



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20100326 T1

HR P20100326 T1

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

(51) MKP:

A61K 31/422 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 31.10.2010.

(21) Broj predmeta: P20100326T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 07.06.2010.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/IB2004003698
Datum podnošenja međunarodne prijave: 22.10.2004.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 04791783.6
Datum podnošenja europske prijave patenta: 22.10.2004.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2005040139
Datum međunarodne objave: 06.05.2005.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 1684750 A2
Datum objave europske prijave patenta: 02.08.2006.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 1684750 B1
Datum objave europskog patenta: 28.04.2010.

(31) Broj prve prijave: 513214 P

(32) Datum podnošenja prve prijave: 23.10.2003.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelj patenta:

AB Science, 3, avenue George V, 75008 Paris, FR
CENTRE NATIONAL DE LA RECHERCHE SCIENTIFIQUE (CNRS), 3, rue
Michel Ange, 75016 Paris, FR
Institut Curie, 26, rue d'Ulm, 75005 Paris, FR

(72) Izumitelji:

Alain Moussy, 22 bis, passage Dauphine, 75006 Paris, FR
Camille Wermuth, 3, rue de la Côte d'Azur, 67100 Strasbourg, FR
David Grierson, 32, rue de la Bonne Aventure, 78000 Versailles, FR
Abdellah Benjahad, 55-57, rue Diderot - Entrée 8, 94500 Champigny-Sur-
Marne, FR

(74) Zastupnik:

Martine Croisy, 12, route de Limours, 78720 Cernay La Ville, FR
Marco Ciufolini, 16, rue de Créqui, 69006 Lyon, FR
Bruno Giethlen, 39, Domaine de l'Ile, 67400 Illkirch, FR
Hraste & Partneri odvjetničko društvo, 10000 Zagreb, HR

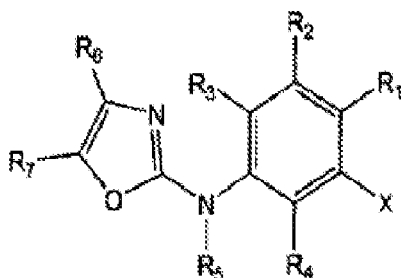
(54) Naziv izuma:

2-AMINOARILOKSAZOLNI SPOJEVI KAO INHIBITORI TIROZINSKE KINAZE

HR P20100326 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Spoj formule I



FORMULA I

naznačen time da se supstituenti od R_1 do R_7 i X definiraju na sljedeći način:

R_1 , R_2 , R_3 i R_4 svaki su neovisno odabrani između atoma vodika, atoma halogena (odabran između F, Cl, Br ili I), linearne alkilne grupe ili razgranate alkilne grupe koja sadrži od 1 do 10 atoma ugljika i fakultativno je zamijenjena jednim ili više heteroatoma poput atoma halogena (odabran između F, Cl, Br ili I), atoma kisika ili atoma dušika, koji je fakultativno u obliku odgovarajuće osnovne azidne funkcije; kao i trifluorometil, alkiloksi C_1-C_6 , amino, (alkil C_1-C_6)amino, di(alkil C_1-C_6)amino, karboksil, cijano, nitro, formil, hidroksi i CO-R, COO-R, CONH-R, SO_2 -R i SO_2NH -R grupe, gdje je R linearna alkilna grupa ili razgranata alkilna grupa koja sadrži od 1 do 10 atoma ugljika i fakultativno je zamijenjena najmanje jednim heteroatomom, posebno atomom halogena (odabran između F, Cl, Br ili I), atomom kisika i atomom dušika, koji je fakultativno u obliku odgovarajuće osnovne azidne funkcije; R_5 je iz jedne od sljedećih grupa:

