



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20201068 T1



HR P20201068 T1

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

(51) MKP:

C07D 413/14 (2006.01)
C07D 413/04 (2006.01)
C07D 417/04 (2006.01)
C07D 417/14 (2006.01)
A61K 31/4439 (2006.01)
A61P 11/00 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 13.11.2020.

(21) Broj predmeta: P20201068T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 07.07.2020.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/IB2017053068
Datum podnošenja međunarodne prijave: 24.05.2017.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 17728272.0
Datum podnošenja europske prijave patenta: 24.05.2017.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2017208115
Datum međunarodne objave: 07.12.2017.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3464282 A1
Datum objave europske prijave patenta: 10.04.2019.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3464282 B1
Datum objave europskog patenta: 22.04.2020.

(31) Broj prve prijave: 201662345315 P (32) Datum podnošenja prve prijave: 03.06.2016. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelji patenta:

(72) Izumitelji:

AbbVie Overseas S.à r.l., 26 Boulevard Royal, 2449 Luxembourg, LU
Galapagos NV, Generaal de Wittelaan L11/A3, 2800 Mechelen, BE
Robert J. Altenbach, 7405 N Oketo, Chicago, IL 60631, US
Andrew Bogdan, 944 Michigan Avenue, Apt. 3W, Evanston, IL 60202, US
Ghjuvanni Petru Diunisu Coti, Galapagos NV, Generaal De Wittelaan
L11A3, 2800 Mechelen, BE
Marlon D. Cowart, 43 Dahlia Lane, Round Lake Beach, IL 60073, US
Stephen N Greszler, 1175 N. Museum Boulevard, Apt 314, Vernon Hills,
IL 60061, US
Hans Kelgtermans, Galapagos NV, Generaal De Wittelaan L11/A3, 2800
Mechelen, BE
Philip R. Kym, 1002 Gracewood Avenue, Libertyville, IL 60048, US
Steven Emiel Van Der Plas, Galapagos NV, Generaal De Wittelaan
L11/A3, 2800 Mechelen, BE
Xueqing Wang, 1742 Larkdale Road, Northbrook, IL 60062, US

(74) Zastupnik:

Mraste & Partneri odvjetničko društvo, 10000 Zagreb, HR

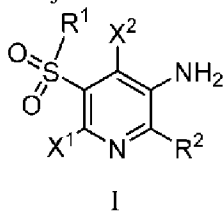
(54) Naziv izuma:

PIRIDINI SUPSTITUIRANI HETEROARILOM I POSTUPCI NJIHOVE UPOTREBE

HR P20201068 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

1. Spoj Formule I, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol



5 naznačen time što

X^1 i X^2 su neovisno birani

H;

halogen;

C_{1-4} alkil, koji može biti supstituiran s jednim ili više neovisno biranih halogena;

10 C_{1-4} alkoksi, koji može biti supstituiran s jednim ili više neovisno biranih

-OH;

C_{1-4} alkoksi; ili

-NR^{8A}R^{8B};

-NR^{9A}R^{9B};

15 ciklopropil, koji može biti supstituiran s jednom ili više neovisno biranih skupina R⁵; fenoksi, koji može biti supstituiran s jednom ili više neovisno biranih skupina R⁵; ili fenil, koji može biti supstituiran s jednom ili više neovisno biranih skupina R⁵;

R¹ je

20 C_{1-4} alkil, koji može biti supstituiran s jednim ili više neovisno biranih

-OH;

C_{1-4} alkoksi; ili

4-6-eročlanih monocikličkih heterocikla koji sadrže 1 ili 2 heteroatoma, koje se neovisno bira iz skupine koju čine O, S i N;

fenil, koji može biti supstituiran s jednim ili više neovisno biranih R⁴ skupine;

25 N-vezani 4-6-eročlani monociklički heterocikl koji sadrži 1, 2 ili 3 heteroatoma, koje se neovisno bira iz skupine koju čine N, O i S, gdje heterocikl može biti supstituiran s jednom ili više neovisno biranih skupina R⁵;

N-vezani 4-6-eročlani monociklički heterocikl koji sadrži 1, 2 ili 3 heteroatoma, koje se neovisno bira iz skupine koju čine N, O i S, kondenziran s fenilom, gdje monociklički heterocikl i fenil mogu biti supstituirani s jednom ili više neovisno biranih skupina R⁵;

