(19) SUOMI - FINLAND
(FI)

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

(10) **FI/EP3924340 T3**

(12) **EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS**
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION

(45) Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning - Translation available to the public **03.03.2025**

(97) Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för det europeiska patentet - Date of grant of European patent **29.01.2025**

(51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering - International patent classification
C07D 231/56 (2006 . 01)
C07D 413/04 (2006 . 01)
C07D 413/14 (2006 . 01)
C07D 417/14 (2006 . 01)
C07D 471/04 (2006 . 01)
C07D 471/10 (2006 . 01)
C07D 487/04 (2006 . 01)
C07D 491/048 (2006 . 01)
C07D 491/08 (2006 . 01)
C07D 491/107 (2006 . 01)
A61P 35/00 (2006 . 01)
C07C 49/86 (2006 . 01)
C07C 309/30 (2006 . 01)
A61K 31/416 (2006 . 01)

(96) Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan - European patent application EP20708434.4

(22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date **10.02.2020**

(97) Patenttihakemuksen julkiseksitulopäivä - Patentansökans publiceringsdag - Patent application available to the public **22.12.2021**

(86) Kansainvälinen hakemus - Internationell ansökan - International application **10.02.2020 PCT/EP2020053241**

(30) Etuoikeus - Prioritet - Priority

11.02.2019 EP EP19156318

(73) Haltija - Innehavare - Holder

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

(72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1• DORSCH, Dieter , Koenigsberger Strasse 17 A , 64372 Ober-Ramstadt , (DE)
2• BLUM, Andreas , Am Bildstock 23 , 64625 Bensheim , (DE)

(74) Asiamies - Ombud - Agent

Papula Oy , P.O.Box 981 , 00101 Helsinki , (FI)

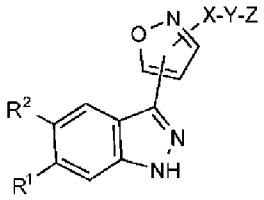
(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

INDATSOLYYLI-ISOKSATSOLIJOHDANNAISIA SAIRAUKSIEN, KUTEN SYÖVÄN, HOITOON

INDAZOLYL-ISOXAZOLE DERIVATIVES FOR THE TREATMENT OF DISEASES SUCH AS CANCER

PATENTTIVAATIMUKSET

1. Yhdisteet, joilla on kaava I



I

jossa

R^1 tarkoittaa Hal:ia, CF_3:a, OA:ta, Het^1:tä, $COOR^3$:a tai $CON(R^3)_2$:ta,

R^2 tarkoittaa H:ta, Hal:ia tai CN:ää,

R^3 tarkoittaa H:ta tai A:ta,

X tarkoittaa fenyleeniä, pyridiinidiyyliä, 1,3-tiatsolidiyyliä tai pyratsolidiyyliä, joista kukin on substituoimaton tai mono-, di- tai trisubstituoitu Hal:lla ja/tai A:lla,

Y on poissa tai tarkoittaa CO:ta, $O[C(R^3)_2]_n$:ää, NR^3CO:ta, $CONR^3$:a, $CONR^3[C(R^3)_2]_n$:ää, $CONHCH_2C(CH_3)_2$:ta, SO_2:ta, $SO_2N(R^3)$:a, -N=:ää tai $S(=O,=NR^3)$:a,

Z tarkoittaa H:ta, A:ta, Hal:ia, OA:ta, $[C(R^3)_2]_nHet^2$:ta tai $N=S(=O)A_2$:ta,

A tarkoittaa haaroittumatonta tai haaroittunutta alkyyliä, jossa on 1-10 C-atomia, jossa yksi tai kaksi ei-vierekkäistä CH- ja/tai CH_2-ryhmää voi olla korvattu O-atomeilla ja jossa 1-7 H-atomia voi olla korvattu R^5:llä,

tai tarkoittaa $(CH_2)_nCyc$:iä,

Cyc tarkoittaa syklistä alkyylia, jossa on 3-7 C-atomia,

R^5 tarkoittaa F:ää, Cl:ää, OH:ia, SO_2A:ta tai $N(R^3)_2$:ta,

Het^1 tarkoittaa pyratsolyyliä, joka voi olla mono- tai disubstituoitu A:lla,

Het^2 tarkoittaa 4-7-jäsenistä monosyklistä aromaattista, tyydyttymätöntä tai tyydyttynyttä het-

erosykliä, jolla on 1-4 N-, O- ja/tai S-atomia, ja joka voi olla substituoimaton tai mono-, di- tai trisubstituoitu A:lla, Hal:lla, CN:llä, OR^3:lla, $[C(R^3)_2]_nN(R^3)_2$:lla, $[C(R^3)_2]_nSO_2A$:lla, $[C(R^3)_2]_nNR^3SO_2A$:lla, Het^3:lla, $=NR^3$:lla ja/tai =O:lla,

tai

tarkoittaa 7-10-jäsenistä bisyklistä aromaattista, tyydyttymätöntä tai tyydyttynyttä heterosykliä, jossa on 1-4 N-, O- ja/tai S-atomia, ja joka voi olla substituoimaton tai mono-, di- tai trisubstituoitu A:lla, Hal:lla, CN:llä, OR^3:lla, $[C(R^3)_2]_nN(R^3)_2$:lla, $[C(R^3)_2]_nSO_2A$:lla, $[C(R^3)_2]_nNR^3SO_2A$:lla, Het^3:lla, $=NR^3$:lla ja/tai =O:lla,

Het^3 tarkoittaa 4-7-jäsenistä monosyklistä aromaattista, tyydyttymätöntä tai tyydyttynyttä heterosykliä, jolla on 1-4 N-, O- ja/tai S-atomia, ja joka voi olla substituoimaton tai mono- tai disubstituoitu A:lla, Hal:lla, OR^3:lla, oksetanyylillä ja/tai =O:lla,

tai

tarkoittaa 7-10-jäsenistä bisyklistä aromaattista, tyydyttymätöntä tai tyydyttynyttä heterosykliä, jolla on 1-4 N-, O- ja/tai S-atomia, ja joka voi olla substituoimaton tai mono- tai disubstituoitu A:lla, Hal:lla, OR^3:lla, oksetanyylillä ja/tai =O:lla,

Hal tarkoittaa F:ää, Cl:ää, Br:ää tai I:tä,

n tarkoittaa lukua 0, 1, 2 tai 3,

ja niiden farmaseuttisesti hyväksyttävät solvaatit, suolat, tautomeerit ja stereoisomeerit, mukaan lukien niiden seokset kaikissa suhteissa, edellyttäen, että kaavan I mukainen yhdiste ja sen farmaseuttisesti hyväksyttävät solvaatit, suolat, tautomeerit ja stereoisomeerit, mukaan lukien niiden seokset kaikissa suhteissa, eivät ole 6-kloori-3-[5-(3-metoksifenyyli)-3-isoksatsolyyli]-1H-indatsoli.

