-dimetilfenil)-6,7-dimetoksikinazolin-4(3H)-ona;
 - 2-(4-(2-hidroksietoksi)-3,5-dimetilfenil)-5,7-dimetoksipirido[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona;
 - N-(2-(4-(2-hidroksietoksi)-3,5-dimetilfenil)-4-okso-3,4-dihidrokinazolin-6-il)acetamida;
 - 2-(4-(2-hidroksietoksi)-3,5-dimetilfenil)-5,7-dimetilkinazolin-4(3H)-ona;
 - 5,7-diklor-2-(4-(2-hidroksietoksi)-3,5-dimetilfenil)kinazolin-4(3H)-ona;
 - 2-(4-(2-hidroksietoksi)-3,5-dimetilfenil)-6-metoksikinazolin-4(3H)-ona;
 - 2-(4-(2-hidroksietoksi)-3,5-dimetilfenil)-5-metoksikinazolin-4(3H)-ona; i
 - 6-brom-2-(4-(2-hidroksietoksi)-3,5-dimetilfenil)kinazolin-4(3H)-ona
 i njihovih solvata, hidrata, tautomera i farmaceutski prihvatljivih soli; gdje je spoj Formule I po mogućnosti
 - 2-(4-(2-hidroksietoksi)-3,5-dimetilfenil)-5,7-dimetoksikinazolin-4(3H)-on,
 - ili njegov solvat, hidrat, tautomer ili farmaceutski prihvatljiva sol.
5. Postupak u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 4, **naznačen time** što se dodatno sastoji u reakciji spoja Formule I sa spojem Formule V:



Formula V

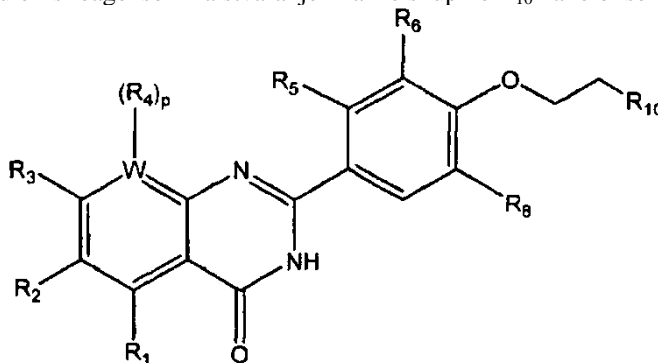
gdje se R_9 bira između alkila, arila, cikloalkila, heteroarila i heterociklila, kako bi se dobilo spoj Formule VI:



Formula VI

i njegove solvate, hidrate, tautomere i farmaceutski prihvatljive soli, gdje su R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , R_6 , R_8 i R_9 definirani kao gore.

6. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 5, **naznačen time** što R_9 je aril supstituiran s jednom ili više skupina koje se bira između alkoksi, alkila i halogena.
7. Postupak u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 4, **naznačen time** što se dodatno sastoji u
 - c) reakciji spoja Formule I s reagensom za stvaranje izlazne skupine R_{10} kako bi se dobilo spoj Formule VII:

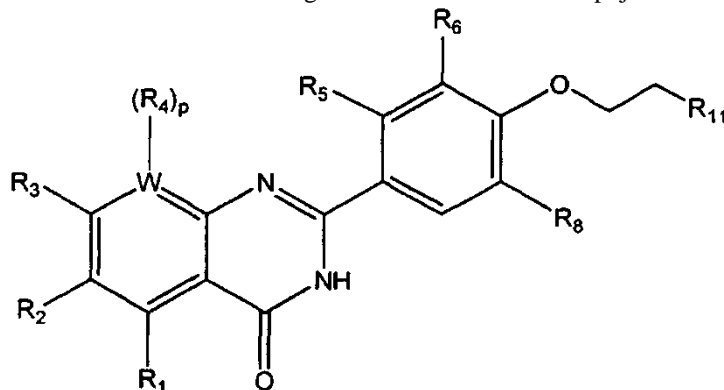


Formula VII

gdje se R_{10} bira između halogena, sulfonila i fosfonija;

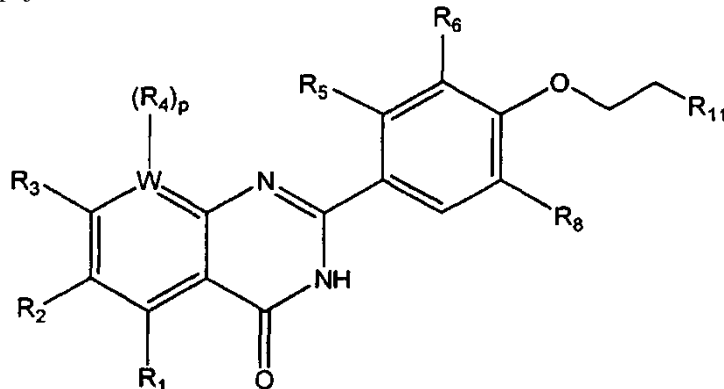
$R_1, R_2, R_3, R_4, R_5, R_6$ i R_8 su definirani kao gore; i

- d) reakciji spoja Formule VII s nukleofilnim reagensom kako bi se dobilo spoj Formule VIII:



