



(19) REPUBLIKA HRVATSKA  
DRŽAVNI ZAVOD ZA  
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO



(10) Identifikator  
dokumenta:

**HR P20171248 T1**

HR P20171248 T1

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

(51) MKP:

**C07D 487/04** (2006.01)  
**A61K 31/5025** (2006.01)  
**A61P 35/00** (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 20.10.2017.

(21) Broj predmeta: P20171248T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 16.08.2017.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2012067264  
Datum podnošenja međunarodne prijave: 05.09.2012.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 12761564.9  
Datum podnošenja europske prijave patenta: 05.09.2012.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2013034570  
Datum međunarodne objave: 14.03.2013.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2758401 A1  
Datum objave europske prijave patenta: 30.07.2014.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2758401 B1  
Datum objave europskog patenta: 31.05.2017.

(31) Broj prve prijave: 11180129  
11182440  
12179902

(32) Datum podnošenja prve prijave: 06.09.2011.  
23.09.2011.  
09.08.2012.

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

(73) Nositelj patenta:

**Bayer Intellectual Property GmbH, Alfred-Nobel-Strasse 10, 40789  
Monheim am Rhein, DE**

(72) Izumitelji:

**Knut Eis, Fichtenweg 1, 13587 Berlin, DE**  
**Florian Pühler, 303 Third Square, 6115, 02142 Cambridge, US**  
**Ludwig Zorn, Osianderweg 45a, 13509 Berlin, DE**  
**Arne Scholz, Schönhauser Allee 170, 10435 Berlin, DE**  
**Philip Lienau, Jahnstr. 13, 10967 Berlin, DE**  
**Mark Jean Gnoth, Am Hang 53, 40822 Mettmann, DE**  
**Ulf Bömer, Leipziger Str. 49, 16548 Glienicke/Nordbahn, DE**  
**Judith Günther, Parkstr. 60, 13187 Berlin, DE**  
**Marion Hitchcock, Pfeddersheimer Weg 51a, 14129 Berlin, DE**

(74) Zastupnik:

PRODUCTA d.o.o., 10000 Zagreb, HR

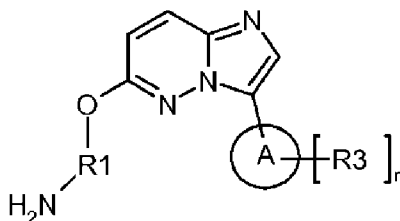
(54) Naziv izuma:

**AMINO-SUPSTITUIRANI IMIDAZOPIRIDAZINI**

HR P20171248 T1

## PATENTNI ZAHITJEVI

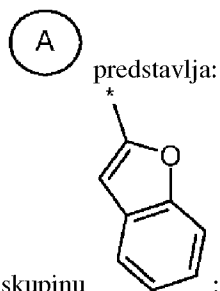
- 5 1. Spoj opće formule (I):



(I)

naznačen time da:

- R1 predstavlja skupinu ravni C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkil-, ravni C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil-O-ravni C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil-, razgranati C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-alkil-, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cikloalkil, ravni C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cikloalkil- ili C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cikloalkil-ravni C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil- koja je proizvoljno supstituirana, jednom ili više puta, međusobno neovisno, sa supstituentom odabranim iz skupa koji sadrži: halogeni atom, -CN, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalkil-, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkenil-, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkinil-, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-cikloalkil- koji je proizvoljno povezan kao spiro, 3- do 10-člani heterocikloalkil koji je proizvoljno povezan kao spiro, aril-, aril koji je proizvoljno supstituiran jednom ili više puta međusobno neovisno s R, heteroaril-, heteroaril- koji je proizvoljno supstituiran jednom ili više puta međusobno neovisno sa skupinom R, -C(=O)NH<sub>2</sub>, -C(=O)N(H)R', -C(=O)N(R')R'', -C(=O)OH, -C(=O)OR', -NH<sub>2</sub>, -NHR', -N(R')R'', -N(H)C(=O)R', -N(R')C(=O)R', -N(H)S(=O)R', -N(R')S(=O)R', -N(H)S(=O)<sub>2</sub>R', -N(R')S(=O)<sub>2</sub>R', -N=S(=O)(R')R'', -OH, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoksi-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalkoksi-, -OC(=O)R', -OC(=O)NH<sub>2</sub>, -OC(=O)NHR', -OC(=O)N(R')R'', -SH, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil-S-, -S(=O)R', -S(=O)<sub>2</sub>R', -S(=O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>NHR', -S(=O)<sub>2</sub>N(R')R'';



pri čemu \* označava točku vezanja navedene skupine s ostatkom molekule; i

R3 predstavlja supstituent odabran iz skupa koji sadrži:

