



(19) REPUBLIKA HRVATSKA  
DRŽAVNI ZAVOD ZA  
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator  
dokumenta:



HR P20180371 T1

HR P20180371 T1

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

(51) MKP:

**C07D 401/14** (2006.01)  
**C07D 401/04** (2006.01)  
**C07D 491/107** (2006.01)  
**C07D 403/04** (2006.01)  
**C07D 413/14** (2006.01)  
**C07D 413/04** (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 06.04.2018.

(21) Broj predmeta: P20180371T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 01.03.2018.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2014055797  
Datum podnošenja međunarodne prijave: 24.03.2014.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 14712287.3  
Datum podnošenja europske prijave patenta: 24.03.2014.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2014154612  
Datum međunarodne objave: 02.10.2014.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2978755 A1  
Datum objave europske prijave patenta: 03.02.2016.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2978755 B1  
Datum objave europskog patenta: 03.01.2018.

(31) Broj prve prijave: 13161176 (32) Datum podnošenja prve prijave: 26.03.2013. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: EP

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelji:

**F. Hoffmann - La Roche AG, Grenzacherstrasse 124, 4070 Basel, CH**  
**Olivier Gavelle, 74 rue de Hagenheim, 68220 Hagenthal-le-Bas, FR**  
**Uwe Grether, Kirchgasse 4, 79588 Efringen-Kirchen, DE**  
**Atsushi Kimbara, 1-135 Komakado, 412-8513 Gotemba Shizuoka, JP**  
**Matthias Nettekoven, Ruetteweg 3, 79639 Grenzach-Wyhlen, DE**  
**Stephan Roever, Auf der Neusetze 19, 79594 Inzlingen, DE**  
**Mark Rogers-Evans, Rosenweg 6, 4103 Bottmingen, CH**  
**Didier Rombach, 92, rue de Belfort, 68200 Mulhouse, FR**  
**Tanja Schulz-Gasch, Baselweg 7, 4417 Ziefen, CH**  
**CPZ - CENTAR ZA PATENTE d.o.o., 10000 Zagreb, HR**

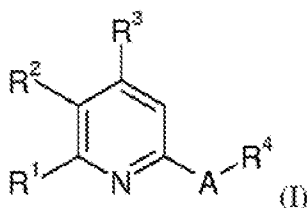
(74) Zastupnik:

(54) Naziv izuma: NOVI DERIVATI PIRIDINA

HR P20180371 T1

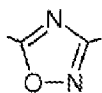
## PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Spoj, **naznačen time, da** ima formulu (I)

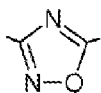


u kojoj

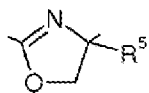
A je A1, A2, A3, A4, A5, A6, A7 ili A8



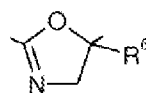
A1



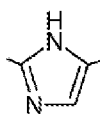
A2



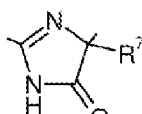
A3



A4



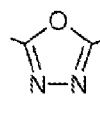
A5



A6



A7



A8

R<sup>1</sup> je vodik ili halogen;

R<sup>2</sup> je halogen, cikloalkil, haloazetidini, 6-oks-1-aza-spiro[3.3]heptil ili alkilsulfonil;

R<sup>3</sup> je -OR<sup>8</sup>, pirolidinil, halopirolidinil, hidroksipirolidinil, morfolinil, cikloalkilsulfonil, alkoksiacetidinil, 2-oks-6-aza-spiro[3.3]heptil ili 2-oks-7-azaspiro[3.4]heptil;

R<sup>4</sup> je vodik, alkil, hidroksialkil, alkoksialkil, haloalkil, cikloalkil, hidroksicikloalkil, alkilcikloalkil, aminokarbonilcikloalkil, fenil, fenilalkil, alkiloksetanil, azetidini ili aminooksetanil;

R<sup>5</sup> je vodik, alkil ili alkiloksadiazolil;

ili R<sup>4</sup> i R<sup>5</sup>, zajedno s ugljikovim atomom s kojim su spojeni tvore cikloalkil;

R<sup>6</sup> je alkil;

