

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

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

- (10) **FI/EP3914600 T3**
- (12) **EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION**
- (45) Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning - **31.10.2024**
Translation available to the public
- (97) Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för **07.08.2024**
det europeiska patentet - Date of grant of European patent
- (51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -
International patent classification
C07D 513/04 (2006 . 01)
C07D 519/00 (2006 . 01)
A61P 35/00 (2006 . 01)
A61K 31/437 (2006 . 01)
- (96) Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan - **EP20700918.4**
European patent application
- (22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date **21.01.2020**
- (97) Patenttihakemuksen julkiseksitulopäivä - Patentansökans **01.12.2021**
publiceringsdag - Patent application available to the public
- (86) Kansainvälinen hakemus - Internationell **21.01.2020 PCT/EP2020051347**
ansökan - International application
- (30) Etuoikeus - Prioritet - Priority
22.01.2019 EP EP19152961

(73) Haltija - Innehavare - Holder
1• Merck Patent GmbH, Frankfurter Strasse 250, 64293 Darmstadt, (DE)

(72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor
1• TANZER KRAUEL, Eva-Maria, 5 Riverhurst Road Apt. 642, BILLERICA, MA 01821, (US)
2• SCHIEMANN, Kai, Am Roedergraben 8, 64342 SEEHEIM-JUGENHEIM, (DE)
3• CRESPO, Alejandro, 39 Fernwood Rd., West Newton, MA, 02465, (US)

(74) Asiamies - Ombud - Agent
Kolster Oy Ab, Salmisaarenaukio 1, 00180 Helsinki, (FI)

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention
Tiatsolopyridiinijohdannaisia adenosinireseptoriantagonisteina
THIAZOLOPYRIDINE DERIVATIVES AS ADENOSINE RECEPTOR ANTAGONISTS

Patenttivaatimukset

1. Yhdiste, joka on valittu ryhmästä, jonka muodostavat

1	(R)-3-aminometyylipyrrolidiini-1-karboksylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
2	N-{4-metoksi-7-[4-(oksan-4-yylioksi)fenyyli]-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli}-8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksamidi
3	(S)-3-aminometyylipyrrolidiini-1-karboksylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
4	syklopropanikarboksylihappo-(6-fluori-4-metoksi-7-morfolin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
6	N-(6-fluori-4-metoksi-7-morfolin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)-4-(1H-tetratsol-5-yyli)bentsamidi
7	7-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-(6-fluori-4-metoksi-7-morfolin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
9	N-[7-(1H-indol-6-yyli)-4-metoksi-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksamidi
10	(R)-7-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-(6-fluori-4-metoksi-7-morfolin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
11	(5S)-N-[6-fluori-4-metoksi-7-(morfolin-4-yyli)-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-7-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksamidi
12	(R)-7-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-(6-fluori-4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
13	(5S)-N-{6-fluori-4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli}-7-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksamidi
14	3-dimetyyliaminometyylibisyklo[1.1.1]pentaani-1-karboksylihappo-(4-metoksi-7-morfolin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
15	7-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
16	N-[6-fluori-4-metoksi-7-(morfolin-4-yyli)-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-2-oksa-7-atsaspiro[4.4]nonaani-7-karboksamidi

17	N-[4-metoksi-7-(oksan-4-yyli)-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-2-[(2-metoksietyyli)amino]-1,3-tiatsoli-5-karboksamidi
18	(R)-2-oksa-7-atsaspiro[4.4]nonaani-7-karboksyylihappo-(6-fluori-4-metoksi-7-morfolin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
19	(5S)-N-[6-fluori-4-metoksi-7-(morfolin-4-yyli)-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-2-oksa-7-atsaspiro[4.4]nonaani-7-karboksamidi
20	N-[6-fluori-4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-N',N'-dimetyylitereftalamidi
21	1-imidatsol-1-yylimetyylisyklopropanikarboksyylihappo-[6-fluori-4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
22	N-[6-fluori-4-metoksi-7-(oksan-4-yyli)-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-1-(2-metoksietyyli)-1H-pyratsoli-4-karboksamidi
23	N-[6-fluori-4-metoksi-7-(oksan-4-yyli)-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-1-metyyli-1H-pyratsoli-4-karboksamidi
24	(R)-7-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyylihappo-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
25	(S)-7-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyylihappo-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
26	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyylihappo-[6-fluori-4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
27	4-hydroksi-4-metyylipiperidiini-1-karboksyylihappo-[6-fluori-7-(4-fluorifenyyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
28	syklopropanikarboksyylihappo-[6-fluori-4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
29	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyylihappo-[6-fluori-7-(4-fluorifenyyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
30	syklopropanikarboksyylihappo-[7-(3-etyyliaminometyylifenyyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
31	7-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyylihappo-[6-fluori-4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi

32	1H-imidatsoli-4-karboksylihappo-(6-fluori-4-metoksi-7-fenyylitiat-solo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
33	N-[6-fluori-4-metoksi-7-(oksan-4-yyli)-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-2-oksa-7-atsaspiro[4.4]nonaani-7-karboksamidi
34	(R)-7-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[6-fluori-4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
35	(5S)-N-[6-fluori-4-metoksi-7-(oksan-4-yyli)-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-7-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksamidi
37	(R)-2-oksa-7-atsaspiro[4.4]nonaani-7-karboksylihappo-[6-fluori-4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
38	(5S)-N-[6-fluori-4-metoksi-7-(oksan-4-yyli)-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-2-oksa-7-atsaspiro[4.4]nonaani-7-karboksamidi
39	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[7-(3-aminofenyyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
40	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(3-okso syklopent-1-enyyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
41	bisyklo[1.1.1]pentaani-1,3-dikarboksylihappo-[6-fluori-4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi-(2-hydroksietyyli)metyyliamidi
42	N-[7-(2,5-dihydrofuran-3-yyli)-4-metoksi-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]syklopropanikarboksamidi
43	N-[7-(2,5-dihydrofuran-3-yyli)-4-metoksi-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-1H-imidatsoli-4-karboksamidi
44	N-[7-(2,5-dihydrofuran-3-yyli)-4-metoksi-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksamidi
45	N-[7-(2,5-dihydrofuran-3-yyli)-4-metoksi-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-7-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksamidi
46	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[7-(1-asetyyli-1,2,3,6-tetrahydropyridin-4-yyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi

47	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyyliahappo-(4-metoksi-7-tiofen-2-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
48	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyyliahappo-(7-furan-2-yyli-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
49	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyyliahappo-[7-(3-etyyliamino-metyylifenyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
50	N-[6-fluori-4-metoksi-7-(tetrahydropyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-N'-(2-hydroksietyyli)-N'-metyylitereftalamidi
51	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyyliahappo-(4-metoksi-7-piperidin-1-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
52	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyyliahappo-(7-furan-3-yyli-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
53	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyyliahappo-[4-metoksi-7-(4-metyylipiperatsin-1-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
54	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyyliahappo-[4-metoksi-7-(3-metoksifenyyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
56	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyyliahappo-[4-metoksi-7-(6-metyylipyridatsin-3-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
57	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyyliahappo-(7-atsetidin-1-yyli-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
58	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyyliahappo-[7-(3-hydroksiatsetidin-1-yyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
59	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyyliahappo-(7-sykloheks-1-enyyli-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
60	1H-Imidatsoli-4-karboksyyliahappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
61	N4-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksi-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-N1,N1-dimetyylibentseeni-1,4-dikarboksamidi
62	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyyliahappo-(7-sykloheksyyli-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi

63	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyyliahappo-[7-(4,4-difluorisykloheks-1-enyyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
64	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyyliahappo-[7-(3,6-dihydro-2H-tiopyran-4-yyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
65	1H-imidatsoli-4-karboksyyliahappo-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
66	N-[4-metoksi-7-(4-metoksisykloheks-1-en-1-yyli)-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksamidi
67	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyyliahappo-[4-metoksi-7-(2-metyylitiatsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
68	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyyliahappo-[4-metoksi-7-(1-pyridin-3-yylimetyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
69	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyyliahappo-[4-metoksi-7-(1-pyridin-2-yylimetyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
71	N-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksi-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-4-(1H-1,2,3-triatsol-1-yyli)bentsamidi
72	4-{{[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksi-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]karbamoyyli}bentsoehappo
73	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyyliahappo-(7-[1,4]dioksan-2-yyli-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
74	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyyliahappo-{7-[1-(2,2-difluorietyyli)-1H-pyratsol-4-yyli]-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli}amidi
75	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyyliahappo-[4-metoksi-7-(1-pyridin-4-yylimetyyli-1H-pyratsol-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
76	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyyliahappo-[7-(1-bentsyyli-1H-pyratsol-4-yyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
79	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyyliahappo-[7-(1-difluorimetyyli-1H-pyratsol-4-yyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
80	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyyliahappo-(4-difluorimetoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi

81	N-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksi-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-2-[(2-metoksietyyli)amino]-1,3-tiatsoli-5-karboksamidi
82	N-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksi-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-4-[(1H-imidatsol-1-yyli)metyyli]bentsamidi
83	N-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksi-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-4-[(1R)-1-asetamidoetyyli]bentsamidi
84	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-{4-metoksi-7-[1-(tetrahydropyran-2-yylimetyyli)-1H-pyratsol-4-yyli]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli}amidi
85	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-{4-metoksi-7-[1-(tetrahydropyran-4-yylimetyyli)-1H-pyratsol-4-yyli]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli}amidi
86	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[7-(1,1-dioksoheksahydro-1H-tiopyran-4-yyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
87	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-{4-metoksi-7-[1-(tetrahydropyran-3-yylimetyyli)-1H-pyratsol-4-yyli]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli}amidi
88	N-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksi-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-4-(2,5-diokso-2,5-dihydro-1H-pyrrol-1-yyli)piperidiini-1-karboksamidi
89	3-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksi-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-1-[4-(2-oksopyrrolidin-1-yyli)fenyli]urea
90	N-[4-({[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksi-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]karbamoyyli}amino)fenyyli]-2-(dimetyyliamino)asetamidi
91	N-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksi-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-4-(2,4-diokso-1,3-tiatsolidin-3-yyli)piperidiini-1-karboksamidi
92	N-[4-({[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksi-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]karbamoyyli}amino)-2-metyylifenyli]asetamidi
93	N4-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-hydroksi-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-N1-(2-hydroksietyyli)-N1-metyylibentseeni-1,4-dikarboksamidi

94	3-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksi-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-1-[4-(3-metyyli-5-okso-4,5-dihydro-1H-pyratsol-1-yyli)fenyyl]urea
95	3-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksi-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-1-[4-(2-okso-1,3-oksatsolidin-3-yyli)fenyyl]urea
96	N1-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksi-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-N4,N4-dimetyylipiperidiini-1,4-dikarboksamidi
97	[4-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yylikarbamoyyli)bentsyyli]metyylikarbamiinihapon metyyliesteri
98	2,8-diatsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
99	4-(2,5-dioksopyrrolidin-1-yyli)piperidiini-1-karboksylihappo-(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
100	4-(2,5-dioksopyrrolidin-1-yyli)piperidiini-1-karboksylihappo-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
101	bisyklo[1.1.1]pentaani-1,3-dikarboksylihappo-(6-fluori-4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi-(2-hydroksietyyli)metyyliamidi
102	2,7-diatsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
103	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-(4-metoksi-7-{1-[2-(2-metoksietoksi)etyyli]-1H-pyratsol-4-yyli}tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)-amidi
104	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-(4-metoksi-7-{1-[(R)-1-(tetrahydropyran-3-yyli)metyyli]-1H-pyratsol-4-yyli}tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
105	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-(4-metoksi-7-{1-[(S)-1-(tetrahydropyran-3-yyli)metyyli]-1Hpyratsol-4-yyli}tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
106	N1-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksi-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]piperidiini-1,4-dikarboksamidi