Formula VIII

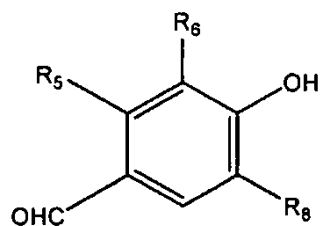
- 5 i njegove solvate, hidrate, tautomere i farmaceutski prihvatljive soli, gdje se R_{11} bira između alkoksi, amido, amino, imido i heterociklila; a $R_1, R_2, R_3, R_4, R_5, R_6$ i R_8 su definirani kao gore.
8. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 7, **naznačen time** što
- 10 a) reagens za stvaranje izlazne skupine se bira između tionil-klorida, metansulfonil-klorida, *p*-toluensulfonil-klorida i PPh_3 /dietil-azodikarboksilata; i/ili
- b) R_{10} se bira između klorida, metansulfonila, *p*-toluensulfonila i trifenilfosfonija.
9. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 7 ili patentnim zahtjevom 8, **naznačen time** što
- a) nukleofilni reagens se bira između alkoksida, amina, azida i heterocikla koji sadrži najmanje jedan dušik; i/ili
- 15 b) R_{11} se bira između metoksi, metilamino, morfolino, piperazino i piperidino.
10. Postupak u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 7 do 9, **naznačen time** što je spoj Formule VIII 2-(3,5-dimetil-4-(2-(metilamino)etoksi)fenil)-5,7-dimetoksi-kinazolin-4(3*H*)-on, ili njegov solvat, hidrat, tautomer ili farmaceutski prihvatljiva sol.
11. Postupak dobivanja spoja Formule VIII:



Formula VIII

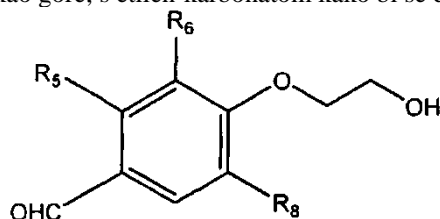
i njegovih solvata, hidrata, tautomera i farmaceutski prihvatljivih soli, gdje:

- 20 svaki od R_1, R_2, R_3 i R_4 se neovisno bira između alkoksi, alkila, amido, ariloksi, cikloalkila, halogena, heterociklila, vodika i nitro;
- R_6 se bira između alkila, alkoksi i halogena;
- R_5 je vodik, ili se R_5 i R_6 može uzeti zajedno s atomima ugljika s kojima su vezani, kako bi se dobilo prsten koji se bira između arila, cikloalkila i heterociklila;
- 25 R_8 se bira između alkoksi, alkila i halogena;
- R_{11} se bira između alkoksi, amido, amino, imido i heterociklila;
- W je C ili N, gdje ako je W N, p je 0, a ako je W C, p je 1; **naznačen time** što se sastoji u
- a) reakciji aldehida Formule II:



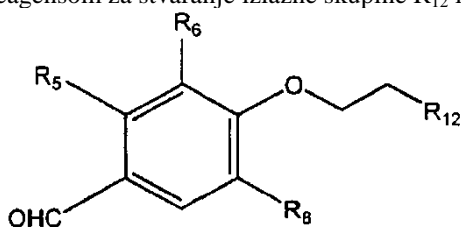
Formula II

gdje su R_5 , R_6 i R_8 definirani kao gore, s etilen-karbonatom kako bi se dobilo spoj Formule III:



Formula III

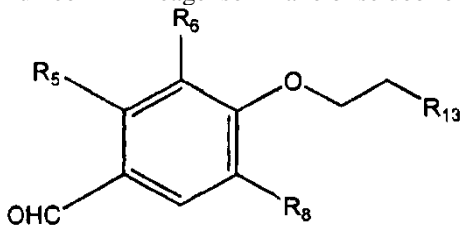
b) reakciji spoja Formule III s reagensom za stvaranje izlazne skupine R_{12} kako bi se dobilo spoj Formule IX:



Formula IX

gdje se R_{12} bira između halogena, sulfonila i fosfonija;

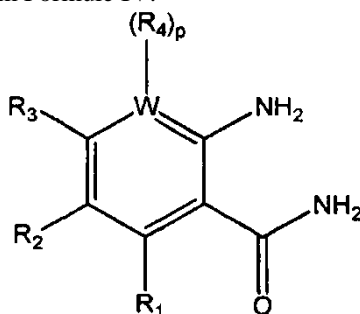
c) reakciji spoja Formule VIII s nukleofilnim reagensom kako bi se dobilo spoj Formule X:



Formula X

gdje se R_{13} bira između alkoksi, amido, amino, imido i heterociklila; i

d) reakciji spoja Formule X sa spojem Formule IV:



Formula IV

gdje su R_1 , R_2 , R_3 i R_4 definirani kao gore, kako bi se dobilo spoj Formule VIII.

12. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 11, **naznačen time** što

a) reagens za stvaranje izlazne skupine se bira između tionil-klorida, metansulfonil-klorida, *p*-toluensulfonil-klorida i PPh_3 /dietil-azodikarboksilata; i/ili

b) R_{12} se bira između klorida, metansulfonila, *p*-toluensulfonila i trifenilfosfonija.

13. Postupak u skladu s patentnim zahtjevom 11 ili patentnim zahtjevom 12, **naznačen time** što

a) nukleofilni reagens se bira između alkoksida, amina, azida i heterocikla koji sadrži najmanje jedan dušik; i/ili

- b) R_{13} se bira između metoksi, metilamino, morfolino, piperazino i piperidino.
14. Postupak u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 11 do 13, **naznačen time** što je svaki od R_6 i R_8 metil; i/ili svaki od R_1 i R_3 je vodik.
- 5 15. Postupak u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 11 do 14, **naznačen time** što je spoj Formule VIII 2-(3,5-dimetil-4-(2-morfolinoetoksi)fenil)kinazolin-4(3*H*)-on, ili njegov solvat, hidrat, tautomer ili farmaceutski prihvatljiva sol.