R<sup>7</sup> je alkil; i

R<sup>8</sup> je haloalkil, alkoksialkil, cikloalkilalkil, haloalkil, halofenil, oksetanil, oksetanilalkil, alkiloksetanilalkil, tetrahidrofurani, tetrahidrofurani, alkilsulfonilfenil, alkilpirolidinil, alkilpirolidinilalkil, azetidini, morfolinilalkil, tetrahidropirani, pirolidinilalkil, piperidinil, piperidinilalkil, alkilpiperidinilalkil, alkilpiperidinil, dialkilaminoalkil, piridinilalkil, haloalkil, dialkiloksazolilalkil, alkiloksazolilalkil, halopiridinilalkil ili morfolinil;

ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

2. Spoj prema patentnom zahtjevu 1, **naznačen time, da** A je A1 ili A2.
3. Spoj prema patentnom zahtjevu 1 ili 2, **naznačen time, da** R<sup>1</sup> je vodik ili klor.
4. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 3, **naznačen time, da** R<sup>1</sup> je vodik.
5. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 4, **naznačen time, da** R<sup>2</sup> je cikloalkil.
6. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 5, **naznačen time, da** R<sup>2</sup> je ciklopropil.
7. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 6, **naznačen time, da** R<sup>3</sup> je -OR<sup>8</sup>.
8. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 7, **naznačen time, da** R<sup>4</sup> je alkil.
9. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 8, **naznačen time, da** R<sup>4</sup> je butil.
10. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 9, **naznačen time, da** R<sup>5</sup> je vodik, etil ili metiloksadiazolil, ili R<sup>4</sup> i R<sup>5</sup> zajedno s ugljikovim atomom s kojim su spojeni, tvore cikloheksil.
11. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 10, **naznačen time, da** R<sup>6</sup> je metil.
12. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 11, **naznačen time, da** R<sup>7</sup> je metil ili izopropil.
13. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 12, **naznačen time, da** R<sup>8</sup> je haloalkil, alkoksialkil, halofenil, alkiloksetanilalkil, oksetanilalkil, tetrahidrofurani, tetrahidrofurani, tetrahidropirani, halopiridinilalkil ili morfolinil.
14. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 13, **naznačen time, da** R<sup>8</sup> je trifluorometil, etoksietil, metoksibutil, fluorofenil, oksetanilmetil, metiloksetanilmetil, tetrahidrofurani, tetrahidrofurani, tetrahidropirani, difluoroetil, fluoropiridinilmetil ili morfolinil.
15. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 14, **naznačen time, da** je odabran iz skupine koju čine:
  - 5-[5-ciklopropil-4-(ciklopropilmetoksi)piridin-2-il]-3-metil-1,2,4-oksadiazol;
  - 5-[5-ciklopropil-4-(ciklopropilmetoksi)piridin-2-il]-3-fenil-1,2,4-oksadiazol;