2. Patenttivaatimuksen 1 mukaiset yhdisteet, joissa

Het^2 tarkoittaa pyrrolidinyyliä, piperatsinyyliä, piperidinyyliä, triatsolyyliä, atsetidinyyliä, morfolinyyliä, tiomorfolinyyliä, 2-oksa-6-atsaspiro[3.3]heptan-6-yyliä, 6-oksa-2-atsaspiro[3.4]oktan-2-yyliä, 1-oksa-6-atsaspiro[3.3]heptan-6-yyliä, 2,6-diatsaspiro[3.3]heptan-2-yyliä, oktahydropyrrolo[3,4-b]pyrrolyyliä, oktahydropyrrolo[3,2-b]pyrrolyyliä, 1,4-diatsepanyyliä, pyridinyyliä, 1H-pyridinyyliä, 2H-pyridatsinyyliä, 2,3-dihydropyridatsinyyliä, oktahydro-1H-pyrrolo[3.2-b]pyridinyyliä, 3-tia-6-atsabisyklo[3.1.1]heptanyyliä, 6-oksa-1-atsaspiro[3.3]heptan-1-yyliä, 1H-pyratsolyyliä, tiatsolidinyyliä, 2-oksa-7-atsaspiro[3.5]nonan-7-yyliä, 1,4-oksatsepanyyliä, 2-tia-6-atsaspiro[3.3]heptan-6-yyliä, 2,8-dioksa-5-atsaspiro[3.5]nonan-5-yyliä, 1H-1,3-bentsodiatsol-2-yyliä, 2-oksa-7-atsaspiro[4.4]nonan-7-yyliä, 2-oksa-6-atsaspiro[3.4]oktan-6-yyliä, 8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekan-2-yyliä, 2,6-diatsaspiro[3.4]oktan-6-yyliä, 6-oksa-3-atsabisyklo[3.1.1]heptan-3-yyliä, 2-oksa-5-atsabisyklo[2.2.1]heptan-5-yyliä, 7-oksa-2-atsaspiro[3.5]nonan-2-yyliä, 6-oksa-1-atsaspiro[3.3]heptan-1-yyliä, 2,7-diatsaspiro[3.5]nonan-7-yyliä, 3-oksa-6-atsabisyklo[3.1.1]heptan-6-yyliä, 1H,2H,3H-pyrrolo[3,4-c]pyridin-2-yyliä, 2,7-diatsaspiro[3.5]nonan-2-yyliä, heksahydro-1H-furo[3,4-c]pyrrol-5-yyliä, oktahydropyrrolo[2,3-c]pyrrol-5-yyliä, 5H,6H,7H-pyrrolo[3,4-d]pyrimidiini-6-yyliä, 1H,4H,5H,6H-pyrrolo[3,4-c]pyratsol-5-yyliä, oktahydropyrano[3,4-c]pyrrol-2-yyliä, oktahydrofuro[3,4-c]pyridin-5-yyliä, oktahydropyrrolo[3,4-c]pyrroli-2-yyliä, heksahydro-1H-2lambda6-tieno[3,4-c]pyrrol-5-yyliä tai tetrahydrofuro[3,4-c]pyrrol-5-yyliä, joista kukin voi olla substituoimaton tai mono-, di- tai trisubstituoitu A:lla, Hal:lla, CN:llä, OR^3:lla, $[C(R^3)_2]_nN(R^3)_2$:lla, $[C(R^3)_2]_nSO_2A$:lla, $[C(R^3)_2]_nNR^3SO_2A$:lla, Het^3:lla, $=NR^3$:lla ja/tai =O:lla,

ja niiden farmaseuttisesti hyväksyttävät solvaatit, suolat, tautomeerit ja stereoisomeerit, mukaan lukien niiden seokset kaikissa suhteissa.

3. Patenttivaatimuksen 1 tai 2 mukaiset yhdisteet, joissa

Het^3 tarkoittaa morfolinyyliä, 1H-pyratsolyyliä, 1lambda6-tiomorfolinyyliä, imidatsolyyliä, atsetidinyyliä, piperatsinyyliä, piperidinyyliä, pyridinyyliä, oksetanyyliä, 1,2,4-oksadiatsolyyliä, pyrimidinyyliä, oksolanyyliä, pyrrolidinyyliä, 2-oksa-6-atsaspiro[3.3]heptan-6-yyliä, oksan-4-yyliä, 1,2,3-triatsolyyliä tai 1,2,4-triatsolyyliä, joista kukin voi olla substituoimaton tai mono- tai disubstituoitu A:lla, Hal:lla, OR^3:lla, oksetanyylillä ja/tai =O:lla,

ja niiden farmaseuttisesti hyväksyttävät suolat, tautomeerit ja stereoisomeerit, mukaan lukien niiden seokset kaikissa suhteissa.

4. Patenttivaatimuksen 1 mukaiset yhdisteet, joissa

R^1 tarkoittaa Hal:ia, CF_3:a, OCH_3:a, $OCH_2CH_2OCH_3$:a, OCH_2CH_2OH:ia, 1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyliä, $COOCH_3$:a, $CONH_2$:ta, $CONHCH_3$:a tai $CONHCH_2CH_2OCH_3$:a,

R^2 tarkoittaa H:ta, Hal:ia tai CN:ää,

R^3 tarkoittaa H:ta tai CH_3:a,

X tarkoittaa 1,4-fenyleeniä, 1,3-fenyleeniä, 2-fluori-1,4-fenyleeniä, 2-metyyli-1,4-fenyleeniä, pyridiini-3,6-diyyliä, 1,3-tiatsoli-3,5-diyyliä, 1,3-tiatsoli-2,4-diyyliä, 1,3-tiatsoli-2,5-diyyliä tai pyratsoli-1,4-diyyliä, joista kukin on substituoimaton tai mono-, di- tai trisubstituoitu Hal:lla ja/tai A:lla,

Y on poissa tai tarkoittaa CO:ta, SO_2:ta, NHCO:ta, NCH_3:a, $CONH(CH_2)_n$:ää, $CONHCH_2C(CH_3)_2$:ta, $CON(CH_3)(CH_2)_n$:ää, O:ta, OCH_2:ta, OCH_2CH_2:ta, S(=O)(=NH):ta, -N=:ää tai $SO_2N(CH_3)$:a,

Z tarkoittaa H:ta, A:ta, Hal:ia, OA:ta, $[C(R^3)_2]_nHet^2$:ta tai $N=S(=O)A_2$:ta,

A tarkoittaa haaroittumatonta tai haaroittunutta alkyyliä, jossa on 1-10 C-atomia, jossa yksi tai kaksi ei-vierekkäistä CH- ja/tai CH_2-ryhmää voi olla korvattu O-atomeilla ja jossa 1-7 H-atomia voi olla korvattu R^5:llä,

tai tarkoittaa $(CH_2)_nCyc$:iä,

Cyc tarkoittaa syklistä alkyylia, jossa on 3-7 C-atomia,

R^5 tarkoittaa F:ää, Cl:ää, OH:ia, SO_2A:ta tai $N(R^3)_2$:ta,

Het^1 tarkoittaa pyratsolyyliä, joka voi olla mono- tai disubstituoitu A:lla,

Het^2 tarkoittaa pyrrolidinyyliä, piperatsinyyliä, piperidinyyliä, triatsolyyliä, atsetidinyyliä, morfolinyyliä, tiomorfolinyyliä, 2-oksa-6-atsaspiro[3.3]heptan-6-yyliä, 6-oksa-2-atsaspiro[3.4]oktan-2-yyliä, 1-oksa-6-atsaspiro[3.3]heptan-6-yyliä, 2,6-diatsaspiro[3.3]heptan-2-yyliä, oktahydropyrrolo[3,4-b]pyrrolyyliä, oktahydropyrrolo[3,2-b]pyrrolyyliä, 1,4-diatsepanyyliä, pyridinyyliä, 1H-pyridinyyliä, 2H-pyridatsinyyliä, 2,3-dihydropyridatsinyyliä, oktahydro-1H-pyrrolo[3.2-b]pyridinyyliä, 3-tia-6-atsabisyklo[3.1.1]heptanyyliä, 6-oksa-1-atsaspiro[3.3]heptan-1-yyliä, 1H-pyratsolyyliä, tiatsolidinyyliä, 2-oksa-7-atsaspiro[3.5]nonan-7-yyliä, 1,4-oksatsepanyyliä, 2-tia-6-atsaspiro[3.3]heptan-6-yyliä, 2,8-dioksa-5-atsaspiro[3.5]nonan-5-yyliä, 1H-1,3-bentsodiatsol-2-yyliä, 2-oksa-7-atsaspiro[4.4]nonan-7-yyliä, 2-oksa-6-atsaspiro[3.4]oktan-6-yyliä, 8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekan-2-yyliä, 2,6-diatsaspiro[3.4]oktan-6-yyliä, 6-oksa-3-atsabisyklo[3.1.1]heptan-3-yyliä, 2-oksa-5-atsabisyklo[2.2.1]heptan-5-yyliä, 7-oksa-2-atsaspiro[3.5]nonan-2-yyliä, 6-oksa-1-atsaspiro[3.3]heptan-1-yyliä, 2,7-diatsaspiro[3.5]nonan-7-yyliä, 3-oksa-6-atsabisyk-

lo[3.1.1]heptan-6-yyliä, 1H,2H,3H-pyrrolo[3,4-c]pyridin-2-yyliä, 2,7-diatsaspiro[3.5]nonan-2-yyliä, heksahydro-1H-furo[3,4-c]pyrrol-5-yyliä, oktahydropyrrolo[2,3-c]pyrrol-5-yyliä, 5H,6H,7H-pyrrolo[3,4-d]pyrimidin-6-yyliä, 1H,4H,5H,6H-pyrrolo[3,4-c]pyratsoli-5-yyliä, oktahydropyrano[3,4-c]pyrroli-2-yyliä, oktahydrofuro[3,4-c]pyridin-5-yyliä, oktahydropyrrolo[3,4-c]pyrroli-2-yyliä, heksahydro-1H-2lambda6-tieno[3,4-c]pyrrol-5-yyliä tai tetrahydrofuro[3,4-c]pyrrol-5-yyliä, joista kukin voi olla substituoimaton tai mono-, di- tai trisubstituoitu A:lla, Hal:lla, CN:llä, OR^3:lla, $[C(R^3)_2]_nN(R^3)_2$:lla, $[C(R^3)_2]_nSO_2A$:lla, $[C(R^3)_2]_nNR^3SO_2A$:lla, Het^3:lla, $=NR^3$:lla ja/tai =O:lla, Het^3 tarkoittaa,