107	N-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-hydroksi-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-2-oksa-7-atsaspiro[4.4]nonaani-7-karboksamidi
108	N-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksi-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-2-oksa-7-atsaspiro[4.4]nonaani-7-karboksamidi
109	4-({4-metoksi-7-fenyyli-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli}karbamoyyli)-bentsoehappo
110	N-{4-metoksi-7-fenyyli-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli}-4-(1H-1,2,3,4-tetratsol-5-yyli)bentsamidi
111	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[7-(4,4-difluorisykloheksyyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
112	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(3-metyyliaminofenyyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
113	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(5-metyylitiofen-2-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
114	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(5-metyylifuran-2-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
115	4-[(4-metoksi-7-{1-[(pyridin-3-yyli)metyyli]-1H-pyratsol-4-yyli}-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)karbamoyyli]bentsoehappo
116	N-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksi-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-1H-pyratsoli-4-karboksamidi
117	N-{4-metoksi-7-fenyyli-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli}-1H-pyratsoli-4-karboksamidi
118	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-(4-metoksi-7-{1-[(S)-1-(tetrahydropyran-2-yyli)metyyli]-1H-pyratsol-4-yyli}tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
119	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-(4-metoksi-7-{1-[(R)-1-(tetrahydropyran-2-yyli)metyyli]-1H-pyratsol-4-yyli}tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
121	(R)-2,7-diatsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi

122	(S)-2,7-diatsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
123	piperidiini-1,4-dikarboksylihappo-4-dimetyyliamidi-1-[(4-metoksi-7-fenyylitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi]
124	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[7-(2-aminopyridin-4-yyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
125	N-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-4-(4-metyylipiperatsiini-1-karbonyyli)bentsamidi
126	N-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-N'-(2-piperidin-1-yylietyyli)tereftalamidi
127	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(2-metyyliaminopyridin-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
128	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(5-metyylisykloheks-1-enyyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
129	N-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]-4-(4-hydroksi-4-metyylipiperidiini-1-karbonyyli)bentsamidi
130	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[7-(3-fluori-5-metaanisulfonyyliaminofenyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
131	4-(2,5-dioksoimidatsolidin-1-yyli)piperidiini-1-karboksylihappo-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
132	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(3-metyyli-3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
133	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(3-trifluorimetyylipiperidin-1-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
134	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(3-metoksipiperidin-1-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
135	imidatso[1,2-a]pyridiini-3-karboksylihappo-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
136	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksylihappo-[4-metoksi-7-(5-okso-2,5-dihydro-1H-pyrrol-3-yyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi

137	4-(2,5-dioksoimidatsolidin-1-yyli)piperidiini-1-karboksyylihappo-(4-metoksi-7-fenyyliatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli)amidi
138	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyylihappo-[7-(5-amino-2-fluoripyridin-3-yyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
139	N-(2-atsetidin-1-yylietyyli)-N'-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]tereftalamidi
140	2-pyridin-3-yyli-1H-imidatsoli-4-karboksyylihappo-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
141	N-{4-metoksi-7-[3-(trifluorimetyyli)fenyyli]-[1,3]tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli}-8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksamidi
142	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyylihappo-[7-(5-amino-6-fluoripyridin-3-yyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
143	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyylihappo-[7-(5-aminopyridin-3-yyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
144	{4-[7-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yyli)-4-metoksitiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]karbamoyyli}fenyyli}etikkahappo
145	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-((S)-3-metyylisykloheks-1-enyyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi
146	8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani-2-karboksyylihappo-[4-metoksi-7-((R)-3-metyylisykloheks-1-enyyli)tiatsolo[4,5-c]pyridin-2-yyli]amidi

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

2. Farmaseuttinen valmiste, joka käsittää ainakin yhden patenttivaatimuksen 1 mukaisen yhdisteen ja/tai sen fysiologisesti hyväksyttäviä suoloja, solvaatteja ja stereoisomeerejä, mukaan lukien niiden seokset kaikissa suhteissa.

3. Patenttivaatimuksen 2 mukainen farmaseuttinen valmiste, joka käsittää edelleen apuaineita ja/tai adjuvantteja.

4. Farmaseuttinen valmiste, joka käsittää ainakin yhden patenttivaatimuksen 1 mukaisen yhdisteen ja/tai sen fysiologisesti hyväksyttäviä suoloja, solvaatteja ja stereoisomeerejä, mukaan lukien niiden seokset kaikissa suhteissa, ja ainakin yhden muun aktiivisen lääkeyhdisteen.