3-ciklopropil-5-[5-ciklopropil-4-(ciklopropilmetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 3-ciklopentil-5-[5-ciklopropil-4-(ciklopropilmetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 3-benzil-5-[5-ciklopropil-4-(ciklopropilmetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 3-terc-butil-5-[5-ciklopropil-4-(ciklopropilmetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5 3-ciklopropil-5-[5-ciklopropil-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-[5-ciklopropil-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-3-(trifluorometil)-1,2,4-oksadiazol;  
 5-ciklopropil-3-[5-ciklopropil-4-(ciklopropilmetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(ciklopropilmetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 2-[5-ciklopropil-4-(ciklopropilmetoksi)piridin-2-il]-4,4-dietil-5H-1,3-oksazol;  
 10 3-[5-ciklopropil-4-(ciklopropilmetoksi)piridin-2-il]-5-(metoksimetil)-1,2,4-oksadiazol;  
 3-[5-ciklopropil-4-(ciklopropilmetoksi)piridin-2-il]-5-etil-1,2,4-oksadiazol;  
 3-[5-ciklopropil-4-(ciklopropilmetoksi)piridin-2-il]-5-propan-2-il-1,2,4-oksadiazol;  
 3-ciklopropil-5-[5-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-[5-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-3-metil-1,2,4-oksadiazol;  
 15 3-terc-butil-5-[5-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 [3-[5-ciklopropil-4-(ciklopropilmetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol-5-il]metanol;  
 3-[5-ciklopropil-4-(ciklopropilmetoksi)piridin-2-il]-5-(trifluorometil)-1,2,4-oksadiazol;  
 (4S)-4-terc-butil-2-[5-ciklopropil-4-(ciklopropilmetoksi)piridin-2-il]-4,5-dihidro-1,3-oksazol;  
 2-[5-ciklopropil-4-(ciklopropilmetoksi)piridin-2-il]-4-etil-4,5-dihidro-1,3-oksazol;  
 20 2-[5-ciklopropil-4-(ciklopropilmetoksi)piridin-2-il]-3-oksa-1-azaspiro[4.5]dec-1-en;  
 1-[3-[5-ciklopropil-4-(ciklopropilmetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol-5-il]ciklopropan-1-ol;  
 3-[5-ciklopropil-4-(ciklopropilmetoksi)piridin-2-il]-5-(1-metilciklopropil)-1,2,4-oksadiazol;  
 1-[3-[5-ciklopropil-4-(ciklopropilmetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol-5-il]ciklopropan-1-karboksamid;  
 2-[3-[5-ciklopropil-4-(ciklopropilmetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol-5-il]propan-2-ol;  
 25 2-[5-ciklopropil-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-4,4-dietil-5H-1,3-oksazol;  
 3-[5-ciklopropil-4-(ciklopropilmetoksi)piridin-2-il]-5-(3-metiloksetan-3-il)-1,2,4-oksadiazol;  
 5-(azetidin-3-il)-3-[5-ciklopropil-4-(ciklopropilmetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 2-[5-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-4,4-dietil-5H-1,3-oksazol;  
 2-[5-ciklopropil-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-3-oksa-1-azaspiro[4.5]dec-1-en;  
 30 5-terc-butil-3-[4-(ciklopropilmetoksi)-5-(3,3-difluoroazetidin-1-il)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 3-[5-ciklopropil-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-5-(1-metilciklopropil)-1,2,4-oksadiazol;  
 1-[6-(5-terc-butil-1,2,4-oksadiazol-3-il)-4-(ciklopropilmetoksi)piridin-3-il]-6-oksa-1-azaspiro[3.3]heptan;  
 3-[5-ciklopropil-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-5-propan-2-il-1,2,4-oksadiazol;  
 35 1-[3-[5-ciklopropil-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol-5-il]ciklopropan-1-ol;  
 3-[5-ciklopropil-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-5-(3-metiloksetan-3-il)-1,2,4-oksadiazol;  
 3-[5-ciklopropil-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 3-terc-butil-5-[5-ciklopropil-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 2-[5-ciklopropil-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-5,5-dimetil-4H-1,3-oksazol;  
 40 5-[5-ciklopropil-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-3-propan-2-il-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[4-(ciklopropilmetoksi)-5-metilsulfonilpiridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 3-[5-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-5-propan-2-il-1,2,4-oksadiazol;  
 1-[3-[5-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol-5-il]ciklopropan-1-ol;  
 45 3-[5-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-5-(3-metiloksetan-3-il)-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-[(2S)-1,1,1-trifluoropropan-2-il]oksipiridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-[(2R)-1,1,1-trifluoropropan-2-il]oksipiridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 3-[5-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-5-(1-metilciklopropil)-1,2,4-oksadiazol;  
 3-terc-butil-5-[5-ciklopropil-4-[(2R)-1,1,1-trifluoropropan-2-il]oksipiridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 50 3-terc-butil-5-[5-ciklopropil-4-[(2S)-1,1,1-trifluoropropan-2-il]oksipiridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(oksetan-3-iloksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-[(3-metiloksetan-3-il)metoksi]piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(oksolan-2-ilmetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-[(2S)-1-metilpirolidin-2-il]metoksi]piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 55 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(oksetan-2-ilmetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(1-metilpirolidin-3-il)oksipiridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 3-[3-[5-ciklopropil-4-(ciklopropilmetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol-5-il]oksetan-3-amin;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(4-fluorofenoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(oksolan-3-iloksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 60 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(oksan-4-iloksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 2-(5-terc-butil-1H-imidazol-2-il)-5-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin;  
 5-terc-butil-2-[5-ciklopropil-4-(ciklopropilmetoksi)piridin-2-il]-1,3-oksazol;

- 2-[5-ciklopropil-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-4-metil-4-propan-2-il-1H-imidazol-5-on;  
 5-terc-butil-3-[5-metilsulfonil-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 2-[5-ciklopropil-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-4-etil-4-metil-1H-imidazol-5-on;  
 2-[5-ciklopropil-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-4-metil-4-(2-metilpropil)-1H-imidazol-5-on;  
 2-[5-bromo-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-4-metil-4-propan-2-il-1H-imidazol-5-on;  
 5-terc-butil-3-[5-kloro-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 3-[5-kloro-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-5-ciklopropil-1,2,4-oksadiazol;  
 5-ciklopropil-3-[5-ciklopropil-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 1-[2-(5-terc-butil-1,2,4-oksadiazol-3-il)-5-ciklopropilpiridin-4-il]pirolidin-3-ol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(3,3,4,4-tetrafluoropirolidin-1-il)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(4-metilsulfonilfenoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 7-[2-(5-terc-butil-1,2,4-oksadiazol-3-il)-5-ciklopropilpiridin-4-il]-2-oks-7-azaspiro[3.4]oktan;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(3,3-difluoropirolidin-1-il)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 4-[2-(5-terc-butil-1,2,4-oksadiazol-3-il)-5-ciklopropilpiridin-4-il]morfolin;  
 5-terc-butil-3-(5-ciklopropil-4-pirolidin-1-ilpiridin-2-il)-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-(5-ciklopropil-4-ciklopropilsulfonilpiridin-2-il)-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(3-metoksiazetid-1-il)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 6-[2-(5-terc-butil-1,2,4-oksadiazol-3-il)-5-ciklopropilpiridin-4-il]-2-oks-6-azaspiro[3.3]heptan;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(2-etoksietoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(1-metoksibutan-2-iloksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-[2-[(2-metilpropan-2-il)oksi]etoksi]piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-[1-[(2-metilpropan-2-il)oksi]propan-2-iloksi]piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(1-metoksipropan-2-iloksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(oksan-3-iloksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(3-metoksibutoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(oksetan-3-ilmetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-ciklopropil-3-[5-ciklopropil-4-[(2S)-1,1,1-trifluoropropan-2-il]oksipiridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(1-etilpirolidin-3-il)oksipiridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(1-propan-2-ilpirolidin-3-il)oksipiridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(2-pirolidin-1-iletoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(2-piperidin-1-iletoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(1-piperidin-1-ilpropan-2-iloksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-[(1-metilpiperidin-2-il)metoksi]piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 2-terc-butil-5-[5-ciklopropil-4-(oksan-4-iloksi)piridin-2-il]-1,3,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(1-metilpiperidin-3-il)oksipiridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(1-etilpiperidin-3-il)oksipiridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 2-[2-(5-terc-butil-1,2,4-oksadiazol-3-il)-5-ciklopropilpiridin-4-il]oksi-N,N-dietilpropan-1-amin;  
 3-[2-(5-terc-butil-1,2,4-oksadiazol-3-il)-5-ciklopropilpiridin-4-il]oksimetil]morfolin;  
 4-[2-[2-(5-terc-butil-1,2,4-oksadiazol-3-il)-5-ciklopropilpiridin-4-il]oksietil]morfolin;  
 5-terc-butil-3-(5-ciklopropil-4-piperidin-3-iloksipiridin-2-il)-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-[(3-fluorooksetan-3-il)metoksi]piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-[(2,5-dimetil-1,3-oksazol-4-il)metoksi]piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-[(5-metil-1,2-oksazol-3-il)metoksi]piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(3-metilsulfonilfenoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 3-[2-[5-ciklopropil-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-4-metil-5H-1,3-oksazol-4-il]-5-metil-1,2,4-oksadiazol;  
 2-terc-butil-5-[5-ciklopropil-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-1,3,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[6-kloro-5-ciklopropil-4-(oksan-4-iloksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(2,2-difluoroetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(2-fluoroetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(piridin-2-ilmetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-[(5-fluoropiridin-2-il)metoksi]piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(piridin-3-ilmetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 2-terc-butil-5-[5-ciklopropil-4-[(2S)-1,1,1-trifluoropropan-2-il]oksipiridin-2-il]-1,3,4-oksadiazol;  
 3-terc-butil-5-(5-ciklopropil-4-(tetrahidro-2H-piran-4-iloksi)piridin-2-il)-1,2,4-oksadiazol;  
 3-terc-butil-5-[5-ciklopropil-4-[(2S)-1-metilpirolidin-2-il]metoksi]piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol; i  
 3-terc-butil-5-(5-ciklopropil-4-(2,2-difluoroetoksi)piridin-2-il)-1,2,4-oksadiazol.
16. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 15, **naznačen time, da** je odabran iz skupine koju čine:  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 3-terc-butil-5-[5-ciklopropil-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-[(3-metiloksetan-3-il)metoksi]piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(oksolan-2-ilmetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(4-fluorofenoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;

