



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20161547 T1

HR P20161547 T1

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

(51) MKP:

A61K 31/444 (2006.01)
C07D 213/72 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 30.12.2016.

(21) Broj predmeta: P20161547T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 22.11.2016.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2013073637
Datum podnošenja međunarodne prijave: 12.11.2013.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 13792885.9
Datum podnošenja europske prijave patenta: 12.11.2013.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2014076091
Datum međunarodne objave: 22.05.2014.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2928878 A1
Datum objave europske prijave patenta: 14.10.2015.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2928878 B1
Datum objave europskog patenta: 02.11.2016.

(31) Broj prve prijave: 12192852

(32) Datum podnošenja prve prijave: 15.11.2012.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: EP

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelji:

Bayer Pharma Aktiengesellschaft, Müllerstrasse 178, 13353 Berlin, DE
Ulrich Lücking, Paula-Fürst-Strasse 2, 10317 Berlin, DE
Niels Böhnke, Sächsische Str. 41, 10713 Berlin, DE
Arne Scholz, Schönhauser Allee 170, 10435 Berlin, DE
Philip Lienau, Jahnstr. 13, 10967 Berlin, DE
Gerhard Siemeister, Reimerswalder Steig 26, 13503 Berlin, DE
Ulf Bömer, Leipziger Str. 49, 16548 Glienicke, DE
Dirk Kosemund, Klutstr. 14, 12587 Berlin, DE
Rolf Bohlmann, Kühler Weg 6a, 14055 Berlin, DE
Ludwig Zorn, Osianderweg 45a, 13509 Berlin, DE
PRODUCTA d.o.o., 10000 Zagreb, HR

(74) Zastupnik:

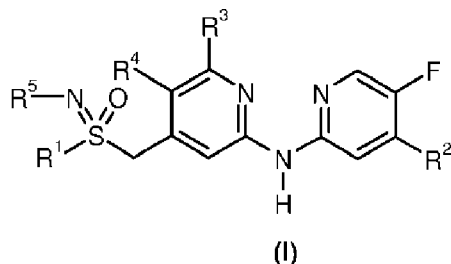
(54) Naziv izuma:

**DERIVATI 5-FLUOR-N-(PIRIDIN-2-IL)PIRIDIN-2-AMINA KOJI SADRŽE SULFOKSIMINSKU
SKUPINU**

HR P20161547 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

1. Spoj s općom formulom (I)

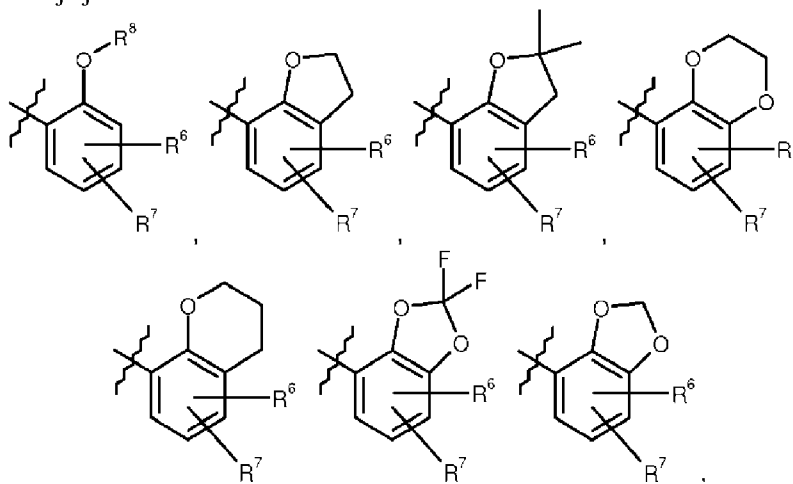


naznačen time da

R¹ predstavlja skupinu koja je odabrana iz skupa koji čine C₁-C₆-alkil-, C₃-C₇-cikloalkil-, heterociklil-, fenil, heteroaril, fenil-C₁-C₃-alkil- ili heteroaril-C₁-C₃-alkil-,

pri čemu je navedena skupina proizvoljno supstituirana s jednim ili dva ili tri supstituenta, identično ili različito, koji su odabrani iz skupine koju čine hidroksi, cijano, halogen, halo-C₁-C₃-alkil-, C₁-C₆-alkoksi-, C₁-C₃-fluoralkoksi-, -NH₂, alkilamino-, dialkilamino-, acetilamino-, *N*-metil-*N*-acetilamino-, ciklički amini, -OP(O)(OH)₂, -C(O)OH, -C(O)NH₂;

R² predstavlja skupinu koja je odabrana od



R³, R⁴ predstavljaju, međusobno neovisno, skupinu koja je odabrana od vodikovog atoma, fluorovog atoma, klorovog atoma, bromovog atoma, cijano, C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-alkoksi-, halo-C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-fluoralkoksi-;

R⁵ predstavlja skupinu koja je odabrana od vodikovog atoma, cijano, -C(O)R⁹, -C(O)OR⁹, -S(O)₂R⁹, -C(O)NR¹⁰R¹¹, -P(O)(OR¹²)₂, -CH₂OP(OR¹²)₂, C₁-C₆-alkil-, C₃-C₇-cikloalkil-, heterociklil-, fenil, heteroaril,

pri čemu je navedena skupina C₁-C₆-alkil-, C₃-C₇-cikloalkil-, heterociklil-, fenil ili heteroaril proizvoljno supstituirana s jednim, dva ili tri supstituenta, identično ili različito, odabranih iz skupa koji čine halogen, hidroksi, cijano, C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-alkoksi-, -NH₂, alkilamino-, dialkilamino-, acetilamino-, *N*-metil-*N*-acetilamino-, ciklički amini, halo-C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-fluoralkoksi-;