5. Menetelmä farmaseuttisen valmisteen valmistamiseksi, t u n -
n e t t u siitä, että patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste ja/tai yksi sen fysio-
logisesti hyväksyttävistä suoloista, solvaateista ja stereoisomeereistä, mukaan
lukien niiden seokset kaikissa suhteissa, saatetaan sopivaan annostusmuotoon
5 yhdessä kiinteän, nestemäisen tai osittain nestemäisen apuaineen tai adjuvan-
tin kanssa.

6. Lääke, joka käsittää ainakin yhden patenttivaatimuksen 1 mukai-
sen yhdisteen ja/tai yhden sen fysiologisesti hyväksyttävistä suoloista, solvaa-
teista ja stereoisomeereistä, mukaan lukien niiden seokset kaikissa suhteissa,
10 käytettäväksi patofysiologisten tilojen hoidossa ja/tai ennaltaehkäisyssä.

7. Lääke, joka käsittää ainakin yhden patenttivaatimuksen 1 mukai-
sen yhdisteen ja/tai yhden sen fysiologisesti hyväksyttävistä suoloista, solvaa-
teista ja stereoisomeereistä, mukaan lukien niiden seokset kaikissa suhteissa,
käytettäväksi hoidettaessa ja/tai ennaltaehkäistäessä patofysiologisia tiloja, jot-
15 ka kuuluvat ryhmään, jonka muodostavat hyperproliferatiiviset ja infektioidet
sairaudet ja häiriöt.

8. Patenttivaatimuksen 7 mukaisesti käytettäväksi tarkoitettu lääke,
jolloin hyperproliferatiivinen sairaus tai häiriö on syöpä.

9. Patenttivaatimuksen 8 mukaisesti käytettäväksi tarkoitettu lääke,
20 jolloin syöpä kuuluu ryhmään, jonka muodostavat akuutti ja krooninen lymfaatti-
nen leukemia, akuutti myeloinen leukemia, lisämunuaiskuoren syöpä, virtsara-
kon syöpä, aivosyöpä, rintasyöpä, kohdunkaulan syöpä, kohdunkaulan hyper-
plasia, istukkasyöpä, krooninen myeloinen leukemia, krooninen lymfaattinen
leukemia, koolonsyöpä, kohdun limakalvon syöpä, ruokatorvisyöpä, essentiaa-
25 linen trombosytemia, urogenitaalinen karsinooma, gliooma, glioblastooma, kar-
vasoluleukemia, pään ja kaulan alueen karsinooma, Hodgkinin tauti, Kaposin
sarkooma, keuhkokarsinooma, lymfooma, pahanlaatuinen karsinoidikarsi-
nooma, pahanlaatuinen hyperkalsemia, pahanlaatuinen melanooma, pahanlaa-
tuinen haiman insulinooma, medullaarinen kilpirauhaskarsinooma, melanooma,
30 multippeli myelooma, mycosis fungoides, myeloinen ja lymfaattinen leukemia,
neuroblastooma, non-Hodgkin-lymfooma, ei-pienisolainen keuhkosityöpä, os-
teogeeninen sarkooma, munasarjakarsinooma, haimakarsinooma, itsenäinen

polysytomia, primaarinen aivokarsinoma, primaarinen makroglobulinemia, eturauhassyöpä, munuaissolusyöpä, rabdomyosarkooma, ihosyöpä, pienisolainen keuhkosityöpä, pehmytkudossarkooma, levyepiteelisyöpä, mahasyöpä, kives-
syöpä, kilpirauhassyöpä ja Wilmsin kasvain.

5 10. Patenttivaatimuksen 7 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, josta 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.

15 11. Patenttivaatimuksen 7 mukaisesti käytettäväksi tarkoitettu lääke, jolloin infektioosi sairaus tai häiriö kuuluu ryhmään, jonka muodostavat

i. 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, 20 FIV, BIV, SIV:t, SHIV, CAEV, VMV ja EIAV, ja onkoretrovirus kuuluu ryhmään, jonka muodostavat HTLV-I, HTLV-II ja BLV, hepadnavirus kuuluu ryhmään, jonka 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,

25 ii. bakteeri-infektiotaudit, 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*,

iii. 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.,

iv. 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*.

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

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

b) tehokas määrä toista aktiivista lääkeyhdistettä.