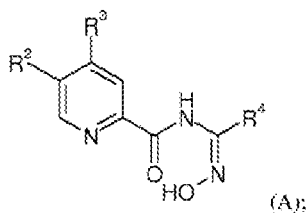
5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(oksolan-3-iloksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(oksan-4-iloksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(2-etoksietoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(3-metoksibutoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-(oksetan-3-ilmetoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-[(5-fluoropiridin-2-il)metoksi]piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 3-terc-butil-5-(5-ciklopropil-4-(tetrahydro-2H-piran-4-iloksi)piridin-2-il)-1,2,4-oksadiazol; i  
 3-terc-butil-5-(5-ciklopropil-4-(2,2-difluoroetoksi)piridin-2-il)-1,2,4-oksadiazol.

17. Spoj, **naznačen time, da** je odabran iz skupine koju čine:

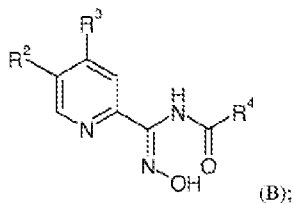
5-terc-butil-3-[5-ciklopropil-4-[(4-fluorofenil)metoksi]piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-(3-fluorooksetan-3-il)-4-(oksan-4-iloksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol;  
 5-terc-butil-3-[5-(3-fluorooksetan-3-il)-4-(4-fluorofenoksi)piridin-2-il]-1,2,4-oksadiazol; i  
 5-terc-butil-3-(6-kloro-5-ciklopropil-4-(4-fluorobenziloksi)piridin-2-il)-1,2,4-oksadiazol.

18. Postupak za proizvodnju spoja formule (I) prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 16, **naznačen time, da** obuhvaća jedan od sljedećih koraka:

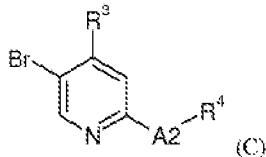
(a) zagrijavanje spoja formule (A)



(b) zagrijavanje spoja formule (B)

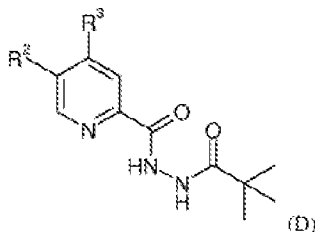


(c) reakciju spoja formule (C)



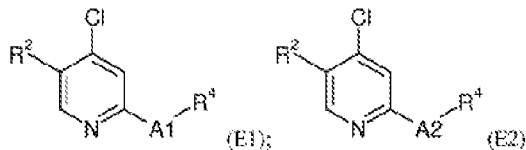
u prisutnosti haloazetidina ili 6-oksa-1-aza-spiro[3.3]heptana, baze i paladijskog katalizatora;

(d) reakciju spoja formule (D)



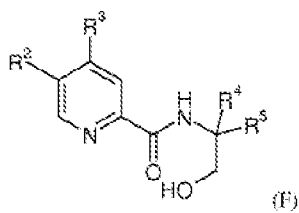
u prisutnosti trifluorometansulfonskog anhidrida i trifenilfosfin-oksida;

(e) reakciju spoja formule (E1) ili (E2)