R⁶, R⁷ predstavljaju, međusobno neovisno, skupinu koja je odabrana od vodikovog atoma, fluorovog atoma, klorovog atoma, C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-alkoksi-, halo-C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-fluoralkoksi-;

R⁸ predstavlja skupinu koja je odabrana od

a) skupine C₁-C₆-alkil-, koja je proizvoljno supstituirana s jednim ili dva ili tri supstituenta, identično ili različito, odabranih iz skupa koji čine halogen, hidroksi, -NH₂, alkilamino-, dialkilamino-, acetilamino-, *N*-metil-*N*-acetilamino-, ciklički amini, cijano, C₁-C₃-alkil-, halo-C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-fluoralkoksi-, C₁-C₃-alkoksi-, C₂-C₃-alkenil-, C₂-C₃-alkinil-, C₃-C₇-cikloalkil-, heterociklil-, fenil, heteroaril, pri čemu je navedena skupina C₃-C₇-cikloalkil-, heterociklil-, fenil ili heteroaril proizvoljno supstituirana s jednim, dva ili tri supstituenta, identično ili različito, odabranih iz skupa koji čine halogen, hidroksi, C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-alkoksi-, -NH₂, alkilamino-, dialkilamino-, acetilamino-, *N*-metil-*N*-acetilamino-, ciklički amini, halo-C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-fluoralkoksi-;

b) skupine C₃-C₇-cikloalkil-, koja je proizvoljno supstituirana s jednim ili dva ili tri supstituenta, identično ili različito, koji su odabrani iz skupine koju čine halogen, hidroksi, -NH₂, alkilamino-, dialkilamino-, acetilamino-, *N*-metil-*N*-acetilamino-, ciklički amini, cijano, C₁-C₃-alkil-, halo-C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-fluoralkoksi-, C₁-C₃-alkoksi-, C₂-C₃-alkenil-, C₂-C₃-alkinil-;

c) skupine heterociklil-, koja je proizvoljno supstituirana s jednim ili dva ili tri supstituenta, identično ili različito, koji su odabrani iz skupine koju čine halogen, hidroksi, -NH₂, alkilamino-, dialkilamino-, acetilamino-, *N*-metil-*N*-

acetilamino-, ciklički amini, cijano, C₁-C₃-alkil-, halo-C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-fluoralkoksi-, C₁-C₃-alkoksi-, C₂-C₃-alkenil-, C₂-C₃-alkinil-;

d) fenilne skupine, koja je proizvoljno supstituirana s jednim ili dva ili tri supstituenta, identično ili različito, koji su odabrani iz skupine koju čine halogen, hidroksi, -NH₂, alkilamino-, dialkilamino-, acetilamino-, *N*-metil-*N*-acetilamino-, ciklički amini, cijano, C₁-C₃-alkil-, halo-C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-fluoralkoksi-, C₁-C₃-alkoksi-;

e) heteroarilne skupine, koja je proizvoljno supstituirana s jednim ili dva ili tri supstituenta, identično ili različito, koji su odabrani iz skupine koju čine halogen, hidroksi, -NH₂, alkilamino-, dialkilamino-, acetilamino-, *N*-metil-*N*-acetilamino-, ciklički amini, cijano, C₁-C₃-alkil-, halo-C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-fluoralkoksi-, C₁-C₃-alkoksi-;

f) skupine fenil-C₁-C₃-alkil-, čija je fenilna skupina proizvoljno supstituirana s jednim ili dva ili tri supstituenta, identično ili različito, koji su odabrani iz skupine koju čine halogen, hidroksi, -NH₂, alkilamino-, dialkilamino-, acetilamino-, *N*-metil-*N*-acetilamino-, ciklički amini, cijano, C₁-C₃-alkil-, halo-C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-fluoralkoksi-, C₁-C₃-alkoksi-;

g) skupine heteroaril-C₁-C₃-alkil-, čija je heteroarilna skupina proizvoljno supstituirana s jednim ili dva ili tri supstituenta, identično ili različito, koji su odabrani iz skupine koju čine halogen, hidroksi, -NH₂, alkilamino-, dialkilamino-, acetilamino-, *N*-metil-*N*-acetilamino-, ciklički amini, cijano, C₁-C₃-alkil-, halo-C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-fluoralkoksi-, C₁-C₃-alkoksi-;

h) skupine C₃-C₆-cikloalkil-C₁-C₃-alkil-, čija je skupina C₃-C₆-cikloalkil proizvoljno supstituirana s jednim ili dva ili tri supstituenta, identično ili različito, odabranim iz skupa koji čine halogen, C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-alkoksi-, halo-C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-fluoralkoksi-;

i) skupine heterociklil-C₁-C₃-alkil-, čija je heterociklilna skupina proizvoljno supstituirana s jednim ili dva ili tri supstituenta, identično ili različito, odabranim iz skupa koji čine halogen, C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-alkoksi-, halo-C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-fluoralkoksi-;