- halogeni atom, skupine -CN, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalkil-, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkenil-, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkinil-, -C(=O)R', -C(=O)NH<sub>2</sub>, -C(=O)N(H)R', -C(=O)N(R')R'', -NH<sub>2</sub>, -NHR', -N(R')R'', -N(H)C(=O)R', -N(R')C(=O)R', -N(H)C(=O)NH<sub>2</sub>, -N(H)C(=O)NHR', -N(H)C(=O)N(R')R'', -N(R')C(=O)NH<sub>2</sub>, -N(R')C(=O)NHR', -N(R')C(=O)N(R')R'', -N(H)C(=O)OR', -N(R')C(=O)OR', -NO<sub>2</sub>, -N(H)S(=O)R', -N(R')S(=O)R', -N(H)S(=O)<sub>2</sub>R', -N(R')S(=O)<sub>2</sub>R', -N=S(=O)(R')R'', -OH, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoksi-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalkoksi-, -OC(=O)R', -SH, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil-S-, -S(=O)R', -S(=O)<sub>2</sub>R', -S(=O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>NHR', -S(=O)<sub>2</sub>N(R')R'', -S(=O)(=NR')R'';

R predstavlja supstituent odabran iz skupa koji sadrži:

- halogeni atom, skupine -CN, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalkil-, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkenil-, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkinil-, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-cikloalkil-, 3- do 10-člani heterocikloalkil-, aril-, heteroaril-, -C(=O)R', -C(=O)NH<sub>2</sub>, -C(=O)N(H)R', -C(=O)N(R')R'', -C(=O)OR', -NH<sub>2</sub>, -NHR', -N(R')R'', -N(H)C(=O)R', -N(R')C(=O)R', -N(H)C(=O)NH<sub>2</sub>, -N(H)C(=O)NHR', -N(H)C(=O)N(R')R'', -N(R')C(=O)NH<sub>2</sub>, -N(R')C(=O)NHR', -N(R')C(=O)N(R')R'', -N(H)C(=O)OR', -N(R')C(=O)OR', -NO<sub>2</sub>, -N(H)S(=O)R', -N(R')S(=O)R', -N(H)S(=O)<sub>2</sub>R', -N(R')S(=O)<sub>2</sub>R', -N=S(=O)(R')R'', -OH, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoksi-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalkoksi-, -OC(=O)R', -OC(=O)NH<sub>2</sub>, -OC(=O)NHR', -OC(=O)N(R')R'', -SH, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil-S-, -S(=O)R', -S(=O)<sub>2</sub>R', -S(=O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>NHR', -S(=O)<sub>2</sub>N(R')R'', -S(=O)(=NR')R'';

R' i R'' predstavljaju, međusobno neovisno, supstituent odabran od:

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalkil-;

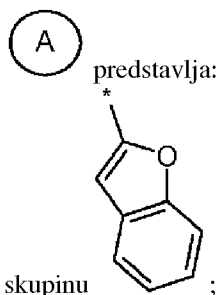
n predstavlja cijeli broj od 0, 1, 2, 3, 4 ili 5;

ili stereoisomer, tautomer, N-oksid, hidrat, solvat, ili njegova sol, ili smjesa istih.

2. Spoj prema zahtjevu 1, naznačen time da:

R1 predstavlja skupinu ravni C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkil-, ravni C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil-O-ravni C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil-, razgranati C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-alkil-, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cikloalkil, ravni C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cikloalkil- ili C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-cikloalkil-ravni C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil- koja je proizvoljno supstituirana, jednom ili više puta, međusobno neovisno, sa supstituentom odabranim iz skupa koji sadrži:

halogeni atom, -CN, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalkil-, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkenil-, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkinil-, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-cikloalkil- koji je proizvoljno povezan kao spiro, 3- do 10-člani heterocikloalkil koji je proizvoljno povezan kao spiro, aril-, aril koji je proizvoljno supstituiran jednom ili više puta međusobno neovisno sa R, heteroaril-, heteroaril- koji je proizvoljno supstituiran jednom ili više puta međusobno neovisno sa skupinom R, -C(=O)NH<sub>2</sub>, -C(=O)N(H)R', -C(=O)N(R')R'', -C(=O)OH, -C(=O)OR', -NH<sub>2</sub>, -NHR', -N(R')R'', -N(H)C(=O)R', -N(R')C(=O)R', -N(H)S(=O)R', -N(R')S(=O)R', -N(H)S(=O)<sub>2</sub>R', -N(R')S(=O)<sub>2</sub>R', -N=S(=O)(R')R'', -OH, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoksi-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalkoksi-, -OC(=O)R', -OC(=O)NH<sub>2</sub>, -OC(=O)NHR', -OC(=O)N(R')R'', -SH, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil-S-, -S(=O)R', -S(=O)<sub>2</sub>R', -S(=O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>NHR', -S(=O)<sub>2</sub>N(R')R'';



pri čemu \* označava točku vezanja navedene skupine s ostatkom molekule; i

R3 predstavlja supstituent odabran iz skupa koji sadrži:

halogeni atom, skupine -CN, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalkil-, -OH, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoksi-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalkoksi-;

R predstavlja supstituent odabran iz skupa koji sadrži:

halogeni atom, skupine -CN, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalkil-, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkenil-, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkinil-, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-cikloalkil-, 3- do 10-člani heterocikloalkil-, aril-, heteroaril-, -C(=O)R', -C(=O)NH<sub>2</sub>, -C(=O)N(H)R', -C(=O)N(R')R'', -C(=O)OR', -NH<sub>2</sub>, -NHR', -N(R')R'', -N(H)C(=O)R', -N(R')C(=O)R', -N(H)C(=O)NH<sub>2</sub>, -N(H)C(=O)NHR', -N(H)C(=O)N(R')R'', -N(R')C(=O)NH<sub>2</sub>, -N(R')C(=O)NHR', -N(R')C(=O)N(R')R'', -N(H)C(=O)OR', -N(R')C(=O)OR', -NO<sub>2</sub>, -N(H)S(=O)R', -N(R')S(=O)R', -N(H)S(=O)<sub>2</sub>R', -N(R')S(=O)<sub>2</sub>R', -N=S(=O)(R')R'', -OH, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoksi-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalkoksi-, -OC(=O)R', -OC(=O)NH<sub>2</sub>, -OC(=O)NHR', -OC(=O)N(R')R'', -SH, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil-S-, -S(=O)R', -S(=O)<sub>2</sub>R', -S(=O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>NHR', -S(=O)<sub>2</sub>N(R')R'', -S(=O)(=NR')R'';

R' i R'' predstavljaju, međusobno neovisno, supstituent odabran od:

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalkil-;

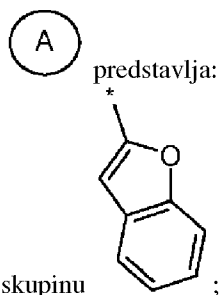
n predstavlja cijeli broj od 0, 1, 2, 3, 4 ili 5;

ili stereoisomer, tautomer, N-oksid, hidrat, solvat, ili njegova sol, ili smjesa istih.

### 3. Spoj prema zahtjevu 1 ili 2, naznačen time da:

R1 predstavlja skupinu ravni C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>-alkil-, ravni C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-alkil-O-ravni C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-alkil-, razgranati C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>-alkil-, C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>-cikloalkil, ravni C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil-C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>-cikloalkil- ili C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>-cikloalkil-ravni C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil- koja je proizvoljno supstituirana, jednom ili više puta, međusobno neovisno, sa supstituentom odabranim iz skupa koji sadrži:

halogeni atom, -CN, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalkil-, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkenil-, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkinil-, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-cikloalkil- koji je proizvoljno povezan kao spiro, 3- do 10-člani heterocikloalkil koji je proizvoljno povezan kao spiro, aril-, aril koji je proizvoljno supstituiran jednom ili više puta međusobno neovisno sa R, heteroaril-, heteroaril- koji je proizvoljno supstituiran jednom ili više puta međusobno neovisno sa skupinom R, -C(=O)NH<sub>2</sub>, -C(=O)N(H)R', -C(=O)N(R')R'', -C(=O)OH, -C(=O)OR', -NH<sub>2</sub>, -NHR', -N(R')R'', -N(H)C(=O)R', -N(R')C(=O)R', -N(H)S(=O)R', -N(R')S(=O)R', -N(H)S(=O)<sub>2</sub>R', -N(R')S(=O)<sub>2</sub>R', -N=S(=O)(R')R'', -OH, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoksi-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalkoksi-, -OC(=O)R', -OC(=O)NH<sub>2</sub>, -OC(=O)NHR', -OC(=O)N(R')R'', -SH, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil-S-, -S(=O)R', -S(=O)<sub>2</sub>R', -S(=O)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -S(=O)<sub>2</sub>NHR', -S(=O)<sub>2</sub>N(R')R'';



pri čemu \* označava točku vezanja navedene skupine s ostatkom molekule; i

R3 predstavlja supstituent odabran iz skupa koji sadrži:

halogeni atom, skupine -CN, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalkil-, -OH, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoksi-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalkoksi-;