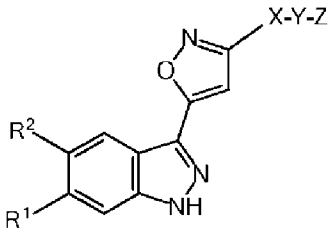
Het^3 tarkoittaa morfolinyyliä, 1H-pyratsolyyliä, 1lambda6-tiomorfolinyyliä, imidatsolyyliä, atsetidinyyliä, piperatsinyyliä, piperidinyyliä, pyridinyyliä, oksetanyyliä, 1,2,4-oksadiatsolyyliä, pyrimidinyyliä, oksolanyyliä, pyrrolidinyyliä, 2-oksa-6-atsaspiro[3.3]heptan-6-yyliä, oksan-4-yyliä, 1,2,3-triatsolyyliä tai 1,2,4-triatsolyyliä, joista kukin voi olla substituoimaton tai mono- tai disubstituoitu A:lla, Hal:lla, OR^3:lla, oksetanyylillä ja/tai =O:lla,

Hal tarkoittaa F:ää, Cl:ää, Br:ää tai I:tä,

n tarkoittaa lukua 0, 1, 2 tai 3,

ja niiden farmaseuttisesti hyväksyttävät suolat, tautomeerit ja stereoisomeerit, mukaan lukien niiden seokset kaikissa suhteissa.

5. Patenttivaatimuksen 1 mukaiset yhdisteet, joilla on kaava Ib



Ib

jossa

R^1 tarkoittaa Hal:ia, CF_3:a, OCH_3:a, $OCH_2CH_2OCH_3$:a, OCH_2CH_2OH:ia, 1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyliä, $COOCH_3$:a, $CONH_2$:ta, $CONHCH_3$:a tai $CONHCH_2CH_2OCH_3$:a,

R^2 tarkoittaa H:ta, Hal:ia tai CN:ää,

R^3 tarkoittaa H:ta tai CH_3:a,

X tarkoittaa 1,4-fenyleeniä, 1,3-fenyleeniä, 2-fluori-1,4-fenyleeniä, 2-metyyli-1,4-fenyleeniä, pyridiini-3,6-diyyliä, 1,3-tiatsoli-3,5-diyyliä, 1,3-tiatsoli-2,4-diyyliä, 1,3-tiatsoli-2,5-diyyliä tai pyratsoli-1,4-diyyliä, joista kukin on substituoimaton tai mono-, di- tai trisubstituoitu Hal:lla ja/tai A:lla,

Y on poissa tai tarkoittaa CO:ta, SO_2:ta, NHCO:ta, NCH_3:a, $CONH(CH_2)_n$:ää, $CONHCH_2C(CH_3)_2$:ta, $CON(CH_3)(CH_2)_n$:ää, O:ta, OCH_2:ta, OCH_2CH_2:ta, S(=O)(=NH):ta, -N=:ää tai $SO_2N(CH_3)$:a,

Z tarkoittaa H:ta, A:ta, Hal:ia, OA:ta, $[C(R^3)_2]_nHet^2$:ta tai $N=S(=O)A_2$:ta,

A tarkoittaa haaroittumatonta tai haaroittunutta alkyyliä, jossa on 1-10 C-atomia, jossa yksi tai kaksi ei-vierekkäistä CH- ja/tai CH_2-ryhmää voi olla korvattu O-atomeilla ja jossa 1-7 H-atomia voi olla korvattu R^5:llä,

tai tarkoittaa $(CH_2)_nCyc$:iä,

Cyc tarkoittaa syklistä alkyylia, jossa on 3-7 C-atomia,

R^5 tarkoittaa F:ää, Cl:ää, OH:ia, SO_2A:ta tai $N(R^3)_2$:ta,

Het^1 tarkoittaa pyratsolyyliä, joka voi olla mono- tai disubstituoitu A:lla,

Het^2 tarkoittaa pyrrolidinyyliä, piperatsinyyliä, piperidinyyliä, triatsolyyliä, atsetidinyyliä, morfolinyyliä, tiomorfolinyyliä, 2-oksa-6-atsaspiro[3.3]heptan-6-yyliä, 6-oksa-2-atsaspiro[3.4]oktan-2-yyliä, 1-oksa-6-atsaspiro[3.3]heptan-6-yyliä, 2,6-diatsaspiro[3.3]heptan-2-yyliä, oktahy-

dropyrrolo[3,4-b]pyrrolyyliä, oktahydropyrrolo[3,2-b]pyrrolyyliä, 1,4-diatsepanyyliä, pyridinyyliä, 1H-pyridinyyliä, 2H-pyridatsinyyliä, 2,3-dihydropyridatsinyyliä, oktahydro-1H-pyrrolo[3.2-b]pyridinyyliä, 3-tia-6-atsabisyklo[3.1.1]heptanyyliä, 6-oksa-1-atsaspiro[3.3]heptan-1-yyliä, 1H-pyratsolyyliä, tiatsolidinyyliä, 2-oksa-7-atsaspiro[3.5]nonan-7-yyliä, 1,4-oksatsepanyyliä, 2-tia-6-atsaspiro[3.3]heptan-6-yyliä, 2,8-dioksa-5-atsaspiro[3.5]nonan-5-yyliä, 1H-1,3-bentsodiatsol-2-yyliä, 2-oksa-7-atsaspiro[4.4]nonan-7-yyliä, 2-oksa-6-atsaspiro[3.4]oktan-6-yyliä, 8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekan-2-yyliä, 2,6-diatsaspiro[3.4]oktan-6-yyliä, 6-oksa-3-atsabisyklo[3.1.1]heptan-3-yyliä, 2-oksa-5-atsabisyklo[2.2.1]heptan-5-yyliä, 7-oksa-2-atsaspiro[3.5]nonan-2-yyliä, 6-oksa-1-atsaspiro[3.3]heptan-1-yyliä, 2,7-diatsaspiro[3.5]nonan-7-yyliä, 3-oksa-6-atsabisyklo[3.1.1]heptan-6-yyliä, 1H,2H,3H-pyrrolo[3,4-c]pyridin-2-yyliä, 2,7-diatsaspiro[3.5]nonan-2-yyliä, heksahydro-1H-furo[3,4-c]pyrrol-5-yyliä, oktahydropyrrolo[2,3-c]pyrrol-5-yyliä, 5H,6H,7H-pyrrolo[3,4-d]pyrimidiini-6-yyliä, 1H,4H,5H,6H-pyrrolo[3,4-c]pyratsoli-5-yyliä, oktahydropyrano[3,4-c]pyrroli-2-yyliä, oktahydrofuro[3,4-c]pyridin-5-yyliä, oktahydropyrrolo[3,4-c]pyrroli-2-yyliä, heksahydro-1H-2lambda6-tieno[3,4-c]pyrrol-5-yyliä tai tetrahydrofuro[3,4-c]pyrrol-5-yyliä, joista kukin voi olla substituoimaton tai mono-, di- tai trisubstituoitu A:lla, Hal:lla, CN:llä, OR^3:lla, $[C(R^3)_2]_nN(R^3)_2$:lla, $[C(R^3)_2]_nSO_2A$:lla, $[C(R^3)_2]_nNR^3SO_2A$:lla, Het^3:lla, $=NR^3$:lla ja/tai =O:lla, Het^3 tarkoittaa,

Het^3 tarkoittaa morfolinyyliä, 1H-pyratsolyyliä, 1lambda6-tiomorfolinyyliä, imidatsolyyliä, atsetidinyyliä, piperatsinyyliä, piperidinyyliä, pyridinyyliä, oksetanyyliä, 1,2,4-oksadiatsolyyliä, pyrimidinyyliä, oksolanyyliä, pyrrolidinyyliä, 2-oksa-6-atsaspiro[3.3]heptan-6-yyliä, oksan-4-yyliä, 1,2,3-

triatsolyyliä tai 1,2,4-triatsolyyliä, joista kukin voi olla substituoimaton tai mono- tai disubstituoitu A:lla, Hal:lla, OR^3:lla, oksetanyylillä ja/tai =O:lla,

Hal tarkoittaa F:ää, Cl:ää, Br:ää tai I:tä,

n tarkoittaa lukua 0, 1, 2 tai 3,

ja niiden farmaseuttisesti hyväksyttävät suolat, tautomeerit ja stereoisomeerit, mukaan lukien niiden seokset kaikissa suhteissa.

6. Patenttivaatimuksen 1 mukaiset yhdisteet, jotka on valittu seuraavasta ryhmästä:

Nro	Nimi
”A1”	2-[1-(4-{5-[6-(trifluorimetyyli)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)pyrrolidin-2-yyli]propan-2-oli
”A2”	2-[(2R)-1-(4-{5-[6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)pyrrolidin-2-yyli]propan-2-oli
”A3”	3-(3-{4-[(2S)-2,4-dimetyylipiperatsiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli
”A4”	{4-[5-(6-bromi-1H-indatsol-3-yyli)-isoksatsol-3-yyli]fenyyli}-[(S)-2-(1-hydroksi-1-metyylietyyli)pyrrolidin-1-yyli]metanoni
”A5”	2-[(2S)-1-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)pyrrolidin-2-yyli]propan-2-oli
”A6”	4-{5-[5-syano-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}-N,N-dimetyylibentsamidi
”A7”	5-fluori-3-(3-{4-[(2S)-2-(metaanisulfonyylimetyyli)pyrrolidiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli

Nro	Nimi
”A8”	2-[(2R)-1-(4-{5-[6-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)pyrrolidin-2-yyli]propan-2-oli
”A9”	3-(3-{4-[(2S)-2,4-dimetyylipiperatsiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-6-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)-1H-indatsoli
”A10”	5-kloori-3-(5-{4-[(2S)-2,4-dimetyylipiperatsiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-3-yyli)-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli
”A11”	3-(5-{4-[(2S)-2,4-dimetyylipiperatsiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-3-yyli)-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli-5-karbonitriili
”A12”	4-{5-[5-kloori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}-N,N-dimetyylibentsamidi
”A13”	5-kloori-6-(2-metoksietoksi)-3-[3-(6-metyylipyridin-3-yyli)-1,2-oksatsol-5-yyli]-1H-indatsoli
”A14”	5-kloori-6-(2-metoksietoksi)-3-{3-[4-(1H-1,2,4-triatsol-1-yyli)fenyyli]-1,2-oksatsol-5-yyli}-1H-indatsoli
”A15”	5-kloori-3-[3-(4-metaanisulfonyylifenyyli)-1,2-oksatsol-5-yyli]-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli
”A16”	5-fluori-3-[3-(4-metaanisulfonyylifenyyli)-1,2-oksatsol-5-yyli]-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli
”A17”	N-(4-{5-[5-kloori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}fenyyli)asetamidi

Nro	Nimi
”A18”	N-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}fenyyli)asetamidi
”A19”	metyyli-3-{3-[4-(dimetyylikarbamoyyli)fenyyli]-1,2-oksatsol-5-yyli}-1H-indatsoli-6-karboksylaatti
”A20”	4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}-N,N-dimetyylibentsamidi
”A21”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-{3-[4-(1H-1,2,4-triatsol-1-yyli)fenyyli]-1,2-oksatsol-5-yyli}-1H-indatsoli
”A22”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-[3-(6-metyylipyridin-3-yyli)-1,2-oksatsol-5-yyli]-1H-indatsoli
”A23”	N-(2-metoksietyyli)-3-(3-{4-[(2-metoksietyyli)karbamoyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli-6-karboksamidi
”A24”	3-[3-(4-dimetyylikarbamoyylifenyyli)isoksatsol-5-yyli]-1H-indatsoli-6-karboksyylihappometyyliamidi
”A25”	3-{3-[4-(dimetyylikarbamoyyli)fenyyli]-1,2-oksatsol-5-yyli}-N-(2-metoksietyyli)-1H-indatsoli-6-karboksamidi
”A26”	5-fluori-3-{3-[4-(3-fluoriatsetidiini-1-karbonyyli)fenyyli]-1,2-oksatsol-5-yyli}-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli
”A27”	5-fluori-3-(3-{4-[(3R)-3-fluoripyrrolidiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli
”A28”	1-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)atsetidiini-3-karbonitriili

Nro	Nimi
”A29”	5-fluori-3-{3-[4-(3-metaanisulfonyyliatsetidiini-1-karbonyyli)fenyyli]-1,2-oksatsol-5-yyli}-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli
”A30”	4-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)-1lambda6-tiomorfoliini-1,1-dioni
”A31”	N-syklopropyyli-4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}-N-metyylibentsamidi
”A32”	5-fluori-3-(3-{4-[(3S)-3-fluoripyrrolidiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli
”A33”	5-fluori-3-{3-[4-(3-metoksiatsetidiini-1-karbonyyli)fenyyli]-1,2-oksatsol-5-yyli}-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli
”A34”	1-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)-3-metyyliatsetidin-3-oli
”A35”	N-[dimetyyli(okso)-lambda6-sulfanylideeni]-4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsamidi
”A36”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-{3-[4-(4-metyylipiperatsiini-1-karbonyyli)fenyyli]-1,2-oksatsol-5-yyli}-1H-indatsoli
”A37”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-{3-[4-(4-metyylipiperatsin-1-yyli)fenyyli]-1,2-oksatsol-5-yyli}-1H-indatsoli
”A38”	3-[3-(6-etoksipyridin-3-yyli)-1,2-oksatsol-5-yyli]-5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli
”A39”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-{3-[6-(4-metyylipiperatsin-1-yyli)pyridin-3-yyli]-1,2-oksatsol-5-yyli}-1H-indatsoli

Nro	Nimi
”A40”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[2-(morfolin-4-yyli)etoksi]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A41”	1-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-isoksatsol-3-yyli}fenyyli)-1H-pyridin-2-oni
”A42”	3-{3-[4-(1,4-diatsepan-1-yyli)fenyyli]-1,2-oksatsol-5-yyli}-5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli
”A43”	(4-{3-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]isoksatsol-5-yyli}fenyyli)morfolin-4-yylimetanoni
”A44”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-{3-[4-(1,4-oksatsepaani-4-karbonyyli)fenyyli]-1,2-oksatsol-5-yyli}-1H-indatsoli
”A45”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[4-(oksetan-3-yyli)piperatsiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A46”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-{3-[4-(piperatsiini-1-karbonyyli)fenyyli]-1,2-oksatsol-5-yyli}-1H-indatsoli
”A47”	[(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}fenyyli)imino]dimetyyli-lambda6-sulfanoni
”A48”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-[3-(1,3-tiatsol-5-yyli)-1,2-oksatsol-5-yyli]-1H-indatsoli
”A49”	4-{5-[5-fluori-6-(3-hydroksi-2-metoksipropoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}-N,N-dimetyylibentsamidi
”A50”	3-(3-{4-[(2S)-2,4-dimetyylipiperatsiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-6-(trifluorimetyyli)-1H-indatsoli

Nro	Nimi
”A51”	[(2S)-1-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)pyrrolidin-2-yyli]metanoli
”A52”	[(2R)-1-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)pyrrolidin-2-yyli]metanoli
”A53”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[3-(morfolin-4-yyli)atsetidiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A54”	[1-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)-4-metyylipiperatsin-2-yyli]metanoli
”A55”	5-fluori-3-(3-{4-[(2R)-2-(metaanisulfonyylimetyyli)pyrrolidiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli
”A56”	1-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)-3-metyyliatsetidin-3-amiini
”A57”	4-[1-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)atsetidin-3-yyli]-1lambda6-tiomorfoliini-1,1-dioni
”A58”	2-[(2R)-1-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)atsetidin-2-yyli]propan-2-oli
”A59”	2-[(2S)-1-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)atsetidin-2-yyli]propan-2-oli
”A60”	7-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)-2-oksa-7-atsaspiro[3.5]nonaani

Nro	Nimi
”A61”	5-fluori-6-metoksi-3-(3-{4-[3-(morfolin-4-yyli)atsetidiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A62”	(5-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]isoksatsol-3-yyli}pyridin-2-yyli)-((R)-2-hydroksimetyyli-pyrrolidin-1-yyli)-metanoni
”A63”	(5-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-isoksatsol-3-yyli}pyridin-2-yyli)-((S)-2-hydroksimetyylipyrrolidin-1-yyli)metanoni
”A64”	(4-{5-[5-kloori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]isoksatsol-3-yyli}fenyyli)-(3-morfolin-4-yyliatsetidin-1-yyli)metanoni
”A65”	(4-{5-[5-kloori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]isoksatsol-3-yyli}fenyyli)-[3-(4-metyylipiperatsin-1-yyli)atsetidin-1-yyli]metanoni
”A66”	(4-{5-[5-kloori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]isoksatsol-3-yyli}fenyyli)-((S)-3-hydroksimetyylimorfolin-4-yyli)metanoni
”A67”	(4-{5-[5-kloori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]isoksatsol-3-yyli}fenyyli)-((R)-3-hydroksimetyylimorfolin-4-yyli)metanoni
”A68”	(5-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]isoksatsol-3-yyli}pyridin-2-yyli)-(4-oksetan-3-yylipiperatsin-1-yyli)metanoni
”A69”	(5-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]isoksatsol-3-yyli}pyridin-2-yyli)-(3-morfolin-4-yyliatsetidin-1-yyli)metanoni
”A70”	(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]isoksatsol-3-yyli}-2-metyylifenyyli)-(cis)-tetrahydro-furo[3,4-

Nro	Nimi
	c]pyrrol-5-yylimetanoni
”A71”	(2-fluori-4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]isoksatsol-3-yyli}fenyyli)-(cis)-tetrahydro-furo[3,4-c]pyrrol-5-yylimetanoni
”A72”	N-[2-(dimetyyliamino)etyyli]-4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsamidi
”A73”	4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}-N-(1-metyyliatsetidin-3-yyli)bentsamidi
”A74”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-[3-(4-{2-oksa-6-atsaspiro[3.3]heptaani-6-karbonyyli}fenyyli)-1,2-oksatsol-5-yyli]-1H-indatsoli
”A75”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[3-(1H-pyratsol-1-yyli)atsetidiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A76”	1-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)-N,N-dimetyyliatsetidiini-3-amiini
”A77”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-[3-(4-{6-oksa-2-atsaspiro[3.4]oktaani-2-karbonyyli}fenyyli)-1,2-oksatsol-5-yyli]-1H-indatsoli
”A78”	4-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)-1lambda4-tiomorfolin-1-oni
”A79”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-[3-(4-{1-oksa-6-atsaspiro[3.3]heptaani-6-karbonyyli}fenyyli)-1,2-oksatsol-5-yyli]-1H-indatsoli

Nro	Nimi
”A80”	4-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)-1-imino-1lambda6-tiomorfolin-1-oni
”A81”	5-fluori-3-{3-[5-(3-fluoriatsetidiini-1-karbonyyli)pyridin-2-yyli]-1,2-oksatsol-5-yyli}-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli
”A82”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{5-[3-(morfolin-4-yyli)atsetidiini-1-karbonyyli]pyridin-2-yyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A83”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{5-[3-(morfolin-4-yyli)atsetidiini-1-karbonyyli]-1,3-tiatsol-2-yyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A84”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[3-(morfolin-4-yyli)atsetidiini-1-karbonyyli]-1,3-tiatsol-2-yyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A85”	5-fluori-3-(3-{4-[3-(1H-imidatsol-1-yyli)atsetidiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli
”A86”	5-fluori-3-{3-[5-(3-fluoriatsetidiini-1-karbonyyli)-1,3-tiatsol-2-yyli]-1,2-oksatsol-5-yyli}-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli
”A87”	5-fluori-3-{3-[4-(3-fluoriatsetidiini-1-karbonyyli)-1,3-tiatsol-2-yyli]-1,2-oksatsol-5-yyli}-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli
”A88”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-[3-(4-{6-metyyli-2,6-diatsaspiro[3.3]heptaani-2-karbonyyli}fenyyli)-1,2-oksatsol-5-yyli]-1H-indatsoli
”A89”	(cis)-1-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)oktahydropyrrolo[3,4-b]pyrrol-6-oni

Nro	Nimi
”A90”	N-{[(2S)-1-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)pyrrolidin-2-yyli]metyyli}metaanisulfonamidi
”A91”	6-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}-N,N-dimetyylipyridiini-3-karboksamidi
”A92”	2-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}-N,N-dimetyyli-1,3-tiatsoli-5-karboksamidi
”A93”	2-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}-N,N-dimetyyli-1,3-tiatsoli-4-karboksamidi
”A94”	N-{[(2R)-1-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)pyrrolidin-2-yyli]metyyli}metaanisulfonamidi
”A95”	[(2S)-1-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)atsetidin-2-yyli]metaani
”A96”	1-(5-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]isoksatsol-3-yyli}pyridiini-2-karbonyyli)atsetidiini-3-karbonitriili
”A97”	[(2R)-1-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)atsetidin-2-yyli]metanoli
”A98”	(3-fluoriatsetidin-1-yyli)-(5-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]isoksatsol-3-yyli}pyridin-2-yyli)metanoni
”A99”	5-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]isoksatsol-3-yyli}pyridiini-2-karboksyylihappodimetyyliamidi

Nro	Nimi
”A100”	5-fluori-3-(3-{6-[(3R)-3-fluoripyrrolidiini-1-karbonyyli]pyridin-3-yyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli
”A101”	5-fluori-3-[3-(4-{3-fluori-[1,3'-biatsetidiini]-1'-karbonyyli}fenyyli)-1,2-oksatsol-5-yyli]-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli
”A102”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[3-(4-metyylipiperatsin-1-yyli)atsetidiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A103”	1-[1-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)atsetidin-3-yyli]piperidin-4-oli
”A104”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-{3-[4-(morfoliini-4-karbonyyli)fenyyli]-1,2-oksatsol-5-yyli}-1H-indatsoli
”A105”	[(3R)-4-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)morfolin-3-yyli]metanoli
”A106”	[(3S)-4-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)morfolin-3-yyli]metanoli
”A107”	2-[(2S)-1-(5-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}pyridiini-2-karbonyyli)pyrrolidin-2-yyli]propan-2-oli
”A108”	6-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)-3lambda6-tia-6-atsabisyklo[3.1.1]heptaani-3,3-dioni
”A109”	(5-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-isoksatsol-3-yyli}pyridin-2-yyli)-[(R)-2-(1-hydroksi-1-metyyli-

Nro	Nimi
	etyyli)pyrrolidin-1-yyli]metanoni
”A110”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[(3S)-3-(metoksimetyyli)morfoliini-4-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A111”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[(3R)-3-(metoksimetyyli)morfoliini-4-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A112”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-[3-(4-{6-oksa-1-atsaspiro[3.3]heptaani-1-karbonyyli}fenyyli)-1,2-oksatsol-5-yyli]-1H-indatsoli
”A113”	(4-{3-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]isoksatsol-5-yyli}fenyyli)-(4-metyylipiperatsin-1-yyli)metanoni
”A114”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[(3R)-3-metyylimorfoliini-4-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A115”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[(3S)-3-metyylimorfoliini-4-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A116”	4-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)-1-metyylipiperatsin-2-oni
”A117”	5-fluori-3-(3-{4-[(2S)-2-(metaanisulfonyylimetyyli)pyrrolidiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-6-metoksi-1H-indatsoli
”A118”	(5-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]isoksatsol-3-yyli}pyridin-2-yyli)-[(S)-2-(1-hydroksi-1-metyylietyyli)atsetidin-1-yyli]metanoni

Nro	Nimi
”A119”	(5-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]isoksatsol-3-yyli}pyridin-2-yyli)-[(R)-2-(1-hydroksi-1-metyylietyyli)atsetidin-1-yyli]metanoni
”A120”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[3-(pyridin-4-yyli)atsetidiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A121”	4-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)-3-metyyli-1lambda6-tiomorfoliini-1,1-dioni
”A122”	4-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}fenyyli)-1lambda6-tiomorfoliini-1,1-dioni
”A123”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-{3-[4-(4-metyyli-1,4-diatsepan-1-yyli)fenyyli]-1,2-oksatsol-5-yyli}-1H-indatsoli
”A124”	3-(3-{4-[(cis)-4-metyylioktahydro-1H-pyrrolo[3,2-b]pyridin-1-yyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli
”A125”	3-(3-{4-[(cis)-4-metyyli-oktahydropyrrolo[3,2-b]pyrrol-1-yyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli
”A126”	3-(3-{4-[(trans)-4-metyylioktahydropyrrolo[3,2-b]pyrrol-1-yyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli
”A127”	4-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}fenyyli)-1lambda4-tiomorfolin-1-oni

Nro	Nimi
”A128”	1-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}fenyyli)piperidin-4-oli
”A129”	1-[(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}fenyyli)imino]-1lambda6-tiomorfolin-1-oni
”A130”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-[3-(6-metoksipyridin-3-yyli)isoksatsol-5-yyli]-1H-indatsoli
”A131”	4-(5-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}pyridin-2-yyli)-1lambda6-tiomorfoliini-1,1-dioni
”A132”	4-[2-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}fenoksi)etyyli]-1lambda6-tiomorfoliini-1,1-dioni
”A133”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[2-(4-metyylipiperatsin-1-yyli)etoksi]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A134”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[2-(piperatsin-1-yyli)etoksi]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A135”	3-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-isoksatsol-3-yyli}-N,N-dimetyylibentsamidi
”A136”	2-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]isoksatsol-3-yyli}fenyyli)-6-metyyli-2H-pyridatsin-3-oni
”A137”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-[3-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)isoksatsol-5-yyli]-1H-indatsoli
”A138”	2-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}fenyyli)-

Nro	Nimi
	1lambda6,2-tiatsolidiini-1,1-dioni
”A139”	4-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}fenyyli)morfolin-3-oni
”A140”	4-(5-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}pyridin-2-yyli)-1lambda4-tiomorfolin-1-oni
”A141”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-{3-[6-(morfolin-4-yyli)pyridin-3-yyli]-1,2-oksatsol-5-yyli}-1H-indatsoli
”A142”	2-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}fenyyli)-2,3-dihydropyridatsin-3-oni
”A143”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-{3-[4-(pyridin-2-yylioksi)fenyyli]-1,2-oksatsol-5-yyli}-1H-indatsoli
”A144”	4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}-N,N-dimetyylibentseeni-1-sulfonamidi
”A145”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{6-[3-(morfolin-4-yyli)atsetidin-1-yyli]pyridin-3-yyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A146”	(4-{3-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]isoksatsol-5-yyli}fenyyli)-(3-morfolin-4-yyliatsetidin-1-yyli)metanoni
”A147”	(4-{3-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]isoksatsol-5-yyli}fenyyli)-[(R)-2-(1-hydroksi-1-metyylietyyli)atsetidin-1-yyli]metanoni
”A148”	(4-{3-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]isoksatsol-5-yyli}fenyyli)-[(S)-2-(1-hydroksi-1-metyylietyyli)atsetidin-1-yyli]metanoni

Nro	Nimi
”A149”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[3-(pyridin-2-yyli)atsetidiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A150”	4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}-N-(2-metaanisulfonyylietyyli)-N-metyylibentsamidi
”A151”	6-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)-2lambda6-tia-6-atsaspiro[3.3]heptaani-2,2-dioni
”A152”	5-fluori-3-(3-{4-[(2S)-2-(metaanisulfonyylimetyyli)atsetidiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli
”A153”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[3-(morfolin-4-yyli)pyrrolidiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A154”	5-fluori-3-(3-{4-[(2R)-2-(metaanisulfonyylimetyyli)atsetidiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli
”A155”	5-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)-2,8-dioksa-5-atsaspiro[3.5]nonaani
”A156”	N-[(1H-1,3-bentsodiatsol-2-yyli)metyyli]-4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsamidi
”A157”	7-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)-2-oksa-7-atsaspiro[4.4]nonaani

Nro	Nimi
”A158”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-[3-(4-{2-oksa-6-atsaspiro[3.4]oktaani-6-karbonyyli}fenyyli)-1,2-oksatsol-5-yyli]-1H-indatsoli
”A159”	2-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)-8-oksa-2-atsaspiro[4.5]dekaani
”A160”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-[3-(4-{2-metyyli-2,6-diatsaspiro[3.4]oktaani-6-karbonyyli}fenyyli)-1,2-oksatsol-5-yyli]-1H-indatsoli
”A161”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-[3-(4-{6-oksa-3-atsabisyklo[3.1.1]heptaani-3-karbonyyli}fenyyli)-1,2-oksatsol-5-yyli]-1H-indatsoli
”A162”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[(1S,4S)-2-oksa-5-atsabisyklo[2.2.1]heptaani-5-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A163”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[(1R,4R)-2-oksa-5-atsabisyklo[2.2.1]heptaani-5-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A164”	4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}-N-[2-metyyli-2-(morfolin-4-yyli)propyyli]bentsamidi
”A165”	2-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)-7-oksa-2-atsaspiro[3.5]nonaani
”A166”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[3-(3-metyyli-1,2,4-oksadiatsol-5-yyli)atsetidiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-

Nro	Nimi
	1H-indatsoli
”A167”	(4-{5-[5-kloori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]isoksatsol-3-yyli}fenyyli)-(4-metyylipiperatsin-1-yyli)metanoni
”A168”	(2-fluori-4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]isoksatsol-3-yyli}fenyyli)-(3-morfolin-4-yyliatsetidin-1-yyli)metanoni
”A169”	(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]isoksatsol-3-yyli}-2-metyylifenyyli)-(6-oksa-1-atsaspiro[3.3]hept-1-yyli)metanoni
”A170”	(2-fluori-4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]isoksatsol-3-yyli}fenyyli)-(6-oksa-1-atsaspiro[3.3]hept-1-yyli)metanoni
”A171”	(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]isoksatsol-3-yyli}-2-metyylifenyyli)-(3-morfolin-4-yyliatsetidin-1-yyli)metanoni
”A172”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[3-(pyrimidin-4-yyli)atsetidiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A173”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[3-(2-metyylipyrimidin-4-yyli)atsetidiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A174”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[2-metyyli-4-(oksetan-3-yyli)piperatsiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli

Nro	Nimi
”A175”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[4-(oksolan-3-yyli)piperatsiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A176”	7-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)-2-metyyli-2,7-diatsaspiro[3.5]nonaani
”A177”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[3-(pyrrolidin-1-yyli)atsetidiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A178”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[3-(pyrrolidin-1-yyli)atsetidiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A179”	3-(3-{4-[4-(syklopropyylimetyyli)piperatsiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli
”A180”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[(2R)-2-metyylimorfoliini-4-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A181”	1-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)-N,N,3-trimetyyliatsetidiini-3-amiini
”A182”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-[3-(4-{3-oksa-6-atsabisyklo[3.1.1]heptaani-6-karbonyyli}fenyyli)-1,2-oksatsol-5-yyli]-1H-indatsoli
”A183”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-[3-(4-1H,2H,3H-pyrrolo[3,4-c]pyridiini-2-karbonyyli}fenyyli)-1,2-oksatsol-5-yyli]-1H-indatsoli

Nro	Nimi
”A184”	(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]isoksatsol-3-yyli}fenyyli)-((R)-3-metaanisulfonyylimetyylimorfolin-4-yyli)metanoni
”A185”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-[3-(4-{4-[(3R)-oksolan-3-yyli]piperatsiini-1-karbonyyli}fenyyli)-1,2-oksatsol-5-yyli]-1H-indatsoli
”A186”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-[3-(4-{4-[(3S)-oksolan-3-yyli]piperatsiini-1-karbonyyli}fenyyli)-1,2-oksatsol-5-yyli]-1H-indatsoli
”A187”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-{3-[4-(3-{2-oksa-6-atsaspiro[3.3]heptan-6-yyli}atsetidiini-1-karbonyyli)fenyyli]-1,2-oksatsol-5-yyli}-1H-indatsoli
”A188”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[4-(oksan-4-yyli)piperatsiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A189”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[(2S)-2-metyylimorfoliini-4-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A190”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[(2R)-2-metyyli-4-(oksetan-3-yyli)piperatsiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A191”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[(2S)-2-metyyli-4-(oksetan-3-yyli)piperatsiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatso
”A192”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[3-(pyridin-3-yyli)atsetidiini-1-kar-