R⁹ predstavlja skupinu koja je odabrana od C₁-C₆-alkila-, halo-C₁-C₃-alkila-, C₃-C₇-cikloalkila-, heterociklila-, fenila, benzila ili heteroarila,

pri čemu je navedena skupina proizvoljno supstituirana s jednim, dva ili tri supstituenta, identično ili različito, odabranim iz skupa koji čine halogen, hidroksi, C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-alkoksi-, -NH₂, alkilamino-, dialkilamino-, acetilamino-, *N*-metil-*N*-acetilamino-, ciklički amini, halo-C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-fluoralkoksi-;

R¹⁰, R¹¹ predstavljaju, međusobno neovisno, skupinu koja je odabrana od vodik, C₁-C₆-alkil-, C₃-C₇-cikloalkil-, heterociklil-, fenil, benzil ili heteroaril,

pri čemu je navedena skupina C₁-C₆-alkil-, C₃-C₇-cikloalkil-, heterociklil-, fenil, benzil ili heteroaril proizvoljno supstituirana s jednim, dva ili tri supstituenta, identično ili različito, odabranim iz skupa koji čine halogen, hidroksi, C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-alkoksi-, -NH₂, alkilamino-, dialkilamino-, acetilamino-, *N*-metil-*N*-acetilamino-, ciklički amini, halo-C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-fluoralkoksi-, ili

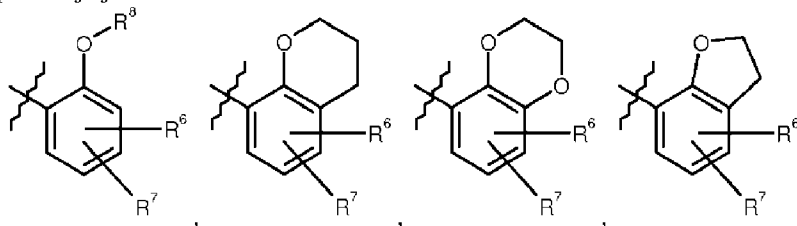
R¹⁰ i R¹¹, zajedno s atomom dušika na koji su oni vezani, tvore ciklički amin;

R¹² predstavlja skupinu koja je odabrana od vodika, C₁-C₄-alkila ili benzila, i njihovi enantiomeri, diastereomeri, soli, solvati ili soli solvata.

2. Spoj s općom formulom (I) prema zahtjevu 1, **naznačen time** da

R¹ predstavlja skupinu koja je odabrana od C₁-C₆-alkila-, C₃-C₅-cikloalkila-, pri čemu je navedena skupina proizvoljno supstituirana s jednim supstituentom odabranim iz skupine koju čine hidroksi, C₁-C₃-alkoksi-, halo-C₁-C₂-alkil-, C₁-C₂-fluoralkoksi-, -NH₂, alkilamino-, dialkilamino-, ciklički amini, -OP(O)(OH)₂, -C(O)OH, -C(O)NH₂;

R² predstavlja skupinu koja je odabrana od



R³ predstavlja vodikov atom, fluorov atom, klorov atom, bromov atom, ili skupinu C₁-C₃-alkil, C₁-C₃-alkoksi ili halo-C₁-C₃-alkil;

R⁴ predstavlja vodikov atom, fluorov atom, klorov atom, ili bromov atom;

R⁵ predstavlja skupinu koja je odabrana od vodikovog atoma, cijano, -C(O)R⁹, -C(O)OR⁹, -S(O)₂R⁹, -C(O)NR¹⁰R¹¹, -P(O)(OR¹²)₂, -CH₂OP(OR¹²)₂, C₁-C₆-alkil-, C₃-C₇-cikloalkil-, heterociklil-, fenil, heteroaril,

pri čemu je navedena skupina C₁-C₆-alkil-, C₃-C₇-cikloalkil-, heterociklil-, fenil ili heteroaril proizvoljno supstituirana s jednim, dva ili tri supstituenta, identično ili različito, odabranim iz skupa koji čine halogen, hidroksi, cijano, C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-alkoksi-, -NH₂, alkilamino-, dialkilamino-, acetilamino-, *N*-metil-*N*-acetilamino-, ciklički amini, halo-C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-fluoralkoksi-;

R⁶, R⁷ predstavljaju, međusobno neovisno, skupinu koja je odabrana od vodikovog atoma, fluorovog atoma, klorovog atoma, C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-alkoksi-, halo-C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-fluoralkoksi-;

R⁸ predstavlja skupinu koja je odabrana od

a) skupine C₁-C₆-alkil, koja je proizvoljno supstituirana s jednim ili dva ili tri supstituenta, identično ili različito, odabranim iz skupa koji čine halogen, hidroksi, dialkilamino-, acetilamino-, *N*-metil-*N*-acetilamino-, ciklički amini, cijano, C₁-C₃-alkil-, halo-C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-fluoralkoksi-, C₁-C₃-alkoksi-, C₃-C₇-cikloalkil-, heterociklil-, fenil, heteroaril, pri čemu navedena skupina C₃-C₇-cikloalkil-, heterociklil-, fenil ili heteroaril je proizvoljno supstituirana s jednim, dva ili tri supstituenta, identično ili različito, odabranim iz skupa koji čine halogen, hidroksi, C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-alkoksi-, dialkilamino-, acetilamino-, *N*-metil-*N*-acetilamino-, ciklički amini, halo-C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-fluoralkoksi-;