R predstavlja supstituent odabran iz skupa koji sadrži:

halogeni atom, skupine -CN, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkil-, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-haloalkil-, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkenil-, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkinil-, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-cikloalkil-, 3- do 10-člani heterocikloalkil-, aril-, heteroaril-, -C(=O)R', -C(=O)NH<sub>2</sub>, -C(=O)N(H)R', -C(=O)N(R')R'', -C(=O)OR', -NH<sub>2</sub>, -NHR', -N(R')R'', -N(H)C(=O)R', -N(R')C(=O)R', -N(H)C(=O)NH<sub>2</sub>, -N(H)C(=O)NHR', -N(H)C(=O)N(R')R'', -N(R')C(=O)NH<sub>2</sub>, -N(R')C(=O)NHR', -N(R')C(=O)N(R')R'', -N(H)C(=O)OR', -

$N(R')C(=O)OR'$ ,  $-NO_2$ ,  $-N(H)S(=O)R'$ ,  $-N(R')S(=O)R'$ ,  $-N(H)S(=O)_2R'$ ,  $-N(R')S(=O)_2R'$ ,  $-N=S(=O)(R')R''$ ,  $-OH$ ,  $C_1-C_6$ -alkoksi-,  $C_1-C_6$ -haloalkoksi-,  $-OC(=O)R'$ ,  $-OC(=O)NH_2$ ,  $-OC(=O)NHR'$ ,  $-OC(=O)N(R')R''$ ,  $-SH$ ,  $C_1-C_6$ -alkil-S-,  $-S(=O)R'$ ,  $-S(=O)_2R'$ ,  $-S(=O)_2NH_2$ ,  $-S(=O)_2NHR'$ ,  $-S(=O)_2N(R')R''$ ,  $-S(=O)(=NR')R''$ ;

$R'$  i  $R''$  predstavljaju, međusobno neovisno, supstituent odabran od:

$C_1-C_6$ -alkil-,  $C_1-C_6$ -haloalkil-;

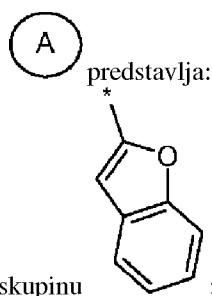
n predstavlja cijeli broj od 0, 1, 2, 3, 4 ili 5;

ili stereoisomer, tautomer, N-oksid, hidrat, solvat, ili njegova sol, ili smjesa istih.

4. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1, 2 ili 3 naznačen time da:

$R_1$  predstavlja skupinu ravni  $C_2-C_5$ -alkil-, ravni  $C_1-C_5$ -alkil-O-ravni  $C_1-C_5$ -alkil-, razgranati  $C_3-C_5$ -alkil-,  $C_4-C_6$ -cikloalkil, ravni  $C_1-C_6$ -alkil- $C_4-C_6$ -cikloalkil- ili  $C_4-C_6$ -cikloalkil- $C_1-C_6$ -alkil- koja je proizvoljno supstituirana, jednom ili više puta, međusobno neovisno, sa supstituentom odabranim iz skupa koji sadrži:

$-NH_2$ ,  $C_1-C_6$ -alkil-,  $C_2-C_6$ -alkenil-,  $C_3-C_{10}$ -cikloalkil- koji je proizvoljno povezan kao spiro, 3- do 10-člani heterocikloalkil koji je proizvoljno povezan kao spiro, aril- skupina, aril koji je proizvoljno supstituiran jednom ili više puta međusobno neovisno s R, heteroarilom-, ili heteroarilom- koji je proizvoljno supstituiran jednom ili više puta međusobno neovisno s R;



pri čemu \* označava točku vezanja navedene skupine s ostatkom molekule; i

$R_3$  predstavlja supstituent odabran iz skupa koji sadrži:

halogeni atom, skupine  $-CN$ ,  $C_1-C_6$ -alkil-,  $C_1-C_6$ -haloalkil-,  $-OH$ ,  $C_1-C_6$ -alkoksi-,  $C_1-C_6$ -haloalkoksi-;

R predstavlja supstituent odabran iz skupa koji sadrži:

halogeni atom, skupine  $-CN$ ,  $C_1-C_6$ -alkil-,  $C_1-C_6$ -haloalkil-,  $C_2-C_6$ -alkenil-,  $C_2-C_6$ -alkinil-,  $C_3-C_{10}$ -cikloalkil-, 3- do 10-člani heterocikloalkil-, aril-, heteroaril-,  $-C(=O)R'$ ,  $-C(=O)NH_2$ ,  $-C(=O)N(H)R'$ ,  $-C(=O)N(R')R''$ ,  $-C(=O)OR'$ ,  $-NH_2$ ,  $-NHR'$ ,  $-N(R')R''$ ,  $-N(H)C(=O)R'$ ,  $-N(R')C(=O)R'$ ,  $-N(H)C(=O)NH_2$ ,  $-N(H)C(=O)NHR'$ ,  $-N(H)C(=O)N(R')R''$ ,  $-N(R')C(=O)NH_2$ ,  $-N(R')C(=O)NHR'$ ,  $-N(R')C(=O)N(R')R''$ ,  $-N(H)C(=O)OR'$ ,  $-N(R')C(=O)OR'$ ,  $-NO_2$ ,  $-N(H)S(=O)R'$ ,  $-N(R')S(=O)R'$ ,  $-N(H)S(=O)_2R'$ ,  $-N(R')S(=O)_2R'$ ,  $-N=S(=O)(R')R''$ ,  $-OH$ ,  $C_1-C_6$ -alkoksi-,  $C_1-C_6$ -haloalkoksi-,  $-OC(=O)R'$ ,  $-OC(=O)NH_2$ ,  $-OC(=O)NHR'$ ,  $-OC(=O)N(R')R''$ ,  $-SH$ ,  $C_1-C_6$ -alkil-S-,  $-S(=O)R'$ ,  $-S(=O)_2R'$ ,  $-S(=O)_2NH_2$ ,  $-S(=O)_2NHR'$ ,  $-S(=O)_2N(R')R''$ ,  $-S(=O)(=NR')R''$ ;

$R'$  i  $R''$  predstavljaju, međusobno neovisno, supstituent odabran od:

$C_1-C_6$ -alkil-,  $C_1-C_6$ -haloalkil-;

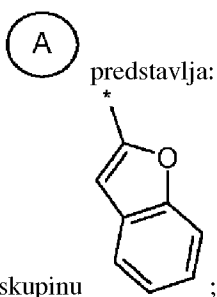
n predstavlja cijeli broj od 0, 1, 2, 3, 4 ili 5;

ili stereoisomer, tautomer, N-oksid, hidrat, solvat, ili njegova sol, ili smjesa istih.

5. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 4, naznačen time da:

$R_1$  predstavlja skupinu ravni  $C_2-C_5$ -alkil-, ravni  $C_1-C_5$ -alkil-O-ravni  $C_1-C_5$ -alkil-, razgranati  $C_3-C_5$ -alkil-,  $C_4-C_6$ -cikloalkil, ravni  $C_1-C_6$ -alkil- $C_4-C_6$ -cikloalkil- ili  $C_4-C_6$ -cikloalkil- $C_1-C_6$ -alkil- koja je proizvoljno supstituirana, jednom ili više puta, međusobno neovisno, sa supstituentom odabranim iz skupa koji sadrži:

$-NH_2$ ,  $C_2-C_6$ -alkenil-,  $C_3-C_{10}$ -cikloalkil- koji je proizvoljno povezan kao spiro, 3- do 10-člani heterocikloalkil koji je proizvoljno povezan kao spiro, aril, aril koji je proizvoljno supstituiran jednom ili više puta međusobno neovisno sa skupinom R, heteroaril-, ili heteroaril- koji je proizvoljno supstituiran jednom ili više puta međusobno neovisno sa R;



pri čemu \* označava točku vezanja navedene skupine s ostatkom molekule; i

$R_3$  predstavlja supstituent odabran iz skupa koji sadrži:

halogeni atom, skupinu  $C_1-C_6$ -alkoksi-, skupinu  $C_1-C_6$ -alkil-;

R predstavlja supstituent odabran iz skupa koji sadrži:

halogeni atom,  $C_1-C_6$ -haloalkil-,  $C_1-C_6$ -alkoksi-;

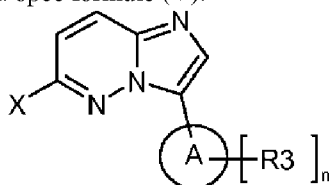
n predstavlja cijeli broj od 0 ili 1;

ili stereoisomer, tautomer, N-oksid, hidrat, solvat, ili njegova sol, ili smjesa istih.

6. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 5, naznačen time da je odabran iz skupine koja sadrži:

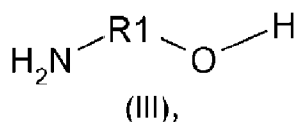
- 4-{[3-(4-metoksi-1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}butan-1-amin;  
 5 *trans*-3-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}ciklobutanamin;  
*cis*-3-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}ciklobutanamin;  
 3-{[3-(4-metoksi-1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}propan-1-amin;  
 2-{[3-(4-metoksi-1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}etanamin;  
 2-{[3-(5-metoksi-1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}etanamin;  
 10 (2*S*)-1-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}propan-2-amin;  
 4-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}butan-1-amin;  
 3-{[3-(5-metoksi-1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}propan-1-amin;  
 3-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}-3-metilbutan-1-amin;  
 3-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}propan-1-amin;  
 15 2-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}etanamin;  
 (2*R*)-2-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}propan-1-amin;  
 4-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}-2-metilbutan-2-amin;  
 (2*R*)-2-{[3-(5-kloro-1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}propan-1-amin;  
 (2*R*)-2-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}-2-feniletan-amin;  
 20 (1*S*)-2-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}-1-feniletan-amin;  
 (1*R*)-2-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}-1-feniletan-amin;  
 (1*S*)-2-{[3-(5-kloro-1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}-1-fenil-etanamin;  
 1-(*trans*-3-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}ciklobutil)-metanamin;  
 2-(2-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}etoksi)etanamin;  
 25 *trans*-3-({[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}metil)ciklo-butanamin;  
 (1*R*,2*R*)-2-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}cikloheksan-amin;  
 (1*S*,2*S*)-2-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}ciklopentan-amin;  
 (1*S*,2*R*)-2-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}ciklopentan-amin sol s mravljom kiselinom  
 2-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}-3-fenilpropan-1-amin sol s mravljom kiselinom  
 30 1-({[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}metil)ciklobutan-amin;  
 2-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}heks-5-en-1-amin;  
 1-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}-2-metilpropan-2-amin;  
 2-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}-2-ciklopropiletan-amin;  
 2-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}-3-(morfolin-4-il)-propan-1-amin;  
 35 2-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}-1-(tetrahidro-2*H*-piran-4-il)etanamin;  
 2-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}-4-metilpentan-1-amin;  
 2-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}propane-1,3-diamin;  
 2-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]pindazin-6-il]oksi}-2-(tetrahidrofuran-3-il)-etanamin;  
 40 *trans*-3-{[3-(4-fluoro-1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}ciklo-butanamin;  
*trans*-3-{[3-(5-kloro-1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}ciklo-butanamin;  
*trans*-3-{[3-(5-metoksi-1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}ciklo-butanamin;  
*trans*-3-{[3-(5-fluoro-1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}ciklo-butanamin;  
 3-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}-2-metilpropan-1-amin;  
 1-ciklopropil-2-{[3-(4-metoksi-1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}etanamin;  
 45 (2*R*)-1-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}propan-2-amin;  
 (2*R*)-1-{[3-(5-kloro-1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}propan-2-amin;  
 1-3-({[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}metil)oksetan-3-il)-metanamin;  
 (2*S*)-1-{[3-(4-fluoro-1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}propan-2-amin;  
 (1*S*)-2-{[3-(4-fluoro-1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}-1-fenil-etanamin;  
 50 (2*S*)-2-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}propan-1-amin;  
 (2*R*)-2-{[3-(7-fluoro-1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}propan-1-amin;  
 (2*R*)-2-{[3-(5-Metil-1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}propan-1-amin;  
 (2*S*)-1-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}-3-fenilpropan-2-amin;  
 1-({[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}metil)ciklopropan-amin;  
 55 3-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}-2-fenilpropan-1-amin;  
 2-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}-3-(4-fluorofenil)-propan-1-amin;  
 2-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}-3-(piridin-4-il)propan-1-amin;  
 (2*R*)-2-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}-2-(piridin-3-il)etanamin;  
 2-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}-2-(4-fluorofenil)etanamin;  
 60 2-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}-2-(piridin-2-il)etanamin;  
 2-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}-2-(3-isopropoksifenil)etanamin;  
 2-{[3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-*b*]piridazin-6-il]oksi}-2-[3-(trifluorometil)fenil]etanamin;