Nro	Nimi
	bonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A193”	(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]isoksatsol-3-yyli}-2-metyylifenyyli)-(4-oksetan-3-yylipiperatsin-1-yyli)metanoni
”A194”	(4-{5-[5-kloori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]isoksatsol-3-yyli}fenyyli)-(4-oksetan-3-yylipiperatsin-1-yyli)metanoni
”A195”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-[3-(4-{3-[4-(2-metoksietyyli)-4H-1,2,4-triatsol-3-yyli]atsetidiini-1-karbonyyli}fenyyli)-1,2-oksatsol-5-yyli]-1H-indatsoli
”A196”	(2-fluori-4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]isoksatsol-3-yyli}fenyyli)-(4-oksetan-3-yylipiperatsin-1-yyli)metanoni
”A197”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-[3-(4-{3-[4-(oksetan-3-yyli)piperatsin-1-yyli]atsetidiini-1-karbonyyli}fenyyli)-1,2-oksatsol-5-yyli]-1H-indatsoli
”A198”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[4-(oksetan-3-yyli)-1,4-diatsepaani-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A199”	2-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)-7-(oksetan-3-yyli)-2,7-diatsaspiro[3.5]nonaani
”A200”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-[3-(4-{3-[(3S)-3-metyylimorfolin-4-yyli]atsetidiini-1-karbonyyli}fenyyli)-1,2-oksatsol-5-yyli]-1H-indatsoli

Nro	Nimi
”A201”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-[3-(4-{3-[(3R)-3-metyylimorfolin-4-yyli]atsetidiini-1-karbonyyli}fenyyli)-1,2-oksatsol-5-yyli]-1H-indatsoli
”A202”	3-(3-{4-[(cis)-heksahydro-1H-furo[3,4-c]pyrroli-5-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli
”A203”	(cis)-5-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)oktahydropyrrolo[2,3-c]pyrrol-2-oni
”A204”	4-[1-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)atsetidin-3-yyli]morfolin-3-oni
”A205”	2-{[5-fluori-3-(3-{4-[4-(oksetan-3-yyli)piperatsiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsol-6-yyli]oksi}etan-1-oli
”A206”	1-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)-3-(pyridin-4-yyli)atsetidin-3-oli
”A207”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-[3-(4-{5H,6H,7H-pyrrolo[3,4-d]pyrimidiini-6-karbonyyli}fenyyli)-1,2-oksatsol-5-yyli]-1H-indatsoli
”A208”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-[3-(4-1H,4H,5H,6H-pyrrolo[3,4-c]pyratsoli-5-karbonyyli}fenyyli)-1,2-oksatsol-5-yyli]-1H-indatsoli
”A209”	2-{[5-fluori-3-(3-{4-[3-(morfolin-4-yyli)atsetidiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsol-6-yyli]oksi}etan-1-oli

Nro	Nimi
”A210”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-[3-(4-{3-[(2S)-2-metyylimorfolin-4-yyli]atsetidiini-1-karbonyyli}fenyyli)-1,2-oksatsol-5-yyli]-1H-indatsoli
”A211”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-[3-(4-{3-[(2R)-2-metyylimorfolin-4-yyli]atsetidiini-1-karbonyyli}fenyyli)-1,2-oksatsol-5-yyli]-1H-indatsoli
”A212”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[3-(pyrimidin-5-yyli)atsetidiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A213”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-[3-(4-{1-metyyli-1H,4H,5H,6H-pyrrolo[3,4-c]pyratsoli-5-karbonyyli}fenyyli)-1,2-oksatsol-5-yyli]-1H-indatsoli
”A214”	3-(3-{4-[(cis)-oktahydropyrano[3,4-c]pyrroli-2-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli
”A215”	3-(3-{4-[(cis)-oktahydrofuro[3,4-c]pyridiini-5-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli
”A216”	3-(3-{4-[(cis)-5-(oksetan-3-yyli)-oktahydropyrrolo[3,4-c]pyrroli-2-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli
”A217”	(cis)-5-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)heksahydro-1H-2lambda6-tieno[3,4-c]pyrroli-2,2-dioni
”A218”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[3-(1-metyyli-1H-pyratsol-4-yyli)atsetidiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-ind-

Nro	Nimi
	atsoli
”A219”	14-[5-(5-fluori-6-metoksi-1H-indatsol-3-yyli)isoksatsol-3-yyli]fenyyli}-(4-oksetan-3-yylipiperatsin-1-yyli)metanoni
”A220”	14-[5-(5-fluori-6-metoksi-1H-indatsol-3-yyli)isoksatsol-3-yyli]fenyyli}-(cis)-tetrahydro-furo[3,4-c]pyrrol-5-yylimetanoni
”A221”	1-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)-3-(pyridin-3-yyli)atsetidin-3-oli
”A222”	{[1-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)pyrrolidin-2-yyli]metyyli}(metyyli)amiini
”A223”	3-(3-{4-[(cis)-oktahydropyrrolo[3,4-c]pyrroli-2-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli
”A224”	2-[(5-fluori-3-{3-[4-(piperatsiini-1-karbonyyli)fenyyli]-1,2-oksatsol-5-yyli}-1H-indatsol-6-yyli)oksi]etan-1-oli
”A225”	14-[5-(5-fluori-6-metoksi-1H-indatsol-3-yyli)isoksatsol-3-yyli]fenyyli}piperatsin-1-yylimetanoni
”A226”	(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}fenyyli)(imino)metyyli-lambda6-sulfanoni
”A227”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-{3-[4-(morfoliini-4-sulfonyyli)fenyyli]-1,2-oksatsol-5-yyli}-1H-indatsoli
”A228”	2-[4-(4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoyyli)piperatsin-1-yyli]propaani-1,3-dioli

Nro	Nimi
”A229”	6-etoksi-5-fluori-3-(3-{4-[4-(oksetan-3-yyli)piperatsiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A230”	3-{3-[4-(3,3-dimetyylipiperidin-4-yyli)fenyyli]isoksatsol-5-yyli}-5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli
”A231”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-{3-[4-(1,3,3-trimetyylipiperidin-4-yyli)fenyyli]isoksatsol-5-yyli}-1H-indatsoli
”A232”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[(2,2,3,3,5,5,6,6-$^{2}H_{8}$)piperatsiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A233”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[4-(oksetan-3-yyli)(2,2,3,3,5,5,6,6-$^{2}H_{8}$)piperatsiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli
”A234”	2-{[5-fluori-3-(3-{4-[4-(oksetan-3-yyli)(2,2,3,3,5,5,6,6-^{2}H8)piperatsiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsol-6-yyli]oksi}etan-1-oli

ja niiden farmaseuttisesti hyväksyttävät solvaatit, suolat, tautomeerit ja stereoisomeerit, mukaan lukien niiden seokset kaikissa suhteissa.

7. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, jossa yhdiste on

”A45”	5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-(3-{4-[4-(oksetan-3-yyli)piperatsiini-1-karbonyyli]fenyyli}-1,2-oksatsol-5-yyli)-1H-indatsoli

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

8. Menetelmä patenttivaatimusten 1-7 mukaisten kaavan I mukaisten yhdisteiden ja niiden farmaseuttisesti hyväksyttävien suolojen, solvaattien, tautomeerien ja stereoisomeerien valmistamiseksi, t u n n e t t u siitä, että

