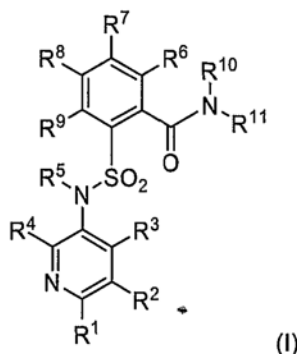


PATENTNI ZAHTEJEVI

5

1. Spoj formule (I)

**naznačen time što:**

R^1, R^2, R^3, R^4 su nezavisno izabrani od vodika, C_1 - C_6 alkil, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ halo, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ CN, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ OR^{12a}, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ N(R^{12a}R^{12b}), $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ CF₃, i $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ C₆-C₁₀ aril;

R^5 je vodik ili C_1 - C_6 alkil;

R^6, R^7, R^8 i R^9 su nezavisno izabrani od vodika, C_1 - C_6 alkil, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ halo, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ CN, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ CF₃, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ OR^{12a}, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ N(R^{12a}R^{12b}), $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ R^{12a}, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ C₃-C₁₁cikloalkil; $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ C₆-C₁₀ aril, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ C₂-C₁₀ heterociklil, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ heteroaril, $-O(CR^{12a}R^{12b})_t$ R^{12a}, $-O(CR^{12a}R^{12b})_t$ C₃-C₁₁cikloalkil, $-O(CR^{12a}R^{12b})_t$ C₆-C₁₀ aril, $-O(CR^{12a}R^{12b})_t$ C₂-C₁₀ heterociklil, $-O(CR^{12a}R^{12b})_t$ heteroaril, $-O(CR^{12a}R^{12b})_t$ R^{12a} i $-O(CR^{12a}R^{12b})_t$ N(R^{12a}R^{12b}), gdje je svaka od spomenutih C_1 - C_6 alkil, C_3 -C₁₁cikloalkil, C_6 -C₁₀ aril i C_2 -C₁₀ heterociklil, i heteroaril grupa po izboru supstituirana sa jednim ili više R¹⁴.

R^{10} i R^{11} su nezavisno izabrani od vodika, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ C₁- C_6 alkil, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ C₃-C₁₁ cikloalkil, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ C₆-C₁₀ aril, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ C₂-C₁₀ heterociklil i $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ heteroaril, gdje je svaka od spomenutih C_1 - C_6 alkil, C_3 -C₁₁ cikloalkil, C_6 -C₁₀ aril, C_2 -C₁₀ heterociklil, i heteroaril grupa po izboru supstituirana sa jednim ili više R¹³; ili R^{10} i R^{11} , zajedno sa atomom za koji su vezani, grade C_2 -C₁₀ heterociklil grupu, po izboru supstituiranu sa jednim ili više R¹³;

svaki R^{12a} i R^{12b} je nezavisno odabran od vodika i C_1 - C_6 alkil; ili

R^{12a} i R^{12b}, zajedno sa atomom za koji su vezani, grade C_3 -C₁₁ cikloalkil ili C_2 -C₁₀ heterociklil grupu;

svaki od R¹³ je nezavisno odabran od C_1 - C_6 alkil, halogen, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ CN, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ CF₃, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ OCF₃, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ C₃-C₁₁ cikloalkil, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ C₆-C₁₀ aril, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ C₂-C₁₀ heterociklil, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ heteroaril, $-O(CR^{12a}R^{12b})_t$ R^{12a}, $-O(CR^{12a}R^{12b})_t$ C₆-C₁₀ aril, $-O(CR^{12a}R^{12b})_t$ C₂-C₁₀ heterociklil, $-O(CR^{12a}R^{12b})_t$ heteroaril, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ CO₂(C_1 - C_6 alkil), $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ N(R^{12a}R^{12b}), $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ C(O)NR^{12a}R^{12b}, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ OR^{12a}, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ S(O)R^{12a} i $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ S(O)₂R^{12a}, gdje je svaka od spomenutih C_1 - C_6 alkil, C_3 -C₁₁ cikloalkil, C_6 -C₁₀ aril, C_2 -C₁₀ heterociklil, i heteroaril grupa po izboru supstituirana s jednim ili više R¹⁴;

svaki od R¹⁴ je nezavisno izabran od C_1 - C_6 alkil, halogen, -CN, -CF₃, i OR^{12a}; i

svaki t je nezavisno izabran od 0, 1, 2, 3, 4, 5, i 6; ili

njegova farmaceutski prihvatljiva sol ili solvat.

2. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time**, što:

R^1, R^2, R^3, R^4 su nezavisno izabrani od vodika, C_1 - C_6 alkil, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ halo, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ CN, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ OR^{12a}, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ N(R^{12a}R^{12b}), $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ CF₃, i

R^{10} i R^{11} su nezavisno izabrani od vodika, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ C_1 - C_6 alkil, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ C_3 -C₁₁ cikloalkil, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ C_6 -C₁₀ aril, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ C_2 -C₁₀ heterociklil i $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ heteroaril, gdje je svaka od pomenutih C_1 - C_6 alkil, C_3 -C₁₁ cikloalkil, C_6 -C₁₀ aril, C_2 -C₁₀ heterociklil, i heteroaril grupa po izboru supstituirana sa jednim ili više R¹³; ili

njegova farmaceutski prihvatljiva sol ili solvat.

3. Spoj prema zahtjevu 2, **naznačen time**, što:

R^1, R^2, R^3, R^4 su nezavisno izabrani od vodika, C_1 - C_6 alkil, halo, -CN, -OR^{12a}, i -CF₃; i

R^5 je vodik; ili

njegova farmaceutski prihvatljiva sol ili solvat.

4. Spoj prema zahtjevu 3, **naznačen time**, što:

R^{10} je vodik ili C_1 - C_6 alkil; i

R^{11} je izabran od $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ C_1 - C_6 alkil, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ C_3 -C₁₁ cikloalkil, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ C_6 -C₁₀ aril, $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ C_2 -C₁₀ heterociklil i $-(CR^{12a}R^{12b})_t$ heteroaril, gdje je svaka od spomenutih C_1 - C_6 alkil, C_3 -C₁₁ cikloalkil, C_6 -C₁₀ aril, C_2 -C₁₀ heterociklil, i heteroaril grupa po izboru supstituirana sa jednim ili više R¹³; ili

njegova farmaceutski prihvatljiva sol ili solvat.