30 C_{3-7} cikloalkil, koji može biti supstituiran s jednom ili više neovisno biranih skupina R⁵; ili -NR⁶R⁷;

R² je 5-6-eročlani monociklički heteroaril koji sadrži 1, 2 ili 3 heteroatoma, koje se neovisno bira iz skupine koju čine O, S i N, gdje monociklički heteroaril može biti supstituiran s jednom ili više neovisno biranih skupina R³;

35 svakog R³ se neovisno bira iz skupine koju čine:

C_{1-4} alkil, koji može biti supstituiran s jednim ili više neovisno biranih

C_{3-7} cikloalkila; gdje C_{3-7} cikloalkil može biti supstituiran s jednom ili više neovisno biranih skupina R^A;

4-6-eročlanih monocikličkih heterocikla koji sadrže 1 ili 2 heteroatoma, koje se neovisno bira iz skupine koju čine O, S i N; gdje monociklički heterocikl može biti supstituiran s jednom ili više neovisno biranih skupina R^A;

fenila; gdje fenil može biti supstituiran s jednom ili više neovisno biranih skupina R^A;

40 C_{1-4} alkoksi, koji mogu biti supstituirani s jednim ili više neovisno biranih C_{3-7} cikloalkila, halogena ili -OCH₃;

-OR¹¹;

45 -OH;

halogena;

-CN;

-OC(O)R¹⁰;

-OS(O)₂OH;

50 -NHC(=S)R¹¹; ili

-OP(O)(OH)(OH);

-C(O)NH₂;

fenil; gdje fenil može biti supstituiran s jednom ili više neovisno biranih skupina R^A;

55 5-6-eročlani monociklički heteroaril koji sadrži 1, 2 ili 3 heteroatoma, koje se neovisno bira iz skupine koju čine O, S i N; gdje monociklički heteroaril može biti supstituiran s jednom ili više neovisno biranih skupina R^A;

C_{3-7} cikloalkil; gdje C_{3-7} cikloalkil može biti supstituiran s jednom ili više neovisno biranih skupina R^A ; i 4-6-eročlani monociklički heterocikl koji sadrži 1 ili 2 heteroatoma, koje se neovisno bira iz skupine koju čine O, S i N; gdje monociklički heterocikl može biti supstituiran s jednom ili više neovisno biranih skupina R^A ;

svakog R^4 se neovisno bira iz skupine koju čine:

halogen;

C_{1-4} alkil, koji može biti supstituiran s jednim ili više neovisno biranih halogena; i

C_{1-4} alkoksi, koji može biti supstituiran s jednim ili više neovisno biranih halogena;

svakog R^5 se neovisno bira iz skupine koju čine:

-OH;

halogen;

C_{1-4} alkil, koji može biti supstituiran s jednim ili više neovisno biranih C_{1-4} alkoksi, halogena ili -OH; i

C_{1-4} alkoksi, koji može biti supstituiran s jednim ili više neovisno biranih halogena;

R^6 je H, C_{1-4} alkil ili C_{3-7} cikloalkil, gdje C_{3-7} cikloalkil može biti supstituiran s jednom ili više neovisno biranih skupina R^5 ;

R^7 je

C_{1-4} alkil, koji može biti supstituiran s jednim ili više neovisno biranih

halogena;

fenila, koji mogu biti supstituirani s jednim ili više neovisno biranih

halogena;

C_{1-4} alkila, koji mogu biti supstituirani s jednim ili više neovisno biranih halogena; ili

C_{1-4} alkoksi, koji mogu biti supstituirani s jednim ili više neovisno biranih halogena; ili

C_{1-4} alkoksi, koji mogu biti supstituirani s jednim ili više neovisno biranih halogena; ili

4-6-eročlanih monocikličkih heterocikla koji sadrže 1 ili 2 heteroatoma, koje se neovisno bira iz skupine koju čine O, S i N; gdje monociklički heterocikl može biti supstituiran s jednom ili više neovisno biranih skupina R^5 ;

svakog R^{8a} i R^{8b} se neovisno bira iz skupine koju čine

H; i

C_{1-4} alkil;

R^{9a} i R^{9b} se neovisno bira iz skupine koju čine

H;

C_{1-4} alkil; i

C_{3-7} cikloalkil; i

svakog R^{10} se neovisno bira iz skupine koju čine

C_{1-6} alkil; i

fenil; gdje fenil može biti supstituiran s jednom ili više neovisno biranih skupina R^A ;

svakog R^{11} se neovisno bira iz skupine koju čine

4-6-eročlani monociklički heterocikl koji sadrži 1 ili 2 heteroatoma, koje se neovisno bira iz skupine koju čine O, S i N; gdje monociklički heterocikl može biti supstituiran s jednom ili više neovisno biranih skupina R^A ;

5-6-eročlani monociklički heteroaril koji sadrži 1, 2 ili 3 heteroatoma, koje se neovisno bira iz skupine koju čine O, S i N; gdje monociklički heteroaril može biti supstituiran s jednom ili više neovisno biranih skupina R^A ;

C_{3-7} cikloalkil; gdje C_{3-7} cikloalkil može biti supstituiran s jednom ili više neovisno biranih skupina R^A ; i

fenil; gdje fenil može biti supstituiran s jednom ili više neovisno biranih skupina R^A ; i

svakog R^A se neovisno bira iz skupine koju čine

-CN,

halogen;

C_{1-4} alkil, koji može biti supstituiran s jednim ili više neovisno biranih halogena; i

C_{1-4} alkoksi, koji može biti supstituiran s jednim ili više neovisno biranih halogena.

2. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, **naznačen time** što je R^1 fenil, koji može biti supstituiran s jednom neovisno biranom skupinom R^4 .

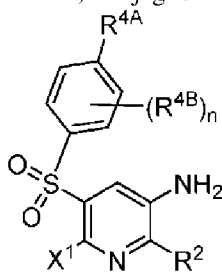
3. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, **naznačen time** što je R^1 fenil supstituiran s jednim -OCF₃.

4. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, **naznačen time** što je svaki od X^1 i X^2 H.

5. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, **naznačen time** što je R^2 5-6-eročlani monociklički heteroaril koji sadrži 1, 2 ili 3 heteroatoma, koje se neovisno bira iz skupine koju čine O, S i N, gdje monociklički heteroaril može biti supstituiran s jednom skupinom R^3 .

6. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, **naznačen time** što je R^2 1,3,4-oksadiazolil, 1,2,4-oksadiazolil, 1,3,4-tiadiazolil ili tiazolil, gdje su 1,3,4-oksadiazolil, 1,2,4-oksadiazolil, 1,3,4-tiadiazolil, te tiazolil supstituirani s jednim neovisno biranim R^3 .

7. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 5, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, **naznačen time** što je R^3 C_{1-4} alkil, koji može biti supstituiran s jednim ili više neovisno biranih
 -OH;
 halogena; ili
 -OP(O)(OH)(OH).
8. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 6, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, **naznačen time** što je R^3 C_{1-4} alkil, koji može biti supstituiran s jednim ili više neovisno biranih
 -OH;
 halogena; ili
 -OP(O)(OH)(OH).
9. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1 Formule I-a, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol



I-a

naznačen time što

- n je 0, 1 ili 2;
 R^{4A} je H, F, $-CH_3$, $-CH(CH_3)_2$, t -Bu, CF_3 , $-OCH_3$, $-OCH(CH_3)_2$ ili $-OCF_3$;
 svaki R^{4B} je neovisno F ili $-OCF_3$; i
 X^1 i R^2 su kao što je iznijeto u patentnom zahtjevu 1.
10. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 9, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, **naznačen time** što je X^1 H.
11. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 9, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, **naznačen time** što
 n je 0; i
 R^{4A} je $-OCF_3$.
12. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 9, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, **naznačen time** što
 X^1 je H;
 n je 0;
 R^{4A} je $-OCF_3$;
 R^2 je 1,3,4-oksadiazolil ili tiazolil supstituiran s jednim R^3 ; i
 R^3 je C_{1-4} alkil, koji može biti supstituiran s jednim ili više neovisno biranih
 -OH;
 halogena; ili
 -OP(O)(OH)(OH).
13. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, **naznačen time** što se spoj bira iz skupine koju čine:
 (5-{3-amino-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-2-il}-1,3,4-oksadiazol-2-il)metanol;
 (5-{3-amino-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-2-il}-1,3,4-oksadiazol-2-il)metil-dihidrogenfosfat;
 2-(5-{3-amino-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-2-il}-1,3,4-oksadiazol-2-il)-1,1,1-trifluorpropan-2-ol;
 1-(5-{3-amino-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-2-il}-1,3,4-oksadiazol-2-il)-2,2,2-trifluoretan-1-ol;
 (2-{3-amino-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-2-il}-1,3-tiazol-5-il)metanol;
 2-(1,3,4-oksadiazol-2-il)-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;
 (5-{3-amino-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-2-il}-1,3,4-oksadiazol-2-il)metanol;
 5-{3-amino-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-2-il}-1,3,4-oksadiazol-2-karboksamid;
 {5-[3-amino-5-(4-fluorbenzen-1-sulfonyl)piridin-2-il]-1,3,4-oksadiazol-2-il}metanol;
 2-(5-cikloheksil-1,3,4-oksadiazol-2-il)-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;
 2-{5-[(S)-metoksi(fenil)metil]-1,3,4-oksadiazol-2-il}-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;
 2-{5-[(ciklopropilmetoksi)metil]-1,3,4-oksadiazol-2-il}-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;
 2-[5-(fenoksimetil)-1,3,4-oksadiazol-2-il]-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;
 2-{5-[(ciklopentiloksi)metil]-1,3,4-oksadiazol-2-il}-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;
 5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]-2-{5-[(trifluormetoksi)metil]-1,3,4-oksadiazol-2-il}piridin-3-amin;
 2-(5-{[(oksolan-3-il)oksi]metil}-1,3,4-oksadiazol-2-il)-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;
 2-{5-[(2-metoksietoksi)metil]-1,3,4-tiadiazol-2-il}-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

N-[(5-{3-amino-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-2-il}-1,3,4-tiadiazol-2-il)metil]ciklopropankarbotioamid;

2-{5-[(*S*)-metoksi(fenil)metil]-1,3,4-tiadiazol-2-il}-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

(2*S*)-2-(5-{3-amino-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-2-il}-1,3,4-tiadiazol-2-il)-1,1,1-trifluorpropan-2-ol;

2-{5-[(1*R*)-1-metoksietil]-1,3,4-tiadiazol-2-il}-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

2-[5-(1-metoksietil)-1,3,4-tiadiazol-2-il]-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

2-{5-[(1*S*)-1-metoksietil]-1,3,4-tiadiazol-2-il}-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

2-{5-[(ciklopropilmetoksi)metil]-1,3,4-tiadiazol-2-il}-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

2-[5-(etoksimetil)-1,3,4-tiadiazol-2-il]-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

2-[5-(metoksimetil)-1,3,4-tiadiazol-2-il]-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

2-(5-{[(piridin-3-il)oksi]metil}-1,3,4-tiadiazol-2-il)-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]-2-{5-[(trifluormetoksi)metil]-1,3,4-tiadiazol-2-il}piridin-3-amin;

2-(5-{[(oksolan-2-il)oksi]metil}-1,3,4-tiadiazol-2-il)-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

2-{5-[(difluormetoksi)metil]-1,3,4-tiadiazol-2-il}-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

2-(5-{[(2*S*)-oksolan-2-il]metil}-1,3,4-tiadiazol-2-il)-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

2-(5-{[(2*R*)-oksolan-2-il]metil}-1,3,4-tiadiazol-2-il)-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

2-{5-[(2-metoksietoksi)metil]-1,3,4-oksadiazol-2-il}-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

2-{5-[(1*R*)-1-metoksietil]-1,3,4-oksadiazol-2-il}-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

2-{5-[(1*S*)-1-metoksietil]-1,3,4-oksadiazol-2-il}-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

2-[5-(etoksimetil)-1,3,4-oksadiazol-2-il]-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

2-[5-(metoksimetil)-1,3,4-oksadiazol-2-il]-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

2-(5-{[(piridin-3-il)oksi]metil}-1,3,4-oksadiazol-2-il)-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

2-{5-[(difluormetoksi)metil]-1,3,4-oksadiazol-2-il}-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

2-(5-{[(2*S*)-oksolan-2-il]metil}-1,3,4-oksadiazol-2-il)-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

2-(5-{[(2*R*)-oksolan-2-il]metil}-1,3,4-oksadiazol-2-il)-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

1-(5-{3-amino-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-2-il}-1,3,4-oksadiazol-2-il)etan-1-ol;

2-(5-{3-amino-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-2-il}-1,3,4-oksadiazol-2-il)propan-2-ol;

(1*S*)-1-(5-{3-amino-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-2-il}-1,3,4-oksadiazol-2-il)-2-feniletan-1-ol;

(*S*)-(5-{3-amino-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-2-il}-1,3,4-oksadiazol-2-il)(fenil)metanol;

2-[3-(2-metoksipropan-2-il)-1,2,4-oksadiazol-5-il]-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

2-[3-(1-metoksietil)-1,2,4-oksadiazol-5-il]-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

2-[3-(oksolan-4-il)-1,2,4-oksadiazol-5-il]-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

2-{3-[(4-fluorfenoksi)metil]-1,2,4-oksadiazol-5-il}-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

2-[3-(ciklopropilmetil)-1,2,4-oksadiazol-5-il]-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

2-{3-[(oksolan-2-il)metil]-1,2,4-oksadiazol-5-il}-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

2-(3-ciklopropil-1,2,4-oksadiazol-5-il)-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

2-[3-(oksolan-3-il)-1,2,4-oksadiazol-5-il]-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

2-(3-*tert*-butil-1,2,4-oksadiazol-5-il)-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

2-[3-(2-metoksietil)-1,2,4-oksadiazol-5-il]-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

2-[3-(metoksimetil)-1,2,4-oksadiazol-5-il]-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-3-amin;

(5-{3-amino-4-klor-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-2-il}-1,3,4-oksadiazol-2-il)metanol;

(5-{3-amino-5-[3-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-2-il}-1,3,4-oksadiazol-2-il)metanol;

(5-{3-amino-5-[2-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-2-il}-1,3,4-oksadiazol-2-il)metanol;

5-amino-*N*-benzil-6-[5-(hidroksimetil)-1,3,4-oksadiazol-2-il]-*N*-metilpiridin-3-sulfonamid;

{5-[3-amino-5-(benzensulfonyl)piridin-2-il]-1,3,4-oksadiazol-2-il}metanol;

(5-{3-amino-5-[4-(trifluormetil)benzen-1-sulfonyl]piridin-2-il}-1,3,4-tiadiazol-2-il)metanol;

(5-{3-amino-6-brom-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-2-il}-1,3,4-oksadiazol-2-il)metanol;

(5-{3-amino-6-klor-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-2-il}-1,3,4-oksadiazol-2-il)metanol;

(5-{3-amino-5-[2-(propan-2-il)benzen-1-sulfonyl]piridin-2-il}-1,3,4-oksadiazol-2-il)metanol;

(5-{3-amino-4-brom-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-2-il}-1,3,4-oksadiazol-2-il)metanol; i

2-(5-{3-amino-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-2-il}-1,2,4-oksadiazol-3-il)etan-1-ol.

14. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 13, **naznačen time** što je (5-{3-amino-5-[4-(trifluormetoksi)benzen-1-sulfonyl]piridin-2-il}-1,3,4-oksadiazol-2-il)metanol, ili njegova farmaceutske prihvratljiva sol.

15. Farmaceutski pripravak, **naznačen time** što sadrži terapijski djelotvornu količinu spoja u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 14, ili njegove farmaceutske prihvratljive soli, u kombinaciji s farmaceutske prihvratljivim nosačem.

16. Spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 14, ili njegova farmaceutske prihvratljiva sol, ili farmaceutske pripravak u skladu s patentnim zahtjevom 15, **naznačeni time** što su namijenjeni upotrebi u medicini.

- 5
17. Spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 14, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, ili farmaceutske pripravak u skladu s patentnim zahtjevom 15, **naznačeni time** što su namijenjeni upotrebi u liječenju cistične fibroze.
 18. Farmaceutski pripravak, **naznačeni time** što sadrži spoj u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 14, ili njegovu farmaceutske prihvatljivu sol, kao i jedan ili više korigensa, ili jedno ili više dodatnih terapijskih sredstava.
 19. Farmaceutski pripravak u skladu s patentnim zahtjevom 18, **naznačeni time** što se dodatna terapijska sredstva bira iz skupine koju čine modulatori CFTR i amplifikatori CFTR, po mogućnosti modulatori CFTR.