- 2-{{3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-b]piridazin-6-il}oksi}-2-(2,4-difluorofenil)etanamin;  
 (1S)-2-{{3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-b]piridazin-6-il}oksi}-1-(4-fluorofenil)etanamin;  
 (1S)-2-{{3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-b]piridazin-6-il}oksi}-1-(4-klorofenil)etanamin;  
 2-{{3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-b]piridazin-6-il}oksi}-1-(piridin-3-il)etanamin; i  
 3-{{3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-b]piridazin-6-il}oksi}-3-(4-fluorofenil)propan-1-amin,  
 ili stereoisomer, tautomer, N-oksid, hidrat, solvat, ili njegova sol, naročito njegova farmaceutski prihvatljiva sol.
7. Spoj prema zahtjevu 1, naznačen time da je trans-3-{{3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-b]piridazin-6-il}oksi}ciklobutanamin, ili stereoisomer, tautomer, N-oksid, hidrat, solvat, ili njegova sol, naročito njegova farmaceutski prihvatljiva sol.
8. Spoj prema zahtjevu 1, naznačen time da je (2S)-1-{{3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-b]piridazin-6-il}oksi}propan-2-amin, ili stereoisomer, tautomer, N-oksid, hidrat, solvat, ili njegova sol, naročito njegova farmaceutski prihvatljiva sol.
9. Spoj prema zahtjevu 1, naznačen time da je 3-{{3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-b]piridazin-6-il}oksi}-3-metilbutan-1-amin, ili stereoisomer, tautomer, N-oksid, hidrat, solvat, ili njegova sol, naročito njegova farmaceutski prihvatljiva sol.
10. Spoj prema zahtjevu 1, naznačen time da je (2R)-2-{{3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-b]piridazin-6-il}oksi}propan-1-amin, ili stereoisomer, tautomer, N-oksid, hidrat, solvat, ili njegova sol, naročito njegova farmaceutski prihvatljiva sol.
11. Spoj prema zahtjevu 1, naznačen time da je (1S)-2-{{3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-b]piridazin-6-il}oksi}-1-feniletanamin, ili stereoisomer, tautomer, N-oksid, hidrat, solvat, ili njegova sol, naročito njegova farmaceutski prihvatljiva sol.
12. Spoj prema zahtjevu 1, naznačen time da je trans-3-{{3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-b]piridazin-6-il}oksi}metilciklobutanamin, ili stereoisomer, tautomer, N-oksid, hidrat, solvat, ili njegova sol, naročito njegova farmaceutski prihvatljiva sol.
13. Spoj prema zahtjevu 1, naznačen time da je (1S,2S)-2-{{3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-b]piridazin-6-il}oksi}ciklopentanamin, ili stereoisomer, tautomer, N-oksid, hidrat, solvat, ili njegova sol, naročito njegova farmaceutski prihvatljiva sol.
14. Spoj prema zahtjevu 1, naznačen time da je 2-{{3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-b]piridazin-6-il}oksi}-4-metilpentan-1-amin, ili stereoisomer, tautomer, N-oksid, hidrat, solvat, ili njegova sol, naročito njegova farmaceutski prihvatljiva sol.
15. Spoj prema zahtjevu 1, naznačen time da je 3-{{3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-b]piridazin-6-il}oksi}-2-metilpropan-1-amin, ili stereoisomer, tautomer, N-oksid, hidrat, solvat, ili njegova sol, naročito njegova farmaceutski prihvatljiva sol.
16. Spoj prema zahtjevu 1, naznačen time da je (2R)-2-{{3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-b]piridazin-6-il}oksi}-2-(piridin-3-il)etanamin, ili stereoisomer, tautomer, N-oksid, hidrat, solvat, ili njegova sol, naročito njegova farmaceutski prihvatljiva sol.
17. Spoj prema zahtjevu 1, naznačen time da je (1S)-2-{{3-(1-benzofuran-2-il)imidazo[1,2-b]piridazin-6-il}oksi}-1-(4-fluorofenil)etanamin, ili stereoisomer, tautomer, N-oksid, hidrat, solvat, ili njegova sol, naročito njegova farmaceutski prihvatljiva sol.
18. Spoj prema zahtjevu 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16 ili 17, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.
19. Postupak dobivanja spoja opće formule (I) prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 6, te navedeni postupak obuhvaća korak omogućavanja da intermedijer spoja opće formule (V):

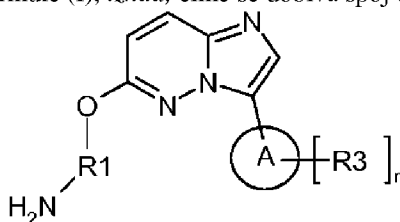


(V)

- u kojoj A, R3 i n su kako je definirano za spoj opće formule (I) prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 6, i X predstavlja halogeni atom, na primjer atom klora, broma ili joda, ili perfluoroalkilsulfonatnu skupinu, kao što je trifluorometilsulfonatna skupina ili nonafluorobutilsulfonatna skupina, reagira sa spojem s općom formulom (III):



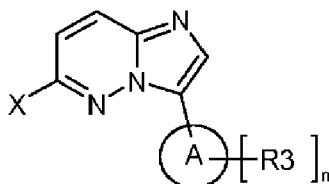
u kojoj R1 je definiran za spoj opće formule (I), *iznad*, čime se dobiva spoj opće formule (I):



(I)

u kojoj A, R1, R3 i n su definirani za spoj opće formule (I) prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 6.