- (i) atom vodika, ili
- (ii) linearna alkilna grupa ili razgranata alkilna grupa koja sadrži od 1 do 10 atoma ugljika i fakultativno je zamijenjena jednim ili više heteroatoma poput atoma halogena (odabran između F, Cl, Br ili I), atoma kisika ili atoma dušika, koji je fakultativno u obliku odgovarajuće osnovne azidne funkcije, ili
- (iii) CO- R_8 ili COO- R_8 ili CONH- R_8 ili SO_2R_8 gdje R_8 može biti
 - linearna alkilna grupa ili razgranata alkilna grupa koja sadrži od 1 do 10 atoma ugljika i fakultativno je zamijenjena jednim ili više heteroatoma poput atoma halogena (odabran između F, Cl, Br ili I), atoma kisika ili atoma dušika, koji je fakultativno u obliku odgovarajuće osnovne azidne funkcije, ili
 - arilna grupa poput fenil grupe ili njene zamjenske varijante koja sadrži bilo koju kombinaciju, na bilo kojem položaju ciklusa, jednog ili više supstituenata poput atoma halogena (odabranog među F, Cl, Br ili I), linearne alkilne grupe ili razgranate alkilne grupe koja sadrži od 1 do 10 atoma ugljika i fakultativno je zamijenjena jednim ili više heteroatoma poput atoma halogena (odabran između F, Cl, Br ili I), atoma kisika ili atoma dušika, koji je fakultativno u obliku odgovarajuće osnovne azidne funkcije; kao i trifluorometil, alkiloksi C_1-C_6 , amino, (alkil C_1-C_6)amino, di(alkil C_1-C_6)amino i amino grupa, od kojih su potonji azidni substituenti fakultativno u obliku odgovarajuće osnovne azidne funkcije; kao i CO-R, COO-R, CONH-R, SO_2 -R i SO_2NH -R grupe, gdje je R linearna alkilna grupa ili razgranata alkilna grupa koja sadrži od 1 do 10 atoma ugljika i fakultativno je zamijenjena s najmanje jednim heteroatomom, posebno atomom halogena (odabran između F, Cl, Br ili I), atomom kisika i atomom dušika, koji je fakultativno u obliku odgovarajuće osnovne azidne funkcije, ili
 - heteroaril grupa poput piridil, pirimidinil, pirazinil, piridazinil, tienil, tijazol, imidazolil, pirazol, pirolil, furanil, oksazolil, izoksazolil, triazolil, tetrazolil, indolil, benzimidazol ili kinolinil grupa koja može između ostalog nositi bilo koju kombinaciju na bilo kojem položaju ciklusa, jednog ili više supstituenata poput atoma halogena (odabran između F, Cl, Br ili I), linearne alkilne grupe ili razgranate alkilne grupe koja sadrži od 1 do 10 atoma ugljika i fakultativno je zamijenjena jednim ili više heteroatoma poput atoma halogena (odabran između F, Cl, Br ili I), atoma kisika ili atoma dušika, koji je fakultativno u obliku odgovarajuće osnovne azidne funkcije; kao i trifluorometil, alkiloksi C_1-C_6 , amino, (alkil C_1-C_6)amino, di(alkil C_1-C_6)amino i amino grupe, koje su azidni supstituenti fakultativno u obliku odgovarajuće osnovne azidne funkcije; kao i CO-R, COO-R, CONH-R, SO_2 -R i SO_2NH -R grupa, gdje je R linearna alkilna grupa ili razgranata alkilna grupa koja sadrži od 1 do 10 atoma ugljika i fakultativno je zamijenjena najmanje jednim heteroatomom, posebno atomom halogena (odabran između F, Cl, Br ili I), atomom kisika i atomom dušika, koji je fakultativno u obliku odgovarajuće osnovne azidne funkcije;

R₆ je odabran između:

- (i) atoma vodika, atoma halogena (odabran između F, Cl, Br ili I), ili
- 5 (ii) alkilne¹ grupe koja je definirana kao linearna cikloalkil grupa ili razgranata cikloalkil grupa koja sadrži od 1 do 10 atoma ugljika i fakultativno je zamijenjena jednim ili više heteroatoma poput atoma halogena (odabran između F, Cl, Br ili I), atoma kisika ili atoma dušika (koji je fakultativno u obliku odgovarajuće osnovne azidne funkcije); kao i trifluorometil, karboksil, cijano, nitro, formil grupe; kao i CO-R, COO-R, CONH-R, SO₂-R i SO₂NH-R grupe, gdje je R linearna alkilna grupa ili razgranata alkilna grupa koja sadrži od 1 do 10 atoma ugljika i fakultativno je zamijenjena najmanje jednim heteroatomom, posebno atomom halogena (odabran između F, Cl, Br ili I), atomom kisika i atomom dušika, koji je fakultativno u obliku odgovarajuće osnovne azidne funkcije; kao i cikloalkil ili aril ili heteroaril grupa fakultativno zamijenjena odgovarajućom osnovnom azidnom funkcijom, ili
- 10 (iii) aril¹ grupa definirana kao fenil grupa ili njena zamjenska varijanta koja nosi bilo koju kombinaciju na bilo kojem položaju ciklusa, jednog ili više supstituenata poput:
- 15 – atoma halogena (odabran između F, