

(19)



SUOMI - FINLAND  
(FI)

**PATENTTI- JA REKISTERIHALLITUS**  
**PATENT- OCH REGISTERSTYRELSEN**  
**FINNISH PATENT AND REGISTRATION OFFICE**

(10)

**EP/EP3661941 T3**

(12)

**EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS**  
**ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT**  
**TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION**

(45)

Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning -  
Translation available to the public

**23.03.2023**

(97)

Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för  
det europeiska patentet - Date of grant of European patent

**14.12.2022**

(96)

Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan -  
European patent application

EP18733649.0

Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date

(97)

Patenttihakemuksen julkiseksitulopäivä - Patentansökans  
publiceringsdag - Patent application available to the public

**10.06.2020**

(86)

Kansainvälinen hakemus - Internationell  
ansökan - International application

**02.07.2018 PCT/EP2018067797**

(30)

Etuoikeus - Prioritet - Priority

01.08.2017 EP EP17184272

(73)

Haltija - Innehavare - Holder

**1• Merck Patent GmbH**, Frankfurter Strasse 250, 64293 Darmstadt, (DE)

(72)

Keksijä - Uppfinnare - Inventor

**1• TANZER, Eva-Maria**, 187 41st Street, Sacramento, CA 95819, (US)

**2• SCHIEMANN, Kai**, Am Roedergraben 8, 64342 Seeheim-Jugenheim, (DE)

**3• KLEIN, Markus**, Lindenweg 35, 64291 Darmstadt, (DE)

(74)

Asiamies - Ombud - Agent

**Kolster Oy Ab**, Salmisaarenaukio 1, 00180 Helsinki, (FI)

(54)

Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

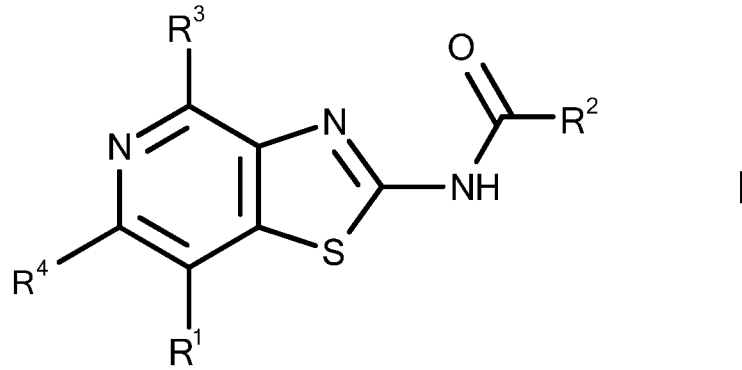
**Tiazolopyridiinijohdannaisia adenosinireseptoriantagonisteina**