a) valmistettaessa yhdisteitä, joilla on kaava I,

jossa

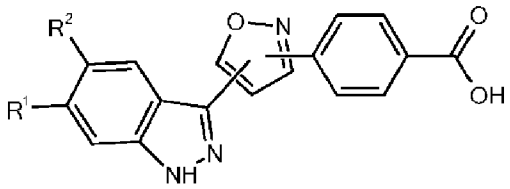
X tarkoittaa fenyleeniä,

Y tarkoittaa CO:ta,

Z tarkoittaa $[C(R^3)_2]_nHet^2$:ta ja

n tarkoittaa lukua 0,

yhdiste, jolla on kaava II



II

jossa R^1:llä ja R^2:lla on patenttivaatimuksessa 1 annetut merkitykset,

saatetaan reagoimaan yhdisteen kanssa, jolla on kaava III

Het^2 III

jossa Het^2:lla on patenttivaatimuksessa 1 annettu merkitys,

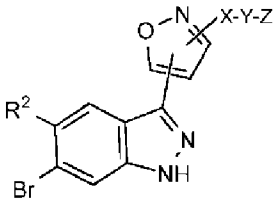
tai

b) valmistettaessa yhdisteitä, joilla on kaava I,

jossa

R^1 tarkoittaa Het^1:tä,

yhdiste, jolla on kaava IV

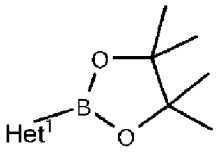


IV

jossa

R^2:lla, X:llä, Y:llä ja Z:lla on patenttivaatimuksessa 1 annetut merkitykset,

saatetaan reagoimaan yhdisteen kanssa, jolla on kaava V

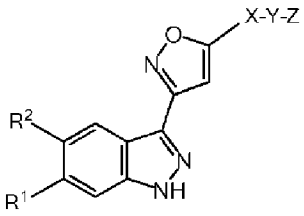


V

jossa Het^1:llä on patenttivaatimuksessa 1 annettu merkitys,

tai

c) valmistettaessa yhdisteitä, joilla on kaava Ia,

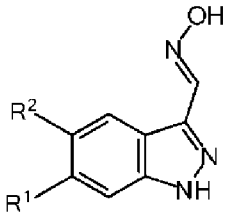


Ia

jossa

R^1:llä, R^2:lla, X:llä, Y:llä ja Z:lla on patenttivaatimuksessa 1 annetut merkitykset,

yhdiste, jolla on kaava VI

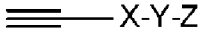


VI

jossa

R^1:llä ja R^2:lla on patenttivaatimuksessa 1 annetut merkitykset,

saatetaan reagoimaan yhdisteen kanssa, jolla on kaava VII



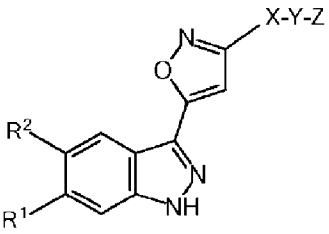
VII

jossa

X:llä, Y:llä ja Z:lla n patenttivaatimuksessa 1 annetut merkitykset,

tai

d) valmistettaessa yhdisteitä, joilla on kaava Ib,

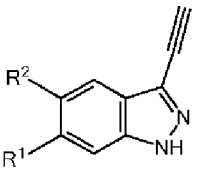


Ib

jossa

R^1:llä, R^2:lla, X:llä, Y:llä ja Z:lla on patenttivaatimuksessa 1 annetut merkitykset,

yhdiste, jolla on kaava VIII

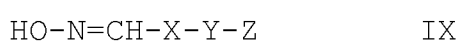


VIII

jossa

R^1:llä ja R^2:lla on patenttivaatimuksessa 1 annetut merkitykset,

saatetaan reagoimaan yhdisteen kanssa, jolla on kaava IX



IX

jossa

X:llä, Y:llä ja Z:lla n patenttivaatimuksessa 1 annetut merkitykset,

ja/tai

kaavan I mukainen emäs tai happo muunnetaan joksikin sen suoloista.

9. Lääkkeet, jotka käsittävät vähintään yhden patenttivaatimuksen 1 mukaisen kaavan I mukaisen yhdisteen ja/tai sen farmaseuttisesti hyväksyttäviä suoloja, solvaatteja, tautomeerejä ja stereoisomeerejä, mukaan lukien niiden seokset kaikissa suhteissa, ja valinnaisesti farmaseuttisesti hyväksyttävän kantaja-aineen, apuaineen tai vehikkelin.

10. Patenttivaatimuksen 1 mukaiset kaavan I mukaiset yhdisteet ja niiden farmaseuttisesti hyväksyttävät suolat, solvaatit, tautomeerit ja stereoisomeerit, mukaan lukien niiden seokset kaikissa suhteissa, käytettäväksi syövän hoitoon ja/tai ennaltaehkäisyyn.

11. Yhdisteet käytettäväksi patenttivaatimuksen 10 mukaisesti syövän hoitoon ja/tai ennaltaehkäisyyn, jossa syöpä on ruuansulatuskanavan stroomakasvain.

12. Lääkkeet, jotka käsittävät vähintään yhden patenttivaatimuksen 1 mukaisen kaavan I mukaisen yhdisteen ja/tai sen farmaseuttisesti hyväksyttäviä suoloja, solvaatteja ja stereoisomeerejä, mukaan lukien niiden seokset kaikissa suhteissa, ja vähintään yhden toisen aktiivisen lääkeainesosan.

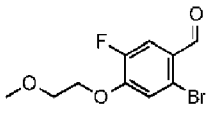
13. Sarja (kitti), joka koostuu seuraavista erillisistä pakkauksista:

(a) tehokas määrä patenttivaatimuksen 1 mukaista kaavan I mukaista yhdistettä ja/tai sen farmaseuttisesti hyväksyttäviä suoloja, solvaatteja, suoloja ja stereoisomeerejä, mukaan lukien niiden seokset kaikissa suhteissa, ja

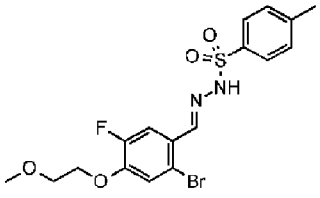
(b) tehokas määrä toista aktiivista lääkeainesosaa.

14. Välituotteet, jotka on valittu seuraavasta ryhmästä:

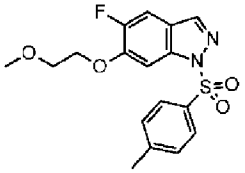
2-bromi-5-fluori-4-(2-metoksietoksi)bentsaldehydi



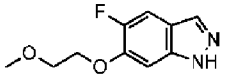
N'-[(1E)-[2-bromi-5-fluori-4-(2-metoksietoksi)fenyyli]metylideeni]-4-metyylibentseeni-1-sulfonohydratsidi



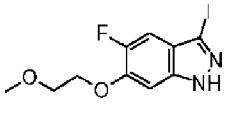
5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1-(4-metyylibentseenisulfonyyli)-1H-indatsoli



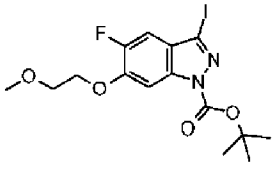
5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli



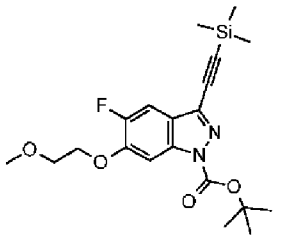
5-fluori-3-jodi-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli



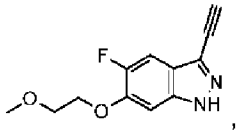
tert-butyyli-5-fluori-3-jodi-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli-1-karboksylaatti



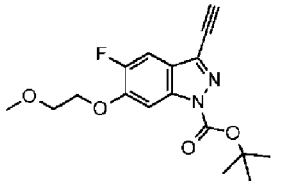
tert-butyyli-5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-3-[2-(trimetyylisilyyli)etynyyli]-1H-indatsoli-1-karboksylaatti



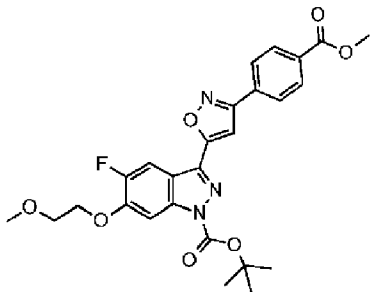
3-etynyyli-5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli



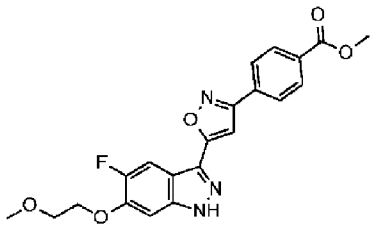
tert-butyyli-3-etynyyli-5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli-1-karboksylaatti



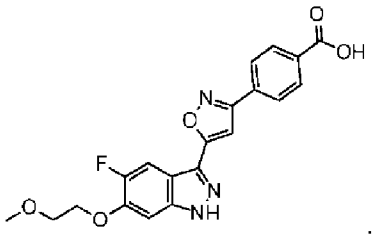
tert-butyyli-5-fluori-3-{3-[4-(metoksikarbonyyli)fenyyli]-1,2-oksatsol-5-yyli}-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsoli-1-karboksylaatti



metyyli-4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoaatti



4-{5-[5-fluori-6-(2-metoksietoksi)-1H-indatsol-3-yyli]-1,2-oksatsol-3-yyli}bentsoehappo


O
OH
N
O
F
N
NH
O
O