b) skupine fenil-C₁-C₃-alkil-, čija je fenilna skupina proizvoljno supstituirana s jednim ili dva ili tri supstituenta, identično ili različito, koji su odabrani iz skupine koju čine halogen, hidroksi, dialkilamino-, acetilamino-, *N*-metil-*N*-acetilamino-, ciklički amini, cijano, C₁-C₃-alkil-, halo-C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-fluoralkoksi-, C₁-C₃-alkoksi-;

c) skupine heteroaril-C₁-C₃-alkil-, čija je heteroarilna skupina proizvoljno supstituirana s jednim ili dva ili tri supstituenta, identično ili različito, koji su odabrani iz skupine koju čine halogen, hidroksi, dialkilamino-, acetilamino-, *N*-metil-*N*-acetilamino-, ciklički amini, cijano, C₁-C₃-alkil-, halo-C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-fluoralkoksi-, C₁-C₃-alkoksi-;

d) skupine C₃-C₆-cikloalkil-C₁-C₃-alkil-, čija je skupina C₃-C₆-cikloalkil proizvoljno supstituirana s jednim ili dva ili tri supstituenta, identično ili različito, odabranim iz skupa koji čine halogen, C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-alkoksi-, halo-C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-fluoralkoksi-;

e) skupine heterociklil-C₁-C₃-alkil-, čija je heterociklilna skupina proizvoljno supstituirana s jednim ili dva ili tri supstituenta, identično ili različito, odabranim iz skupa koji čine halogen, C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-alkoksi-, halo-C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-fluoralkoksi-;

R⁹ predstavlja skupinu koja je odabrana iz skupa koji čine C₁-C₆-alkil-, halo-C₁-C₃-alkil-, C₃-C₇-cikloalkil-, heterociklil-, fenil, benzil ili heteroaril,

pri čemu je navedena skupina proizvoljno supstituirana s jednim, dva ili tri supstituenta, identično ili različito, odabranim iz skupa koji čine halogen, hidroksi, C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-alkoksi-, -NH₂, alkilamino-, dialkilamino-, acetilamino-, *N*-metil-*N*-acetilamino-, ciklički amini, halo-C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-fluoralkoksi-;

R¹⁰, R¹¹ predstavljaju, međusobno neovisno, skupinu koja je odabrana iz skupa koji čine vodik, C₁-C₆-alkil-, C₃-C₇-cikloalkil-, heterociklil-, benzil, fenil ili heteroaril,

pri čemu navedena skupina C₁-C₆-alkil-, C₃-C₇-cikloalkil-, heterociklil-, benzil, fenil ili heteroaril je proizvoljno supstituirana s jednim, dva ili tri supstituenta, identično ili različito, odabranim iz skupa koji čine halogen, hidroksi, C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-alkoksi-, -NH₂, alkilamino-, dialkilamino-, acetilamino-, *N*-metil-*N*-acetilamino-, ciklički amini, halo-C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-fluoralkoksi-, ili

R¹⁰ i R¹¹, zajedno s atomom dušika na koji su oni vezani, tvore ciklički amin;

R¹² predstavlja skupinu koja je odabrana od vodika ili C₁-C₄-alkila,

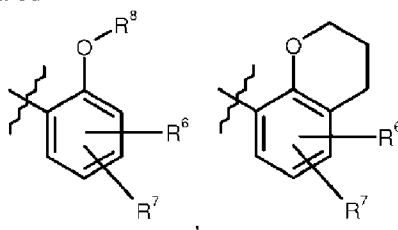
i njihovi enantiomeri, diastereomeri, soli, solvati ili soli solvata.

3. Spoj s općom formulom (I) prema zahtjevu 1, **naznačen time** da

R¹ predstavlja skupinu C₁-C₆-alkil- ili C₃-C₅-cikloalkil,

pri čemu je navedena skupina proizvoljno supstituirana s jednim supstituentom odabranim iz skupine koju čine hidroksi, C₁-C₃-alkoksi-, -NH₂, alkilamino-, dialkilamino-, ciklički amini, -OP(O)(OH)₂;

R² predstavlja skupinu koja je odabrana od



R³ predstavlja vodikov atom, fluorov atom ili klorov atom, ili skupinu C₁-C₃-alkil, C₁-C₃-alkoksi ili fluor-C₁-C₃-alkil;

R⁴ predstavlja vodikov atom, fluorov atom ili bromov atom;

R⁵ predstavlja skupinu koja je odabrana od vodikovog atoma, cijano, -C(O)R⁹, -C(O)OR⁹, -C(O)NR¹⁰R¹¹, -P(O)(OR¹²)₂, -CH₂OP(O)(OR¹²)₂ ili C₁-C₃-alkil-,

pri čemu navedena skupina C₁-C₃-alkil je proizvoljno supstituirana s jednim supstituentom, odabranim iz skupa koji čine -NH₂, alkilamino-, dialkilamino-, ili ciklički amini;

R⁶, R⁷ predstavljaju, međusobno neovisno, skupinu koja je odabrana od vodikovog atoma, fluorovog atoma ili klorovog atoma;