**Tiazolopyridinderivat som adenosinreceptorantagonister**

**THIAZOLOPYRIDINE DERIVATIVES AS ADENOSINE RECEPTOR ANTAGONISTS**

## Patenttivaatimukset

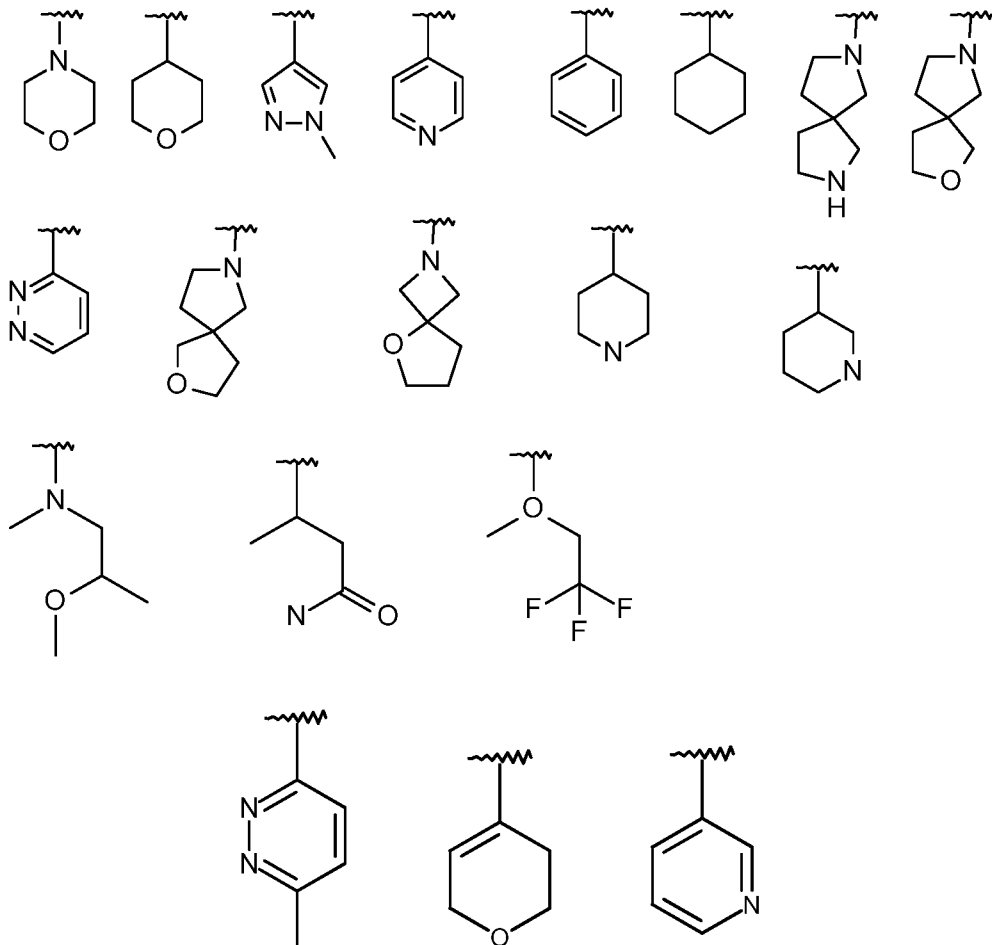
1. Yhdiste, jolla on kaava I

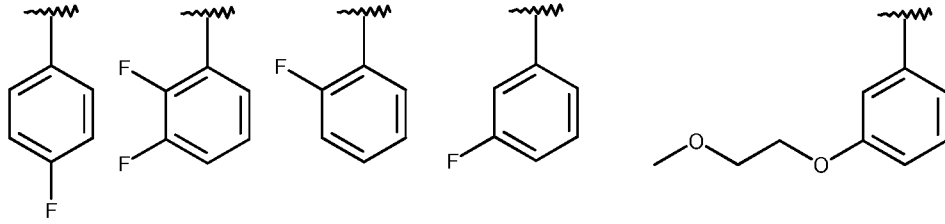


jossa

5

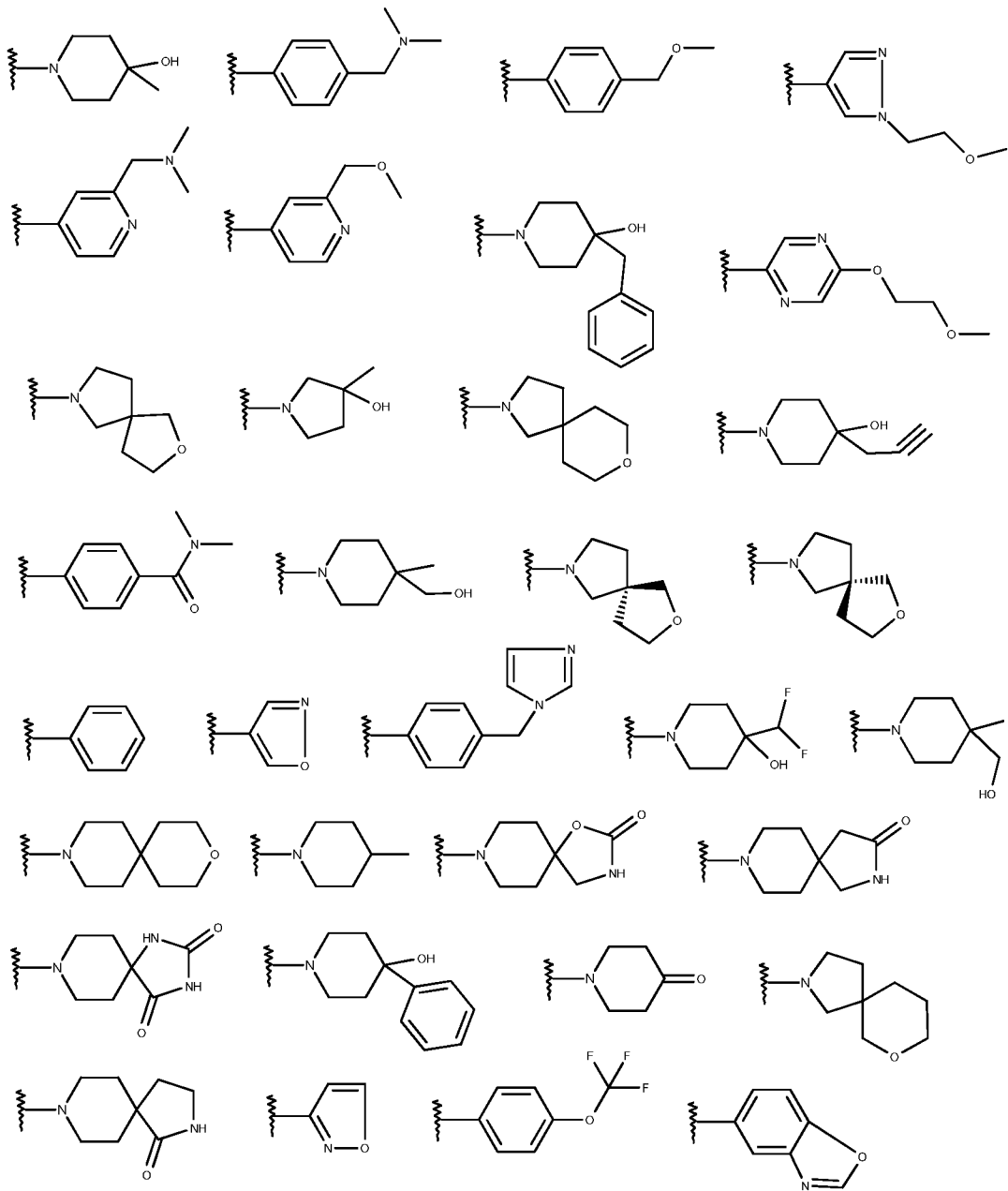
R<sup>1</sup> on jokin seuraavista rakenteista:





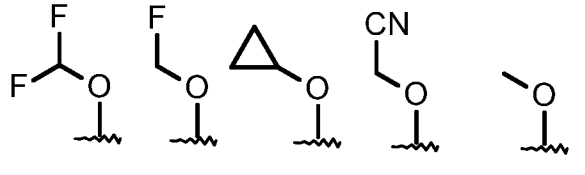
3

R<sup>2</sup> on jokin seuraavista rakenteista:





R<sup>3</sup> on



R<sup>4</sup> on H, D, metyyli, etyyli, F, Br tai Cl ja

D on deuterium,

5 ja sen fysiologisesti hyväksyttävät suolat, johdannaiset, solvaatit ja stereoisomeerit, mukaan lukien niiden seokset kaikissa suhteissa.

2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, jossa

R<sup>1</sup> on fenyyli, metyylipiratsoli tai dihydropyraani, kuten patenttivaatimuksessa 1 on kuvattu,

10 ja radikaalien R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> ja R<sup>4</sup> merkitykset ovat kuten patenttivaatimuksessa 1, ja sen fysiologisesti hyväksyttävät suolat, johdannaiset, solvaatit ja stereoisomeerit, mukaan lukien niiden seokset kaikissa suhteissa.

3. Patenttivaatimuksen 1 tai 2 mukainen yhdiste, jolloin

R<sup>3</sup> on OMe

15 ja radikaaleilla R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> ja R<sup>4</sup> on patenttivaatimuksessa 1 esitetyt merkitykset, ja sen fysiologisesti hyväksyttävät suolat, johdannaiset, solvaatit ja stereoisomeerit, mukaan lukien niiden seokset kaikissa suhteissa.

4. Yhden tai useamman edellä olevan patenttivaatimuksen mukainen yhdiste, jolloin

20 R<sup>1</sup> on fenyyli, metyylipiratsoli tai dihydropyraani, kuten patenttivaatimuksessa 1 on kuvattu,

R<sup>3</sup> on OMe

25 ja radikaaleilla R<sup>2</sup> ja R<sup>4</sup> on patenttivaatimuksessa 1 esitetyt merkitykset, ja sen fysiologisesti hyväksyttävät suolat, johdannaiset, solvaatit ja stereoisomeerit, mukaan lukien niiden seokset kaikissa suhteissa.

5. Yhden tai useamman edellä olevan patenttivaatimuksen mukainen yhdiste, jolloin

R<sup>4</sup> on H

ja jolloin radikaaleilla R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> ja R<sup>7</sup> on patenttivaatimuksessa 1 esitetyt merkitykset, ja sen fysiologisesti hyväksyttävät suolat, johdannaiset, solvaatit ja stereoisomeerit, mukaan lukien niiden seokset kaikissa suhteissa.

6. Yhdiste, joka on valittu ryhmästä, jonka muodostavat:

1	4-hydroksi-4-metyylipiperidiini-1-karboksyylihappo-(4-metoksi-7-morfolin-4-yyliatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
2	4-dimetyyliaminometyyli-N-(4-metoksi-7-morfolin-4-yyliatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)bentsamidi
3	4-metoksimetyyli-N-(4-metoksi-7-morfolin-4-yyliatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)bentsamidi
4	1-(2-metoksietyyli)-1H-pyratsoli-4-karboksyylihappo-(4-metoksi-7-morfolin-4-yyliatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
5	2-dimetyyliaminometyyli-N-(4-metoksi-7-morfolin-4-yyliatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)-isonikotinamidi
6	2-metoksimetyyli-N-(4-metoksi-7-morfolin-4-yyliatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)-isonikotinamidi
7	4-bentsyyli-4-hydroksi-N-[4-metoksi-7-(morfolin-4-yyli)[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]piperidiini-1-karboksamidi
8	N-[4-metoksi-7-(morfolin-4-yyli)-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-5-(2-metoksietoksi)pyratsiini-2-karboksamidi
9	2-oksa-7-atsaspiro[4.4]nonaani-7-karboksyylihappo-(4-metoksi-7-morfolin-4-yyliatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
10	3-hydroksi-3-metyylipyrrolidiini-1-karboksyylihappo-(4-metoksi-7-morfolin-4-yyliatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
11	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyylihappo-(4-metoksi-7-morfolin-4-yyliatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
12	4-hydroksi-4-prop-2-ynyylipiperidiini-1-karboksyylihappo-(4-metoksi-7-morfolin-4-yyliatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
13	1-(2-metoksietyyli)-1H-pyratsoli-4-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi

14	4-metoksimetyyli-N-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]bentsamidi
15	N-(4-metoksi-7-morfolin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)-N',N'-dimetyylitereftalamidi
16	4-hydroksimetyyli-4-metyylipiperidiini-1-karboksylihappo-(4-metoksi-7-morfolin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
17	(5S)-N-[4-metoksi-7-(morfolin-4-yyli)-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-2-oksa-7-atsaspiro[4.4]nonaani-7-karboksamidi
18	(5R)-N-[4-metoksi-7-(morfolin-4-yyli)-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-2-oksa-7-atsaspiro[4.4]nonaani-7-karboksamidi
19	N-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]bentsamidi
20	4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amiini
21	4-hydroksi-4-metyylipiperidiini-1-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
22	4-dimetyyliaminometyyli-N-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]bentsamidi
23	4-metoksimetyyli-N-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]bentsamidi
24	2-dimetyyliaminometyyli-N-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-isonikotinamidi
25	2-dimetyyliaminometyyli-N-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-isonikotinamidi
26	2-metoksimetyyli-N-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-isonikotinamidi
27	4-dimetyyliaminometyyli-N-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]bentsamidi
28	2-metoksimetyyli-N-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-isonikotinamidi

29	1-(2-metoksietyyli)-1H-pyratsoli-4-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
30	4-hydroksi-4-metyylipiperidiini-1-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
31	isoksatsoli-4-karboksylihappo-(4-metoksi-7-morfolin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
32	4-hydroksi-4-metyylipiperidiini-1-karboksylihappo-(4-fluorimetoksi-7-morfolin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
33	4-imidatsol-1-ylimetyyli-N-(4-metoksi-7-morfolin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]bentsamidi
34	7-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-(4-metoksi-7-morfolin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
35	1-(2-metoksietyyli)-1H-pyratsoli-4-karboksylihappo-(4-metoksi-7-pyridin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
36	1-(2-metoksietyyli)-1H-pyratsoli-4-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(6-metyylipyridin-3-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
37	4-hydroksi-4-metyylipiperidiini-1-karboksylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
38	4-Difluorimetyyli-4-hydroksipiperidiini-1-karboksylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
39	4-hydroksimetyyli-4-metyylipiperidiini-1-karboksylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
40	4-fluorimetyyli-4-hydroksipiperidiini-1-karboksylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
41	3-oksa-9-atsaspiro[5.5]undekaani-9-karboksylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
42	4-metyylipiperidiini-1-karboksylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi

43	4-bentsyyli-4-hydroksipiperidiini-1-karboksyylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
44	2-okso-1-oksa-3,8-diatsaspiro[4.5]dekaani-8-karboksyylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
45	3-okso-2,8-diatsaspiro[4.5]dekaani-8-karboksyylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
46	4-dimetyyliaminometyyli-N-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)bentsamidi
47	4-metoksimetyyli-N-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)-bentsamidi
48	2,4-diokso-1,3,8-triatsaspiro[4.5]dekaani-8-karboksyylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
49	4'-hydroksi-3',4',5',6'-tetrahydro-2'H-[3,4']bipyridinyyli-1'-karboksyylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
50	4-oksopiperidiini-1-karboksyylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
51	1-okso-2,8-diatsaspiro[4.5]dekaani-8-karboksyylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
52	7-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
53	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
54	2-oksa-7-atsaspiro[4.4]nonaani-7-karboksyylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
55	4-imidatsol-1-yylimetyyli-N-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)bentsamidi
56	isoksatsoli-3-karboksyylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
57	4-hydroksi-4-prop-2-ynyylipiperidiini-1-karboksyylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi

58	N-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)-N',N'-dimetyylitereftalamidi
59	N-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)-4-trifluorimetoksi-bentsamidi
60	2-metyylioksatsoli-4-karboksyylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
61	bentso-oksatsoli-5-karboksyylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
62	N-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)-4-(2-oksopyrrolidin-1-yylimetyyli)bentsamidi
63	2,3-dihydrobentsofuraani-5-karboksyylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
64	3-metoksimetyylipyrrolidiini-1-karboksyylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
65	piperidiini-1,4-dikarboksyylihappo-4-amidi-1-[(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi]
66	4-dietyyliamino-N-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)-bentsamidi
67	4-difluorimetyyli-4-hydroksipiperidiini-1-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
68	4-hydroksimetyyli-4-metyylipiperidiini-1-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
69	4-fluorimetyyli-4-hydroksipiperidiini-1-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
70	3-oksa-9-atsaspiro[5.5]undekaani-9-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
71	4-metyylipiperidiini-1-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi

72	4-bentsyyli-4-hydroksipiperidiini-1-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
73	2-okso-1-oksa-3,8-diatsaspiro[4.5]dekaani-8-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-amidi
74	3-okso-2,8-diatsaspiro[4.5]dekaani-8-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
75	4-dimetyyliaminometyyli-N-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]bentsamidi
76	2,4-diokso-1,3,8-triatsaspiro[4.5]dekaani-8-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
77	4'-hydroksi-3',4',5',6'-tetrahydro-2'H-[3,4']bipyridinyyli-1'-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
78	4-oksopiperidiini-1-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
79	1-okso-2,8-diatsaspiro[4.5]dekaani-8-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
80	7-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
81	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
82	2-oksa-7-atsaspiro[4.4]nonaani-7-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
83	4-imidatsol-1-ylimetyyli-N-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]bentsamidi
84	isoksatsoli-3-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi

85	4-hydroksi-4-prop-2-ynyylipiperidiini-1-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
86	N-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-N',N'-dimetyylitereftalamidi
87	N-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-4-trifluorimetoksibentsamidi
88	2-metyylioksatsoli-4-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
89	bentso-oksatsoli-5-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
90	N-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-4-(2-okso pyrrolidin-1-yyli)metyyli)bentsamidi
91	2,3-dihydrobentsofuraani-5-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
92	3-metoksimetyylipyrrolidiini-1-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
93	piperidiini-1,4-dikarboksyylihappo-4-amidi-1-{{4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi}}
94	4-dietyyliamino-N-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]bentsamidi
95	4-difluorimetyyli-4-hydroksipiperidiini-1-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
96	4-hydroksimetyyli-4-metyylipiperidiini-1-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
97	4-fluorimetyyli-4-hydroksipiperidiini-1-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
98	3-oksa-9-atsaspiro[5.5]undekaani-9-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi

99	4-metyylipiperidiini-1-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
100	4-bentsyyli-4-hydroksipiperidiini-1-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
101	2-okso-1-oksa-3,8-diatsaspiro[4.5]dekaani-8-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
102	3-okso-2,8-diatsaspiro[4.5]dekaani-8-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
103	2,4-diokso-1,3,8-triatsaspiro[4.5]dekaani-8-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
104	4'-hydroksi-3',4',5',6'-tetrahydro-2'H-[3,4']bipyridinyyli-1'-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
105	4-oksopiperidiini-1-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
106	1-okso-2,8-diatsaspiro[4.5]dekaani-8-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
107	7-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
108	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
109	2-oksa-7-atsaspiro[4.4]nonaani-7-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
110	4-imidatsol-1-yylimetyyli-N-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]bentsamidi
111	isoksatsoli-3-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi

112	4-hydroksi-4-prop-2-ynyylipiperidiini-1-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
113	N-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-N',N'-dimetyylitereftalamidi
114	N-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-4-trifluorimetoksibentsamidi
115	2-metyylioksatsoli-4-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
116	bentso-oksatsoli-5-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
117	N-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-4-(2-okso-pyrrolidin-1-yyli)metyyli)bentsamidi
118	2,3-dihydrobentsofuraani-5-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
119	3-metoksimetyyllipyrrolidiini-1-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
120	piperidiini-1,4-dikarboksylihappo-4-amidi-1-{{4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi}
121	4-dietyyliamino-N-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]bentsamidi
122	{1-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yylikarbamoyyli]piperidin-3-yyli}etikkahappo
123	pyridiini-2,5-dikarboksylihappo-2-dimetyyliamidi-5-{{4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi}
124	1-metyyli-1H-pyratsoli-4-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
125	5-metyyli-isoksatsoli-4-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
126	1-(2-metoksietyyli)-1H-[1,2,3]triatsoli-4-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi

127	1-metyyli-1H-[1,2,3]triatsoli-4-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
128	1-syaanisyklopropanikarboksylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
129	3-syaani-N-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]propionamidi
130	2-metyylioksatsoli-5-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
131	2-metyylitiatsoli-5-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
132	4-hydroksipent-2-yynihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
133	(S)-3-metaanisulfonyylipyrrolidiini-1-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
134	(S)-3-fluoripyrrolidiini-1-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
135	(S)-3-syaanipyrrolidiini-1-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
136	(R)-3-dimetyyliaminometyylipyrrolidiini-1-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
137	5-metyyli-isoksatsoli-4-karboksylihappo-(4-metoksi-7-morfolin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
138	1-(2-metoksietyyli)-1H-[1,2,3]triatsoli-4-karboksylihappo-(4-metoksi-7-morfolin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
139	1-metyyli-1H-[1,2,3]triatsoli-4-karboksylihappo-(4-metoksi-7-morfolin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
140	pyridiini-2,5-dikarboksylihappo-2-dimetyyliamidi-5-{[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi}

141	pyridiini-2,5-dikarboksyylihappo-2-dimetyyliamidi-5-[(4-metoksi-7-morfolin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi]
142	1-metyyli-1H-pyratsoli-4-karboksyylihappo-[7-metoksi-4-(tetrahydropyran-4-yyli)-1H-bentsoimidatsol-2-yyli]amidi
143	5-metyyli-isoksatsoli-4-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
144	1-(2-metoksietyyli)-1H-[1,2,3]triatsoli-4-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
145	1-metyyli-1H-[1,2,3]triatsoli-4-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
146	1-syaanisyklopropanikarboksyylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
147	2-metyylioksatsoli-5-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
148	2-metyylitiatsoli-5-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
149	(S)-3-metaanisulfonyylipyrrolidiini-1-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
150	(S)-3-fluoripyrrolidiini-1-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
151	(S)-3-syaanipyrrolidiini-1-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
152	(R)-3-dimetyyliaminometyylipyrrolidiini-1-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
153	1-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-3-tiatsol-2-yyliimetyyliurea
154	1-(2-metoksietyyli)-1H-pyratsoli-4-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(2-oksa-7-atsaspiro[4.4]non-7-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi

155	1-metyyli-1H-pyratsoli-4-karboksyylihappo-{4-metoksi-7-[(2-metoksi-propyyli)metyyliamino]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli}amidi
156	1-metyyli-1H-pyratsoli-4-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(5-oksa-2-atsaspiro[3.4]okt-2-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
157	1-metyyli-1H-pyratsoli-4-karboksyylihappo-(4-metoksi-7-piperidin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
158	1-metyyli-1H-pyratsoli-4-karboksyylihappo-(4-metoksi-7-piperidin-3-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
159	1-metyyli-1H-pyratsoli-4-karboksyylihappo-[7-(karbamoyylimetyylimetyyliamino)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
160	1-metyyli-1H-pyratsoli-4-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-(2,2,2-trifluorietoksi)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
161	4-hydroksi-4-metyylipiperidiini-1-karboksyylihappo-(4-fluorimetoksi-7-morfolin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
162	4-hydroksi-4-metyylipiperidiini-1-karboksyylihappo-(4-difluorimetoksi-7-morfolin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
163	N-(4-metoksi-6-metyyli-7-morfolinotiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)-1-metyylipyratsoli-4-karboksamidi
164	N-(6-bromi-4-metoksi-7-morfolinotiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)-1-metyylipyratsoli-4-karboksamidi
165	1-metyyli-1H-pyratsoli-4-karboksyylihappo-(6-fluori-4-metoksi-7-morfolin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
166	N-(6-kloori-4-metoksi-7-morfolinotiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)-1-metyylipyratsoli-4-karboksamidi
167	syklopropanikarboksyylihappo-(4-metoksi-7-morfolin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
168	(S)-7-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyylihappo-(4-metoksi-7-morfolin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
169	(R)-7-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyylihappo-(4-metoksi-7-morfolin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi

170	N-(4-metoksi-7-morfolin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)-4-(2-okso-pyrrolidin-1-yyli)metyyli)bentsamidi
171	1-metyyli-1H-pyratsoli-4-karboksylihappo-(4-metoksi-7-morfolin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
172	(R)-2-oksa-7-atsaspiro[4.4]nonaani-7-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
173	(S)-2-oksa-7-atsaspiro[4.4]nonaani-7-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
174	3-syaani-N-[4-metoksi-7-(morfolin-4-yyli)-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]propanamidi
175	1-syaani-N-[4-metoksi-7-(morfolin-4-yyli)-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]syklopropani-1-karboksamidi
176	(S)-7-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
177	(R)-7-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
178	1-metyyli-1H-pyratsoli-4-karboksylihappo-(6-bromi-4-metoksi-7-morfolin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
179	syklopropanikarboksylihappo-[4-metoksi-7-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
180	N-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-4-(2-okso-pyrrolidin-1-yyli)metyyli)bentsamidi
181	2-metyyli)tiatsoli-5-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
182	2-oksa-7-atsaspiro[4.4]nonaani-7-karboksylihappo-[7-(3-etoksi-3-metyyliatsetidin-1-yyli)-4-metoksi)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
183	2-oksa-7-atsaspiro[4.4]nonaani-7-karboksylihappo-(4-metoksi-7-piperidin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi

184	2-oksa-7-atsaspiro[4.4]nonaani-7-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(5-oksa-2-atsaspiro[3.4]okt-2-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
185	2-oksa-7-atsaspiro[4.4]nonaani-7-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(3-metoksi-3-metyyliatsetidin-1-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
186	2-metyylioksatsoli-5-karboksylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
187	syklopropanikarboksylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
188	1-metyyli-1H-pyratsoli-4-karboksylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
189	N-[4-metoksi-7-(morfolin-4-yyli)-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-2-metyyli-1,3-oksatsoli-5-karboksamidi
190	2-metyylitiatsoli-5-karboksylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
191	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(5-oksa-2-atsaspiro[3.4]okt-2-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
192	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-(4-metoksi-7-piperidin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
193	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[7-(4-fluorifenyyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
194	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[7-(3-fluorifenyyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
195	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[7-(2-fluorifenyyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
196	1-dimetyyliaminometyylisyklopropanikarboksylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
197	syklopropani-1,1-dikarboksylihappodimetyyliamidi-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi

198	1-imidatsol-1-yylimetyyli-syklopropani-karboksylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
199	1-metyyli-1H-pyratsoli-4-karboksylihappo-(4-hydroksi-7-morfolin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
200	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-(4-metoksi-7-piperidin-3-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
201	1-amino-N-{4-metoksi-7-fenyyl-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli}-8-atsaspiro[4.5]dekaani-8-karboksamidi
202	(1S,2S)-2-metoksi-N-{4-metoksi-7-fenyyl-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli}syklopropani-1-karboksamidi
203	1-aminosyklopropani-karboksylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
204	(S)-7-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
205	(R)-7-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
206	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-(4-metoksi-7-pyridin-3-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
207	(S)-2-oksa-7-atsaspiro[4.4]nonaani-7-karboksylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
208	(R)-2-oksa-7-atsaspiro[4.4]nonaani-7-karboksylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
209	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[7-(2,3-difluorifenyyli)-4-metoksi]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
210	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[7-(2,5-difluorifenyyli)-4-metoksi]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
211	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-(4-metoksi-7-pyridin-2-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
212	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-(4-metoksi-7-pyridin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi

213	4-(2,5-dioksopyrrolidin-1-yyli)-N-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)bentsamidi
214	4-(2,5-dioksopyrrolidin-1-yyli)-N-(4-metoksi-7-morfolin-4-yyliatiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)bentsamidi
215	(R)-1-amino-8-atsaspiro[4.5]dekaani-8-karboksylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
216	(S)-1-amino-8-atsaspiro[4.5]dekaani-8-karboksylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
217	1-metyyli-1H-pyratsoli-4-karboksylihappo-(6-syaani-4-metoksi-7-morfolin-4-yyliatiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
218	N-(4-metoksi-7-pyridin-3-yyliatiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)-N',N'-dimetyylitereftalamidi
219	N-(4-metoksi-7-pyridin-4-yyliatiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)-N',N'-dimetyylitereftalamidi
220	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-(6-kloori-4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
221	1-metyyli-1H-pyratsoli-4-karboksylihappo-(6-kloori-4-metoksi-7-morfolin-4-yyliatiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
222	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-(6-syaani-4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
223	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-(4-metoksi-6-metyyli-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
224	N-{4-metoksi-7-[3-(2-metoksietoksi)fenyyli]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli}-N',N'-dimetyylitereftalamidi
225	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-{4-metoksi-7-[3-(2-metoksietoksi)fenyyli]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli}amidi
226	4-(2,5-dioksopyrrolidin-1-yyli)-N-(6-fluori-4-metoksi-7-morfolin-4-yyliatiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)bentsamidi
227	N-(2-hydroksietyyli)-N'-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)-N-metyylitereftalamidi

228	N-(2-hydroksietyyli)-N'-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)tereftalamidi
229	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-(6-fluori-4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
230	N-(2-dimetyyliaminoetyyli)-N'-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)tereftalamidi
231	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-(4,6-dimetyyli-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
232	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
233	N-{4-metoksi-7-[3-(2-metoksietoksi)fenyyli]-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli}-1-(2-metoksietyyli)-1H-pyratsoli-4-karboksamidi
234	N-{6-fluori-4-metoksi-7-[3-(2-metoksietoksi)fenyyli]-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli}-8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksamidi
235	N-[4-metoksi-7-(oksan-4-yyli)-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-1-metyyli-1H-pyratsoli-4-karboksamidi
236	N-[4-metoksi-7-(2-metoksifenyyli)-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksamidi
237	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
238	N-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksi-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-1-metyyli-1H-pyratsoli-4-karboksamidi
239	N-[7-(2,6-dimetoksy-pyridin-3-yyli)-4-metoksi-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksamidi
240	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-(6-fluori-4-hydroksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
241	2-amino-N-[4-metoksi-7-(oksan-4-yyli)-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-1,3-tiatsoli-5-karboksamidi

242	3-aminopyrrolidiini-1-karboksylihappo-(4-metoksi-7-fenyyliatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
243	(R)-3-aminopyrrolidiini-1-karboksylihappo-(4-metoksi-7-fenyyliatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
244	(S)-3-aminopyrrolidiini-1-karboksylihappo-(4-metoksi-7-fenyyliatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
245	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-(7-fenyyliatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
246	1-(2-metoksietyyli)-1H-pyratsoli-4-karboksylihappo-(6-fluori-4-metoksi-7-morfolin-4-yyliatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
247	bisyklo[1.1.1]pentaani-1,3-dikarboksylihappodimetyyliamidi-(4-metoksi-7-morfolin-4-yyliatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
248	N-(2-hydroksietyyli)-N'-[4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-N-metyylitereftalamidi

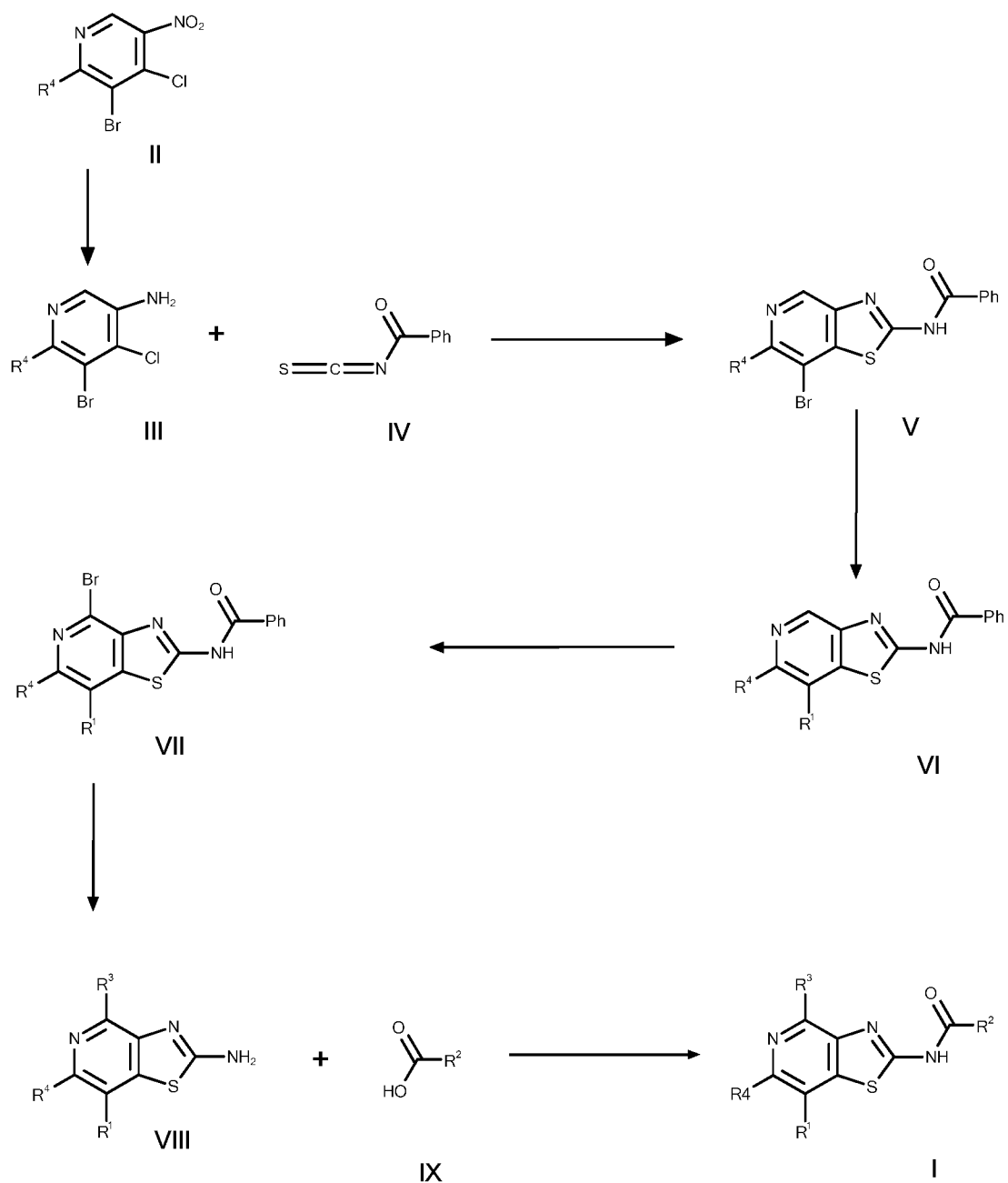
ja sen fysiologisesti hyväksyttävät suolat, johdannaiset, solvaatit ja stereoisomeerit, mukaan lukien niiden seokset kaikissa suhteissa, jolloin edellä mainitut yhdisteet kuuluvat patenttivaatimuksen 1 piiriin lukuun ottamatta yhdisteitä 231, kun  $R^3 = \text{Me}$ , 240, kun  $R^3 = \text{OH}$ , ja 245, kun  $R^3 = \text{H}$ .