5. Spoj prema zahtjevu 4, **naznačen time**, što su R^6 , R^7 , R^8 i R^9 vodik, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol ili solvat.
6. Spoj prema zahtjevu 5, **naznačen time**, što:
 R^{11} je $-(CH_2)C_6-C_{10}$ aril ili $-(CH_2)_2C_6-C_{10}$ aril, gdje je spomenuta C_6-C_{10} aril grupa po izboru supstituirana sa jednim ili više R^{13} ;
 R^{12a} je vodik ili C_1-C_6 alkil; i
svaki od R^{13} je nezavisno izabran od vodika, C_1-C_6 alkil, halogen -CN, $-CF_3$; i OCF_3 ; ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol ili solvat.
7. Spoj prema zahtjevu 6, **naznačen time**, što
 R^1 , R^2 i R^4 su vodik, i
 R^3 je C_1-C_6 alkil, -CL, -F, -CN, $-OCH_3$, $-OCH_2CH_3$, ili $-CF_3$;
 R^{10} je vodik ili $-CH_3$; i
svaki od R^{13} je nezavisno izabran od, C_1-C_6 alkil, -CL, -F, -CN, $-CF_3$; i $-OCF_3$; ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol ili solvat.
8. spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time**, što:
 R^1 , R^2 , i R^4 su vodik,
 R^3 je $-CH_3$, $-OCH_3$ ili $-OCH_2CH_3$
 R^5 je vodik; i
 R^6 , R^7 , R^8 i R^9 su vodik
 R^{10} je vodik ili $-CH_3$, i
 R^{11} je $-(CH_2)C_8-C_{10}$ aril ili $-(CH_2)_2C_6-C_{10}$ aril gdje je navedeni C_6-C_{10} aril po izboru supstituiran jednim ili više R^{13} ; i
svaki se R^{13} neovisno bira od, C_1-C_6 alkil, -Cl, -F, -CN, $-CF_3$; i $-OCF_3$; ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol ili solvat.
9. spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time**, što:
 R^1 , R^2 , i R^4 su vodik,
 R^3 je $-OCH_3$ ili $-OCH_2CH_3$
 R^5 je vodik; i
 R^6 , R^7 , R^8 i R^9 su vodik
 R^{10} je vodik ili $-CH_3$, i
 R^{11} je $-(CH_2)C_6-C_{10}$ aril ili $-(CH_2)_2C_6-C_{10}$ aril gdje je navedeni C_6-C_{10} aril po izboru supstituiran jednim ili više supstituenata neovisno biranih od -Cl i -F; ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol ili solvat.
10. spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time**, što se odabire od:
N-(3,4-difluorobenzil)-2- {[(5-metoksipiridin-3-il)amino]sulfonil} benzamid;
N-[2-(2-metilfenil)etil]-2- {[(5-metilpiridin-3-il)amino]sulfonil} benzamid;
N-(3,4-diklorobenzil)-2- {[(5-metilpiridin-3-il)amino]sulfonil} benzamid;
N-[4-fluoro-3-(trifluorometil)benzil]-2- {[(5-metilpiridin-3-il)amino]sulfonil} benzamid;
N-[4-fluoro-3-(trifluorometil)benzil]-2- {[(5-metoksipiridin-3-il)amino]sulfonil} benzamid;
2- {[(5-etoksipiridin-3-il)amino]sulfonil} -N-[2-(2-metilfenil)etil]benzamid;
N-(3,4-diklorobenzil)-2- {[(5-etoksipiridin-3-il)amino]sulfonil} benzamid;
N-(3,4-difluorobenzil)-2- {[(5-toksipiridin-3-il)amino]sulfonil} -N-metilbenzamid;
2- {[(4-etoksipiridin-3-il)amino]sulfonil} -N-[4-fluoro-3-(trifluorometil)benzil]benzamid;
2- {[(5-etoksipiridin-3-il)amino]sulfonil} -N-[4-fluoro-3-(trifluorometil)benzil]benzamid;
N-(3,4-difluorobenzil)-2- {[(4-etoksipiridin-3-il)amino]sulfonil} -N-metilbenzamid;
N-(4-kloro-2-metilbenzil)-2- {[(5-metoksipiridin-3-il)amino]sulfonil} benzamid;
N-(3-kloro-2-metilbenzil)-2- {[(5-metoksipiridin-3-il)amino]sulfonil} benzamid;
N-(3,5-diklorobenzil)-2- {[(5-metilpiridin-3-il)amino]sulfonil} benzamid; i
N-(3,4-difluorobenzil)-2- {[(4-metoksipiridin-3-il)amino]sulfonil} -N-metilbenzamid;
ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol ili solvate.
11. spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time**, što se odabire od:
N-(3,4-difluorobenzil)-2- {[(4-metoksipiridin-3-il)amino]sulfonil} -N-metilbenzamid;
N-(3,4-difluorobenzil)-2- {[(4-metoksipiridin-3-il)amino]sulfonil} benzamid;
N-[2-(2-fluorofenil)etil]-2- {[(5-metoksipiridin-3-il)amino]sulfonil} benzamid;
N-[4-fluoro-3-(trifluorometil)benzil]-2- {[(4-metoksipiridin-3-il)amino]sulfonil} benzamid;
N-(3,4-difluorobenzil)-2- {[(4-etoksipiridin-3-il)amino]sulfonil} benzamid; i
N-(3,4-difluorobenzil)-2- {[(4-etoksipiridin-3-il)amino]sulfonil} -N-metilbenzamid; ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol ili solvat.
12. farmaceutska kompozicija, **naznačena time**, što sadrži efektivnu količinu najmanje jednog spoja prema bilo kome od zahtjeva 1 do 11, i farmaceutski prihvatljiv nosač.

13. Farmaceutska kompozicija prema zahtjevu 12, **naznačena time**, što dalje sadrži inhibitor HIV proteaze odabranu od amprenavira, nelfinavira, ritonavira, sakvinavira, inviraze, lopinavira, atazanavira, palinavira, indinavira, tipranavira, darunavira, brecanavira, (4R)-N-alil-3-[(2S,3S)-2-hidroksi-3-[(3-hidroksi-2-metilbenzoil)amino]-4-fenilbutanoil]-5,5-dimetil-1,3-tiazolidin-4-karboksamida, i fosamprenavir kalcija.
- 5 14. Primjena prvog spoja i drugog spoja za dobijanje lijeka za liječenje infekcije HIV-om kod sisavaca inficiranih HIV-om, **naznačena time**, što je prvi spoj odabran od onih prema bilo kojim od zahtjeva 1 do 11, a drugi spoj je anti-HIV spoj.
15. primjena prema zahtjevu 19, gdje je, **naznačeni** drugi spoj (N-[(1S)-3-[3-izopropil-5-metil-4H-1,2,4-triazol-4-il]-egzo-8-azadiciklo[3.2.1]okt-8-il]-1-fenilpropil)-4,4-difluorocikloheksan-karboksamid), etil-1-endo-[8-[(3S)-3-(acetilamino)-3-(3-fluorofenil)propil]-8-azadiciklo[3.2.1]okt-3-il]-2-metil-4,5,6,7-tetrahidro-1H-imidazol[4,5-c]piridin-5-karboksilat, ili N-[(1S)-3-[3-endo-(5-izobutiril-2-metil-4,5,6,7-tetrahidro-1H-imidazo[4.5-c]piridin-1-il)-8-azadiciklo[3.2.1]okt-8-il]-1-(3-fluorofenil)propil]-acetamid).
- 10 16. Primjena prema zahtjevu 14, gdje je **naznačeni** drugi spoj odabran od amprenavira, CGP-73547, CGP-61755, DMP-450, nelfinavira, ritonavira, sakvinavira, inviraze, lopinavira, TCM-126, atazanavira, palinavira, GS-333, KN I-413, KNI-272, LG-71350, CGP-61755, PD 173606, PD 173606, PD 177298, PD 178390, PD 178392, U-140690, ABT-378, DMP-450, AG-1776, MK-944, VX-478, indinavira, tipranavira, darunavira, brecanavira, DCP-681, DPC-684, (4R)-N-alil-3-[(2S,3S)-2-hidroksi-3-[(3-hidroksi-2-metilbenzoil)amino]-4-fenilbutanoil]-5,5-dimetil-1,3-tiazolidin-4-karboksamida, i fosamprenavir kalcija.
- 15 17. Primjena prvog spoja i drugog spoja, **naznačena time** što je za pripravu lijeka za poboljšanje farmakokinetike kod sisavca, gdje je navedeni prvi spoj anti-HIV spoj i navedeni drugi spoj se odabire od onih prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 11.
- 20 18. Primjena prema zahtjevu 17, **naznačena time** što je navedeno anti-HIV spoj amprenavir, CGP-73547, CGP-61755, DMP-450, nelfinavir, ritonavir, sakvinavir, inviraza, lopinavir, TCM-126, atazanavir, palinavir, GS-333, KN I-413, KNI-272, LG-71350, CGP-61755, PD 173606, PD 173606, PD 177298, PD 178390, PD 178392, U-140690, ABT-378, DMP-450, AG-1776, MK-944, VX-478, indinavir, tipranavir, darunavir, brecanavir, DCP-681, DPC-684, (4R)-N-alil-3-[(2S,3S)-2-hidroksi-3-[(3-hidroksi-2-metilbenzoil)amino]-4-fenilbutanoil]-5,5-dimetil-1,3-tiazolidin-4-karboksamid, i fosamprenavir kalcij.
- 25 19. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 11, **naznačen time** da je za liječenje infekcije HIV-om kod sisavca inficiranog HIV-om.