R⁸ predstavlja skupinu koja je odabrana od

a) skupine C₁-C₃-alkil, koja je proizvoljno supstituirana s jednim ili dva ili tri supstituenta, identično ili različito, odabranim iz skupa koji čine halogen, halo-C₁-C₃-alkil-;

b) skupine fenil-C₁-C₃-alkil-, čija je fenilna skupina proizvoljno supstituirana s jednim ili dva ili tri supstituenta, identično ili različito, koji su odabrani iz skupine koju čine halogen, cijano, C₁-C₃-alkil-, halo-C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-fluoralkoksi-, C₁-C₃-alkoksi-;

c) skupine heteroaril-C₁-C₃-alkil-, čija je heteroarilna skupina proizvoljno supstituirana s jednim ili dva supstituenta, identično ili različito, odabranim iz skupa koji čine halogen, cijano, C₁-C₃-alkil-, halo-C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-fluoralkoksi-, C₁-C₃-alkoksi-;

R⁹ predstavlja skupinu koja je odabrana od skupine C₁-C₃-alkil-, halo-C₁-C₃-alkil-, ili benzil, čija je fenilna skupina proizvoljno supstituirana s jednim ili dva supstituenta, identično ili različito, odabranim iz skupa koji čine halogen, C₁-C₃-alkil-, C₁-C₃-alkoksi-, -NH₂, alkilamino-, dialkilamino-;

R¹⁰, R¹¹ predstavljaju, međusobno neovisno, skupinu koja je odabrana od vodika, C₁-C₃-alkila-, benzila, ili R¹⁰ i R¹¹, zajedno s atomom dušika na koji su oni vezani, tvore ciklički amin;

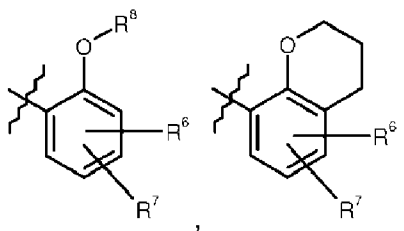
R¹² predstavlja skupinu koja je odabrana od vodika ili C₁-C₂-alkila, i njihovi enantiomeri, diastereomeri, soli, solvati ili soli solvata.

4. Spoj s općom formulom (I) prema zahtjevu 1, **naznačen time** da

R¹ predstavlja skupinu C₁-C₆-alkil,

pri čemu je navedena skupina proizvoljno supstituirana s jednim supstituentom, odabranim iz skupa koji čine hidroksi, C₁-C₃-alkoksi, -NH₂, alkilamino-, dialkilamino-, ili ciklički amini;

R² predstavlja skupinu koja je odabrana od



R³ predstavlja vodikov atom, fluorov atom ili klorov atom, ili skupinu metil, metoksi, difluormetil ili trifluormetil;

R⁴ predstavlja vodikov atom ili bromov atom;

R⁵ predstavlja skupinu koja je odabrana od vodikovog atoma, cijano, -C(O)R⁹, -C(O)OR⁹, -C(O)NR¹⁰R¹¹;

R⁶, R⁷ predstavljaju, međusobno neovisno, skupinu koja je odabrana od vodikovog atoma, fluorovog atoma ili klorovog atoma;

R⁸ predstavlja skupinu C₁-C₃-alkil;

R⁹ predstavlja skupinu C₁-C₃-alkil, skupinu benzil, ili trifluormetil;

R¹⁰, R¹¹ predstavljaju, međusobno neovisno, skupinu koja je odabrana od vodika, C₁-C₂-alkila-;

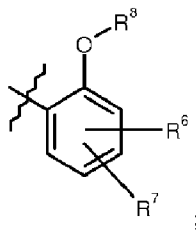
i njihovi enantiomeri, diastereomeri, soli, solvati ili soli solvata.

5. Spoj s općom formulom (I) prema zahtjevu 1, **naznačen time** da

R¹ predstavlja skupinu C₁-C₃-alkil,

pri čemu je navedena skupina proizvoljno supstituirana s jednim supstituentom, odabranim iz skupine koju čine hidroksi, -NH₂;

R² predstavlja skupinu



R³ predstavlja vodikov atom, fluorov atom ili klorov atom, ili skupinu metil, metoksi, difluormetil ili trifluormetil;

R⁴ predstavlja vodikov atom ili bromov atom;

R⁵ predstavlja skupinu koja je odabrana od vodikovog atoma, cijano, -C(O)R⁹, -C(O)OR⁹, -C(O)NR¹⁰R¹¹;

R⁶ predstavlja fluorov atom;

R⁷ predstavlja vodik;

R⁸ predstavlja skupinu metil ili etil;

R⁹ predstavlja skupinu metil, etil ili trifluormetil;

R¹⁰, R¹¹ predstavljaju, međusobno neovisno, skupinu koja je odabrana od vodika, C₁-C₂-alkila-;

i njihovi enantiomeri, diastereomeri, soli, solvati ili soli solvata.

6. Spoj s općom formulom (I) prema zahtjevu 1, **naznačen time** da

R¹ predstavlja skupinu metil, etil, 2-hidroksietil ili 2-aminoetil;

R² predstavlja skupinu 4-fluor-2-metoksifenil ili 4-fluor-2-etoksifenil;

R³ predstavlja vodikov atom, fluorov atom ili klorov atom, ili skupinu metil, metoksi, difluormetil ili trifluormetil;

R⁴ predstavlja vodikov atom ili bromov atom;

R⁵ predstavlja vodikov atom, ili skupinu koja je odabrana od cijano, -C(O)CH₃, -C(O)CF₃, -C(O)OC₂H₅, -C(O)N(H)C₂H₅;

i njihovi enantiomeri, diastereomeri, soli, solvati ili soli solvata.

7. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time** da je

- (*rac*)-5-fluor-4-(4-fluor-2-metoksifenil)-*N*-{4-[(*S*-metilsulfonimidoil)metil]piridin-2-il}piridin-2-amin;
- (+)-5-fluor-4-(4-fluor-2-metoksifenil)-*N*-{4-[(*S*-metilsulfonimidoil)metil]piridin-2-il}piridin-2-amin;
- (-)-5-fluor-4-(4-fluor-2-metoksifenil)-*N*-{4-[(*S*-metilsulfonimidoil)metil]piridin-2-il}piridin-2-amin;
- 5 - (*rac*)-5-fluor-4-(4-fluor-2-metoksifenil)-*N*-{6-metil-4-[(*S*-metilsulfonimidoil)metil]piridin-2-il}piridin-2-amin;
- (*rac*)-5-brom-*N*-[5-fluor-4-(4-fluor-2-metoksifenil)piridin-2-il]-6-metil-4-[(*S*-metilsulfonimidoil)metil]piridin-2-amin;
- (*rac*)-5-fluor-4-(4-fluor-2-metoksifenil)-*N*-{6-metoksi-4-[(*S*-metilsulfonimidoil)metil]piridin-2-il}piridin-2-amin;
- (*rac*)-*N*-{6-klor-4-[(*S*-metilsulfonimidoil)metil]piridin-2-il}-5-fluor-4-(4-fluor-2-metoksifenil)piridin-2-amin;
- 10 - (*rac*)-2-{*S*-[(2-[[5-fluor-4-(4-fluor-2-metoksifenil)piridin-2-il]amino]piridin-4-il)metil]sulfonimidoil}etanol;
- (*rac*)-*N*-(4-{*S*-(2-aminoetil)sulfonimidoil}metil)piridin-2-il)-5-fluor-4-(4-fluor-2-metoksifenil)piridin-2-amin;
- {[2-[[5-fluor-4-(4-fluor-2-metoksifenil)piridin-2-il]amino]piridin-4-il)metil](metil)oksidol⁶-sulfaniliden}cijanamid;
- (*rac*)-etil{[(2-[[5-fluor-4-(4-fluor-2-metoksifenil)piridin-2-il]amino]piridin-4-il)metil](metil)oksidol⁶-sulfaniliden}karbamat;
- 15 - (*rac*)-1-etil-3-[[2-[[5-fluor-4-(4-fluor-2-metoksifenil)piridin-2-il]amino]piridin-4-il)metil](metil)oksidol⁶-sulfaniliden}urea;
- (*rac*)-*N*-{[(2-[[5-fluor-4-(4-fluor-2-metoksifenil)piridin-2-il]amino]piridin-4-il)metil](metil)oksidol⁶-sulfaniliden}acetamid;
- 20 - 5-fluor-4-(4-fluor-2-metoksifenil)-*N*-{4-[(*S*-metilsulfonimidoil)metil]piridin-2-il}piridin-2-amin hidroklorid; enantiomer 2;
- (*rac*)-etil{[(2-[[5-fluor-4-(4-fluor-2-metoksifenil)piridin-2-il]amino]-6-metoksi-4-il)metil](metil)oksidol⁶-sulfaniliden}karbamat;
- 5-fluor-4-(4-fluor-2-metoksifenil)-*N*-{4-[(*S*-metilsulfonimidoil)metil]piridin-2-il}piridin-2-amin hidroklorid; enantiomer 1;
- 25 - (*rac*)-5-fluor-4-(4-fluor-2-metoksifenil)-*N*-{6-fluor-4-[(*S*-metilsulfonimidoil)metil]piridin-2-il}piridin-2-amin;
- (*rac*)-2,2,2-trifluor-*N*-{[(2-fluor-6-[[5-fluor-4-(4-fluor-2-metoksifenil)piridin-2-il]amino]piridin-4-il)metil](metil)oksidol⁶-sulfaniliden}acetamid;
- (+)-5-fluor-4-(4-fluor-2-metoksifenil)-*N*-{6-fluor-4-[(*S*-metilsulfonimidoil)metil]piridin-2-il}piridin-2-amin;
- 30 - (-)-5-fluor-4-(4-fluor-2-metoksifenil)-*N*-{6-fluor-4-[(*S*-metilsulfonimidoil)metil]piridin-2-il}piridin-2-amin;
- (*rac*)-5-fluor-4-(4-fluor-2-metoksifenil)-*N*-{4-[(*S*-metilsulfonimidoil)metil]-6-(trifluormetil)piridin-2-il}piridin-2-amin;
- (+)-5-fluor-4-(4-fluor-2-metoksifenil)-*N*-{4-[(*S*-metilsulfonimidoil)metil]-6-(trifluormetil)piridin-2-il}piridin-2-amin;
- 35 - (-)-5-fluor-4-(4-fluor-2-metoksifenil)-*N*-{4-[(*S*-metilsulfonimidoil)metil]-6-(trifluormetil)piridin-2-il}piridin-2-amin;
- (+)-2,2,2-trifluor-*N*-{[(2-[[5-fluor-4-(4-fluor-2-metoksifenil)piridin-2-il]amino]-6-(trifluormetil)-piridin-4-il)metil](metil)oksidol⁶-sulfaniliden}acetamid;
- (-)-2,2,2-trifluor-*N*-{[(2-[[5-fluor-4-(4-fluor-2-metoksifenil)piridin-2-il]amino]-6-(trifluormetil)-piridin-4-il)metil](metil)oksidol⁶-sulfaniliden}acetamid;
- 40 - (*rac*)-4-(2-etoksi-4-fluorfenil)-5-fluor-*N*-{6-fluor-4-[(*S*-metilsulfonimidoil)metil]piridin-2-il}piridin-2-amin;
- (*rac*)-*N*-{[(2-[[4-(2-etoksi-4-fluorfenil)-5-fluorpiridin-2-il]amino]-6-fluorpiridin-4-il)metil]-(metil)oksidol⁶-sulfaniliden}-2,2,2-trifluoracetamid;
- (+)-4-(2-etoksi-4-fluorfenil)-5-fluor-*N*-{6-fluor-4-[(*S*-metilsulfonimidoil)metil]piridin-2-il}piridin-2-amin;
- 45 - (-)-4-(2-etoksi-4-fluorfenil)-5-fluor-*N*-{6-fluor-4-[(*S*-metilsulfonimidoil)metil]piridin-2-il}piridin-2-amin;
- (*rac*)-*N*-{4-[(*S*-etilsulfonimidoil)-metil]piridin-2-il}-5-fluor-4-(4-fluor-2-metoksifenil)piridin-2-amin;
- (*rac*)-*N*-{6-(difluormetil)-4-[(*S*-metilsulfonimidoil)metil]piridin-2-il}-5-fluor-4-(4-fluor-2-metoksifenil)piridin-2-amin;
- (+)-5-fluor-4-(4-fluor-2-metoksifenil)-*N*-{6-metil-4-[(*S*-metilsulfonimidoil)metil]piridin-2-il}piridin-2-amin;
- 50 - (-)-5-fluor-4-(4-fluor-2-metoksifenil)-*N*-{6-metil-4-[(*S*-metilsulfonimidoil)metil]piridin-2-il}piridin-2-amin, i njihovi enantiomeri, diastereomeri, soli, solvati ili soli solvata.