20. Spoj opće formule (I), ili stereoizomer, tautomer, N-oksid, hidrat, solvat, ili njegova sol, naročito njegova farmaceutski prihvatljiva sol, ili njihova smjesa, prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 18, naznačen time da je za upotrebu za liječenje ili profilaksu bolesti.
21. Farmaceutski pripravak, naznačen time, da sadrži spoj opće formule (I), ili stereoizomer, tautomer, N-oksid, hidrat, solvat, ili njegova sol, naročito njegova farmaceutski prihvatljiva sol, ili njihova smjesa, prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 18, te farmaceutski prihvatljiv razrjeđivač ili nosač.
22. Farmaceutski kombinacija naznačena time da sadrži:  
- jedan ili više prvih aktivnih sastojaka odabranih iz spoja opće formule (I) prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 18, i  
- jedan ili više drugih aktivnih sastojaka odabranih od kemoterapeutskih sredstava protiv karcinoma.
23. Uporaba spoja s općom formulom (I), ili stereoizomera, tautomera, N-oksida, hidrata, solvata, ili njegove soli, naročito njegove farmaceutski prihvatljive soli, ili njihove smjese, prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 18, naznačena time da je za pripravu lijeka za profilaksu ili liječenje bolesti.
24. Uporaba prema zahtjevu 23, naznačena time da navedena bolest je bolest nekontroliranog staničnog rasta, proliferacije i/ili preživljavanja, neodgovarajućeg staničnog imunog odgovora, ili neprimjerenog staničnog upalnog odgovora, naročito u kojem su nekontrolirani rast stanica, proliferacija i/ili preživljavanje, neodgovarajući stanični imuni odgovor ili neodgovarajući stanični upalni odgovor posredovani pomoću MKNK-1 puta, osobito u kojem bolest nekontroliranog rasta stanica, proliferacija i/ili preživljavanje, neodgovarajući stanični imuni odgovor ili neodgovarajući stanični upalni odgovor je hematološki tumor, njegov solidni tumor i/ili metastaze, *npr.* leukemije i mijelodisplastični sindrom, maligni limfomi, tumori glave i vrata, uključujući tumore mozga i metastaze na mozgu, tumori prsnog koša uključujući tumore ne-malih stanica pluća i malih stanica pluća, gastrointestinalni tumori, endokrini tumori, tumori dojke i drugi ginekološki tumori, urološki tumori uključujući tumore bubrega, mokraćnog mjehura i prostate, tumori kože, te sarkomi, i/ili njihove metastaze.
25. Uporaba spoja s općom formulom (V):



(V)

u kojoj A, R3 i n su definirani za spoj opće formule (I) prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 6, i X predstavlja halogeni atom, na primjer atom klora, broma ili joda, ili perfluoroalkilsulfonatnu skupinu, kao što je trifluorometilsulfonatna skupina ili nonafluorobutilsulfonatna skupina, za pripravu spoja opće formule (I) prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 6.

26. Spoj za uporabu prema zahtjevu 20, naznačen time da navedena bolest je bolest nekontroliranog staničnog rasta, proliferacije i/ili preživljavanja, neodgovarajućeg staničnog imunog odgovora, ili neprimjerenog staničnog upalnog odgovora, naročito u kojem su nekontrolirani rast stanica, proliferacija i/ili preživljavanje, neodgovarajući stanični imuni odgovor ili neodgovarajući stanični upalni odgovor posredovani pomoću MKNK-1 puta, osobito u kojem bolest nekontroliranog rasta stanica, proliferacija i/ili preživljavanje, neodgovarajući stanični imuni odgovor ili neodgovarajući stanični upalni odgovor je hematološki tumor, njegov solidni tumor i/ili metastaze, *npr.* leukemije i mijelodisplastični sindrom, maligni limfomi, tumori glave i vrata, uključujući tumore mozga i metastaze na mozgu, tumori prsnog koša uključujući tumore ne-malih stanica pluća i malih stanica pluća, gastrointestinalni tumori, endokrini tumori, tumori dojke i drugi ginekološki tumori, urološki tumori uključujući tumore bubrega, mokraćnog mjehura i prostate, tumori kože, te sarkomi, i/ili njihove metastaze.