5                    7. Menetelmä kaavan I mukaisen yhdisteen valmistamiseksi, t u n n e t t u siitä, että

a) kaavan II mukaiselle yhdisteelle tapahtuu pelkistys, jolloin saadaan kaavan III mukainen yhdiste, kaavan III mukainen yhdiste saatetaan reagoimaan kaavan IV mukaisen yhdisteen kanssa korotetussa lämpötilassa, jolloin saadaan kaavan V mukainen yhdiste, kaavan V mukainen yhdiste konvertoidaan kaavan VI mukaiseksi yhdisteeksi käyttämällä katalyyttiä ja emästä, kaavan VI mukainen yhdiste konvertoidaan kaavan VII mukaiseksi yhdisteeksi broamaamalla, kaavan VII mukainen yhdiste konvertoidaan kaavan VIII mukaiseksi yhdisteeksi oleellisesti emäksisissä olosuhteissa ja kaavan VIII mukainen

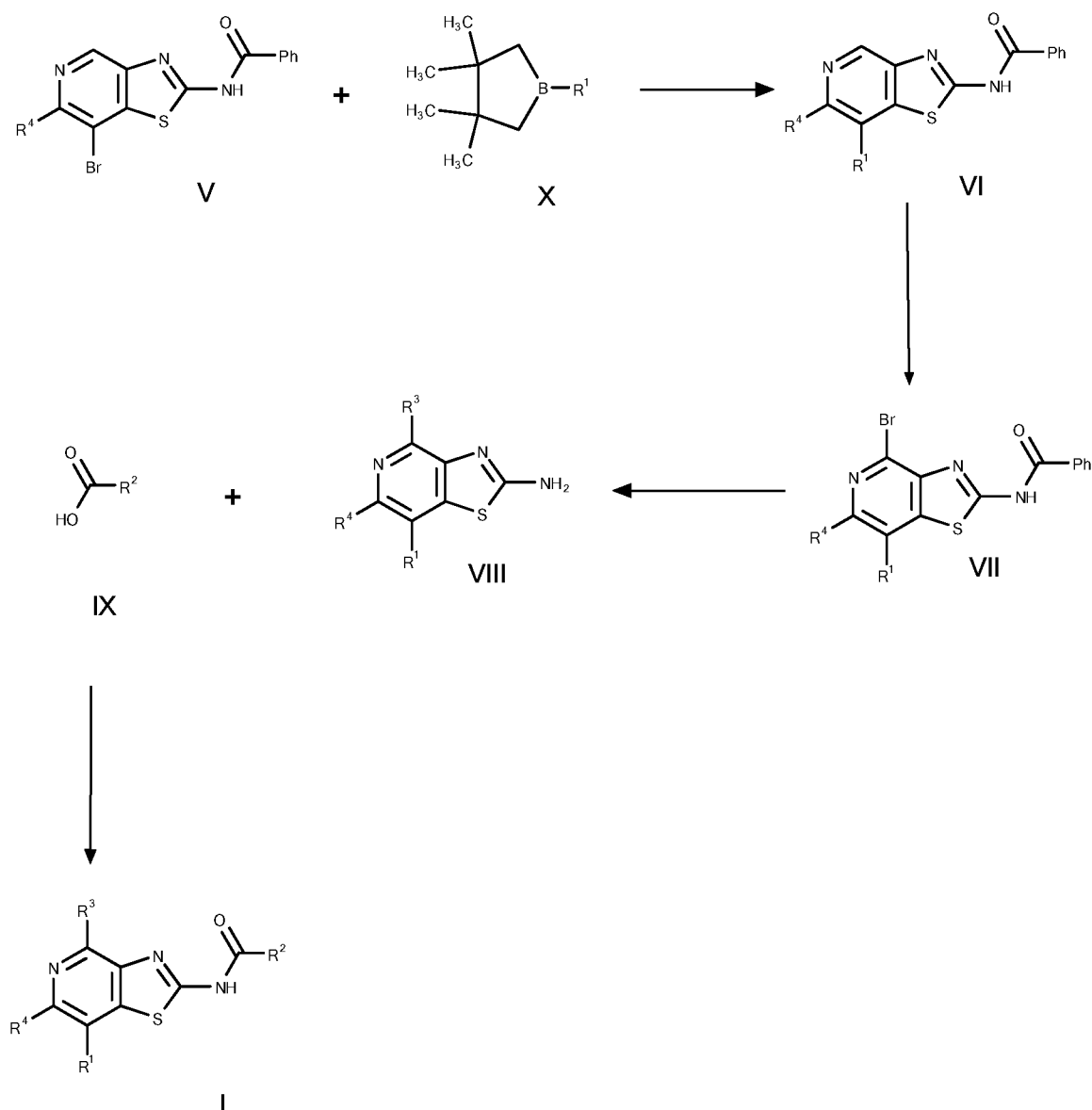
10

yhdiste saatetaan reagoimaan kaavan IX mukaisen yhdisteen kanssa tavanomaisissa amidoinnin tai karbamidimuodostuksen olosuhteissa, jolloin saadaan kaavan I mukainen yhdiste,



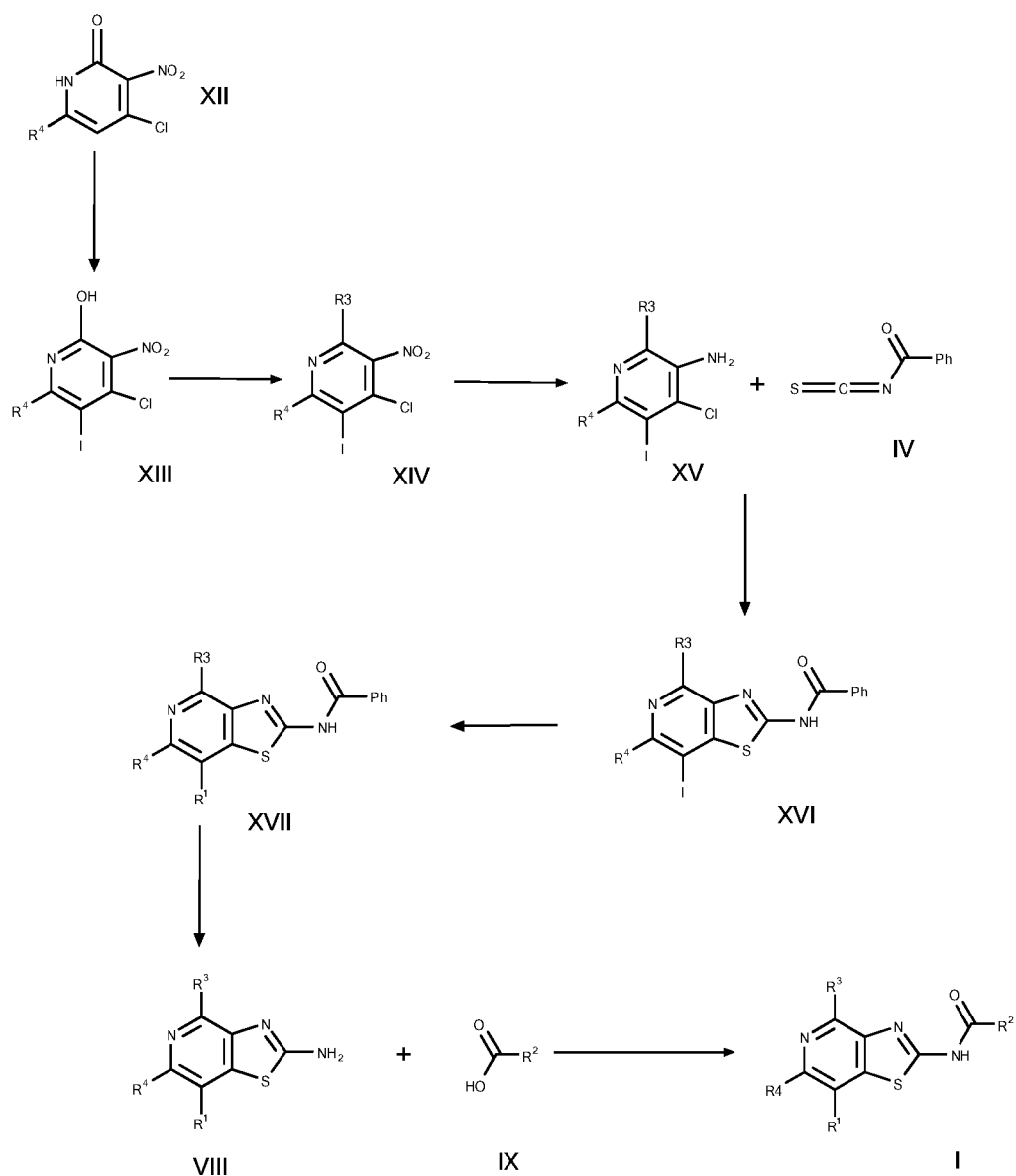
5 b) kaavan V mukainen yhdiste saatetaan reagoimaan kaavan X mukaisen yhdisteen kanssa Suzuki-tyyppisen reaktion olosuhteissa, jolloin saa-

daan kaavan VI mukainen yhdiste, kaavan VI mukainen yhdiste konvertoidaan kaavan VII mukaiseksi yhdisteeksi bromaamalla, kaavan VII mukainen yhdiste konvertoidaan kaavan VIII mukaiseksi yhdisteeksi oleellisesti emäksisissä olosuhteissa ja kaavan VIII mukainen yhdiste saatetaan reagoimaan kaavan IX mukaisen yhdisteen kanssa tavanomaisissa amidoinnin tai karbamidimuodostuksen olosuhteissa, jolloin saadaan kaavan I mukainen yhdiste,



c) kaavan XII mukainen yhdiste jodataan, jolloin saadaan kaavan XIII mukainen yhdiste, kaavan XIII mukainen yhdiste konvertoidaan kaavan XIV mukaiseksi yhdisteeksi käsittelemällä emäksellä ja elektrofiilillä, kaavan XIV mukai-

nen yhdiste konvertoidaan kaavan XV mukaiseksi yhdisteeksi pelkistämällä, kaavan XV mukainen yhdiste saatetaan reagoimaan kaavan IV mukaisen yhdisteen kanssa korotetussa lämpötilassa, jolloin saadaan kaavan XVI mukainen yhdiste, kaavan XVI mukainen yhdiste konvertoidaan katalyyttisissä olosuhteissa kaavan XVII mukaiseksi yhdisteeksi, kaavan XVII mukainen yhdiste konvertoidaan kaavan VIII mukaiseksi yhdisteeksi emäksisissä olosuhteissa ja kaavan VIII mukainen yhdiste saatetaan reagoimaan kaavan IX mukaisen yhdisteen kanssa tavanomaisissa amidoinnin tai karbamidimuodostuksen olosuhteissa, jolloin saadaan kaavan I mukainen yhdiste,



d) kaavan I mukaisen yhdisteen emäs konvertoidaan joksikin sen suoloista käsittelemällä hapolla tai

e) kaavan I mukaisen yhdisteen happo konvertoidaan joksikin sen suoloista käsittelemällä emäksellä.

8. Farmaseuttinen valmiste, joka käsittää ainakin yhden yhdisteen, joka on yhden tai useamman patenttivaatimuksen 1–6 mukainen, ja/tai sen fy-

siologisesti hyväksyttäviä suoloja, johdannaisia, solvaatteja ja stereoisomeerejä, mukaan lukien niiden seokset kaikissa suhteissa.

9. Patenttivaatimuksen 8 mukainen farmaseuttinen valmiste, joka käsittää edelleen apuaineita ja/tai adjuvantteja.

5 10. Patenttivaatimuksen 8 mukainen farmaseuttinen valmiste, joka käsittää ainakin yhden yhdisteen, joka on yhden tai useamman patenttivaatimuksen 1–6 mukainen, ja/tai sen fysiologisesti hyväksyttäviä suoloja, johdannaisia, solvaatteja ja stereoisomeerejä, mukaan lukien niiden seokset kaikissa suhteissa, ja ainakin yhden muun aktiivisen lääkeyhdisteen.

10 11. Menetelmä farmaseuttisen valmisteen valmistamiseksi, tunnettu siitä, että yhden tai useamman patenttivaatimuksen 1–6 mukainen yhdiste ja/tai jokin sen fysiologisesti hyväksyttävistä suoloista, johdannaisista, solvaateista ja stereoisomeereistä, mukaan lukien niiden seokset kaikissa suhteissa, saatetaan sopivaan annostusmuotoon yhdessä kiinteän, nestemäisen tai osittain nestemäisen apuaineen tai adjuvantin kanssa.

12. Lääke, joka käsittää ainakin yhden yhdisteen, joka on yhden tai useamman patenttivaatimuksen 1–6 mukainen, ja/tai jonkin sen fysiologisesti hyväksyttävistä suoloista, johdannaisista, solvaateista ja stereoisomeereistä, mukaan lukien niiden seokset kaikissa suhteissa, käytettäväksi fysiologisten ja/tai patofysiologisten tilojen hoidossa ja/tai ennaltaehkäisyssä.

13. Lääke, joka käsittää ainakin yhden yhdisteen, joka on yhden tai useamman patenttivaatimuksen 1–6 mukainen, ja/tai jonkin sen fysiologisesti hyväksyttävistä suoloista, johdannaisista, solvaateista ja stereoisomeereistä, mukaan lukien niiden seokset kaikissa suhteissa, käytettäväksi hoidettaessa ja/tai ennaltaehkäistäessä fysiologisia ja/tai patofysiologisia tiloja, jotka kuuluvat ryhmään, jonka muodostavat hyperproliferatiiviset ja infektioiden sairaudet ja häiriöt.

14. Patenttivaatimuksen 13 mukaisesti käytettäväksi tarkoitettu lääke, jolloin hyperproliferatiivinen sairaus tai häiriö on syöpä.

30 15. Patenttivaatimuksen 14 mukaisesti käytettäväksi tarkoitettu lääke, jolloin syöpä kuuluu ryhmään, jonka muodostavat akuutti ja krooninen lymfaattinen leukemia, akuutti myeloinen leukemia, lisämunuaiskuoren syöpä, virt-

sarakon syöpä, aivosyöpä, rintasyöpä, kohdunkaulan syöpä, kohdunkaulan hyperplasia, kohdunkaulan syöpä, istukkasyöpä, krooninen myeloinen leukemia, krooninen lymfaattinen leukemia, koolonsyöpä, kohdun limakalvon syöpä, ruokatorvisyöpä, essentiaalinen trombosytemia, urogenitaalinen karsinooma, gliooma, glioblastooma, karvasoluleukemia, pään ja kaulan alueen karsinooma, Hodgkinin tauti, Kaposin sarkooma, keuhkokarsinooma, lymfooma, pahanlaatuisen karsinoidikarsinooma, pahanlaatuisen hyperkalsemia, pahanlaatuisen melanooma, pahanlaatuisen haiman insulinooma, medullaarinen kilpirauhaskarsinooma, melanooma, multippeli myelooma, mycosis fungoides, myeloinen ja lymfaattinen leukemia, neuroblastooma, non-Hodgkin-lymfooma, ei-pienisoluisen keuhkosityöpä, osteogeeninen sarkooma, munasarjakarsinooma, haimakarsinooma, polycythemia vera, primaarinen aivokarsinooma, primaarinen makroglobulinemia, eturauhassyöpä, munuaissolusyöpä, rabdomyosarkooma, ihosyöpä, pienisoluisen keuhkosityöpä, pehmytkudossarkooma, levyepiteelisyöpä, mahasyöpä, kivessyöpä, kilpirauhassyöpä ja Wilmsin kasvain.

16. Patenttivaatimuksen 13 mukaisesti käytettäväksi tarkoitettu lääke, jolloin hyperproliferatiivinen sairaus tai häiriö kuuluu ryhmään, jonka muodostavat silmänpohjan ikärappeuma, Crohnin tauti, kirroosi, krooniset tulehdukseen liittyvät häiriöt, proliferatiivinen diabeettinen retinopatia, proliferatiivinen vitreoretinopatia, keskosen retinopatia, granulomatoosi, immuuni hyperproliferaatio, joka liittyy elin- tai kudossiirtoon, ja immunoproliferatiivinen sairaus tai häiriö, joka kuuluu ryhmään, jonka muodostavat tulehduksellinen suolistotauti, psoriaasi, nivelreuma, systeeminen lupus erythematosus (SLE), verkkokalvon hypoksian aiheuttama verisuonten hyperproliferaatio ja vaskuliitti.

17. Patenttivaatimuksen 13 mukaisesti käytettäväksi tarkoitettu lääke, jolloin infektioiden sairaus tai häiriö kuuluu ryhmään, jonka muodostavat

a) virusten indusoimat infektiotaudit, joiden aiheuttajina ovat retrovirukset, hepadnavirukset, herpesvirukset, flavivirukset ja/tai adenovirukset, jolloin retrovirukset kuuluvat ryhmään, jonka muodostavat lentivirukset ja onkoretrovirukset, jolloin lentivirus kuuluu ryhmään, jonka muodostavat HIV-1, HIV-2, FIV, BIV, SIVs, SHIV, CAEV, VMV ja EIAV, ja onkoretrovirus kuuluu ryhmään, jonka muodostavat HTLV-I, HTLV-II ja BLV, hepadnavirus kuuluu ryhmään, jon-

ka muodostavat HBV, GSHV ja WHV, herpesvirus kuuluu ryhmään, jonka muodostavat HSV I, HSV II, EBV, VZV, HCMV ja HHV 8, ja flavivirukset kuuluvat ryhmään, jonka muodostavat HCV, Länsi-Niilin virus ja keltakuumevirus,

b) bakteeri-infektioaudit, joiden aiheuttajina ovat grampositiiviset bakteerit, jolloin grampositiiviset bakteerit kuuluvat ryhmään, jonka muodostavat metisilliiniherkät ja metisilliiniresistentit stafylokokit (mukaan lukien *Staphylococcus aureus*, *Staphylococcus epidermidis*, *Staphylococcus haemolyticus*, *Staphylococcus hominis*, *Staphylococcus saprophyticus* ja koagulaasinegatiiviset stafylokokit), glykopeptideille keskitason herkkyyden omaava *Staphylococcus aureus* (GISA), penisilliiniherkät ja penisilliiniresistentit streptokokit (mukaan lukien *Streptococcus pneumoniae*, *Streptococcus pyogenes*, *Streptococcus agalactiae*, *Streptococcus avium*, *Streptococcus bovis*, *Streptococcus lactis*, *Streptococcus sanguis* ja streptokokkien C-ryhmä (GCS), streptokokkien G-ryhmä (GGS) ja viridans-streptokokit), enterokokit (mukaan lukien vankomysiiniherkät ja vankomysiiniresistentit kannat, kuten *Enterococcus faecalis* ja *Enterococcus faecium*), *Clostridium difficile*, *Listeria monocytogenes*, *Corynebacterium jeikeium*, *Chlamydia* spp. (mukaan lukien *C. pneumoniae*) ja *Mycobacterium tuberculosis*,

c) bakteeri-infektioaudit, joiden aiheuttajina ovat gramnegatiiviset bakteerit, jolloin gramnegatiiviset bakteerit kuuluvat ryhmään, jonka muodostavat *Enterobacteriaceae*-suku, mukaan lukien *Escherichia* spp. (mukaan lukien *Escherichia coli*), *Klebsiella* spp., *Enterobacter* spp., *Citrobacter* spp., *Serratia* spp., *Proteus* spp., *Providencia* spp., *Salmonella* spp., *Shigella* spp., *Pseudomonas*-suku (mukaan lukien *P. aeruginosa*), *Moraxella* spp. (mukaan lukien *M. catarrhalis*), *Haemophilus* spp. ja *Neisseria* spp.,

d) infektioaudit, joita indusoivat intrasellulaariset aktiiviset loiset, jotka kuuluvat ryhmään, jonka muodostavat pääjakso *Apicomplexa* tai *Sarcomastigophora* (mukaan lukien *Trypanosoma*, *Plasmodia*, *Leishmania*, *Babesia* ja *Theileria*), *Cryptosporidia*, *Sacrocytida*, *Amoebia*, *Coccidia* ja *Trichomonadia*.

18. Sarja (kokoonpano), joka koostuu seuraavista erillisistä pakkauksista:

a) tehokas määrä yhden tai useamman patenttivaatimuksen 1–6 mukaista yhdistettä ja/tai sen fysiologisesti hyväksyttäviä suoloja, johdannaisia, solvaatteja ja stereoisomeerejä, mukaan lukien niiden seokset kaikissa suhteissa, ja

5

b) tehokas määrä toista aktiivista lääkeyhdistettä.