8. Spoj s općom formulom (I) prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 7, **naznačen time** da je za liječenje i/ili profilaksu hiper-proliferativnih poremećaja, virusno induciranih zaraznih bolesti i/ili kardiovaskularnih bolesti.

9. Spoj s općom formulom (I) prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 7, **naznačen time** da je za liječenje i/ili profilaksu karcinoma pluća, karcinoma prostate, karcinoma grlića maternice, karcinoma debelog crijeva, melanoma, karcinoma jajnika ili leukemija.

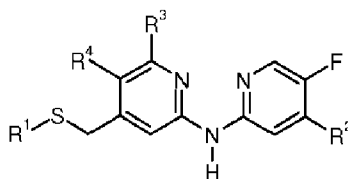
10. Farmaceutska kombinacija, **naznačena time** da sadrži spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 7 u kombinaciji s barem jednim ili više dodanih aktivnih sastojaka.

11. Farmaceutski pripravak, **naznačen time** da sadrži spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 7 u kombinaciji s inertnim, netoksičnim, farmaceutski prikladnim pomoćnim sredstvom.

12. Farmaceutska kombinacija prema zahtjevu 10, **naznačena time** da je za liječenje i/ili profilaksu hiper-proliferativnih poremećaja, virusno induciranih zaraznih bolesti i/ili kardiovaskularnih bolesti.

13. Farmaceutski pripravak prema zahtjevu 11, **naznačen time** da je za liječenje i/ili profilaksu hiper-proliferativnih poremećaja, virusno induciranih zaraznih bolesti i/ili kardiovaskularnih bolesti.

14. Spoj s općom formulom (5)

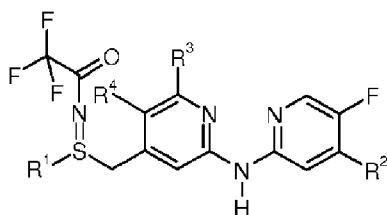


5

5 **naznačen time** da R^1 , R^2 , R^3 i R^4 su kako je definirano prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 6 za spojeve s općom formulom (I),

ili njegova sol, solvat ili sol solvata.

15. Spoj s općom formulom (6)

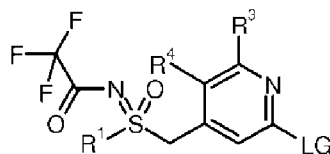


6

10 **naznačen time** da R^1 , R^2 , R^3 i R^4 su kako je definirano prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 6 za spojeve s općom formulom (I),

ili njegov enantiomer, diastereomer, sol, solvat, ili sol solvata.