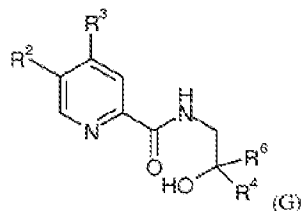


u prisutnosti HOR, haloazetidina, 6-oksa-1-aza-spiro[3.3]heptana ili HSO<sub>2</sub>R i baze;

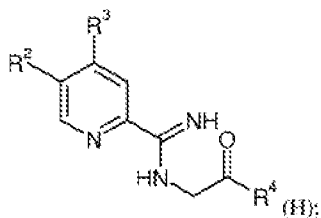
(f) zagrijavanje spoja formule (F)



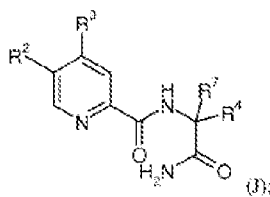
- u prisutnosti Burgessovog reagensa;  
(g) zagrijavanje spoja formule (G)



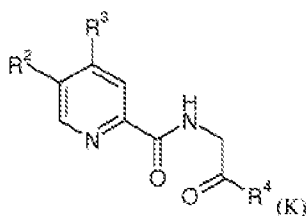
- 5 u prisutnosti metansulfonske kiseline;  
(h) zagrijavanje spoja formule (H)



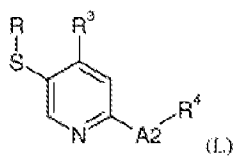
- (j) zagrijavanje spoja formule (J)



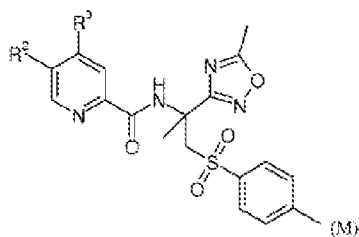
- 10 (k) reakciju spoja formule (K)



- u prisutnosti heksakloroetana, baze i fosfina;  
(l) reakciju spoja formule (L)

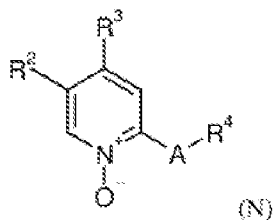


- 15 u prisutnosti oksidacijskog sredstva;  
(m) zagrijavanje spoja formule (M)



- u prisutnosti baze;

(n) reakciju spoja formule (N)



u prisutnosti sredstva za kloriranje i DMF; ili

(o) reakciju spoja formule (C) kao što je gore navedeno u prisutnosti HSR i baze, a zatim i oksidacijskog sredstva;

pri čemu A, A1 i A2 te R<sup>1</sup> do R<sup>4</sup> su isti kao što su definirani u bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 14 i pri čemu R predstavlja alkil.

19. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 17, **naznačen time, da** se upotrebljava kao terapijski djelotvorna tvar.

20. Farmaceutski pripravak, **naznačen time, da** obuhvaća spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 17 i terapijski inertni nosač.

21. Spoj prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 17, **naznačen time, da** se upotrebljava u liječenju ili profilaksi boli, ateroskleroze, staračke makularne degeneracije, dijabetičke retinopatije, glaukoma, okluzije retinalne vene, retinopatije nedonoščadi, okularnog ishemijskog sindroma, geografske atrofije, šećerne bolesti (diabetes mellitus), upale, upalne bolesti crijeva, ishemijskih reperfuzijskih ozljeda, akutnog zatajenja jetre, jetrene fibroze, plućne fibroze, fibroze bubrega, sustavne fibroze, akutnog odbijanja alogenskog presatka, kronične alogenske nefropatije, dijabetičke nefropatije, glomerulonefropatije, kardiomiopatije, zatajenja srca, miokardijalne ishemije, miokardijalnog infarkta, sustavne skleroze, toplinskih ozljeda, opekline, hipertrofičnih ožiljaka, keloida, pireksije gingive, jetrene ciroze ili tumora, u regulaciji koštane mase, amiotrofne lateralne skleroze, multiple skleroze, Alzheimerove bolesti, Parkinsonove bolesti, moždanog udara, prolaznog ishemijskog napadaja ili uveitisa.