16. Spoj s općom formulom (14)

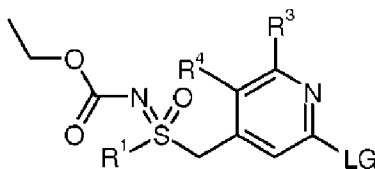


14

15 **naznačen time** da R^1 , R^3 i R^4 su kako je definirano prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 6 za spojeve s općom formulom (I), i pri čemu LG označava izlaznu skupinu,

ili enantiomer, diastereomer, sol, solvat, ili sol njegovog solvata.

17. Spoj s općom formulom (16)



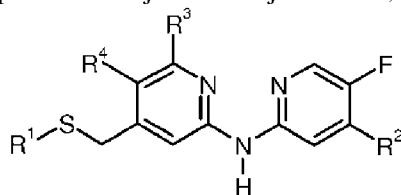
16

20 **naznačen time** da R^1 , R^3 i R^4 su kako je definirano prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 6 za spojeve s općom formulom (I), i pri čemu LG označava izlaznu skupinu,

ili enantiomer, diastereomer, sol, solvat, ili sol njegovog solvata.

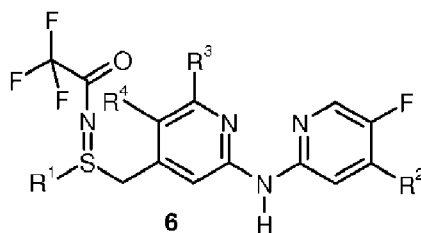
18. Postupak za dobivanje spoja s formulom (6), u kojem R^1 , R^2 , R^3 , i R^4 su kako je definirano za spoj formule (I) prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 6, **naznačen time** da u postupku spoj s formulom (5), u kojem R^1 , R^2 , R^3 , i R^4 su kako

25 je definirano za spoj s formulom (I) prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 6,



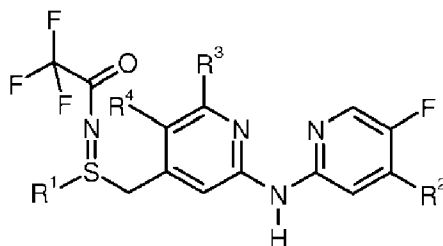
5

reagira s trifluoracetamidom i 1,3-dibromo-5,5-dimetilhidantoinom u prisutnosti alkalijske soli *tert*-butanola u cikličkom eteru kao otapalu, da se dobije spoj s formulom (6),



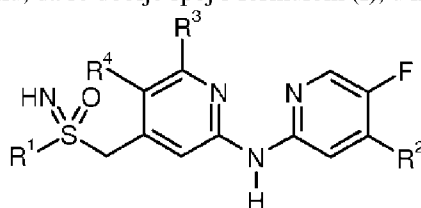
i u navedenom postupku se nastali spoj proizvoljno, ako je prikladno, prevodi s odgovarajućim (i) otapalima i/ili (ii) bazama ili kiselinama u solvate, soli i/ili solvate njihovih soli.

19. Postupak za dobivanje spoja s formulom (I), prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 7, **naznačen time** da u navedenom postupku spoj s formulom (6), u kojem R^1 , R^2 , R^3 , i R^4 su kako je definirano za spoj formule (I) prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 6,



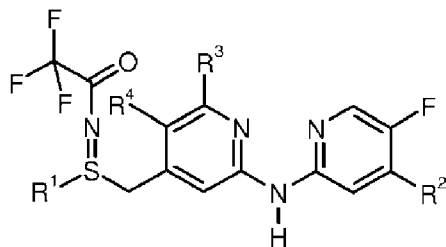
oksidira s alkalijskom soli permanganske kiseline u alifatskom ketonu s formulom $C_1-C_2-C(O)-C_1-C_2$ -alkil kao otapalom,

nakon čega slijedi, ako u gore navedenom procesu oksidacije trifluoracetilna skupina koja je prisutna u spoju s formulom (6) nije odcijepljena, uklanjanje navedene trifluoracetilne skupine obradom dobivenog intermedijera sa pogodnom bazom u alkoholnom otapalu, da se dobije spoj s formulom (I), u kojem R^3 je vodik,

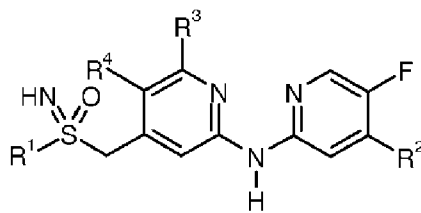


i u navedenom postupku se nastali spoj proizvoljno, ako je prikladno, prevodi s odgovarajućim (i) otapalima i/ili (ii) bazama ili kiselinama u solvate, soli i/ili solvate njihovih soli.

20. Postupak za dobivanje spoja s formulom (I), prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 7, **naznačen time** da u navedenom postupku spoj s formulom (6), u kojem R^1 , R^2 , R^3 , i R^4 su kako je definirano za spoj s formulom (I) prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 6,



oksidira s oksidansom koji se temelji na peroksimonosulfatu u otapalu koje se bira iz skupa koji čine alifatski alkohol s formulom C_1-C_3 -alkil-OH, voda, i *N,N*-dimetilformamid, ili njihova smjesa, da se dobije spoj s formulom (I), u kojem R^5 je vodik,



(I); R⁵ = H

i u navedenom postupku se nastali spoj proizvoljno, ako je prikladno, prevodi s odgovarajućim (i) otapalima i/ili (ii) bazama ili kiselinama u solvate, soli i/ili solvate njihovih soli.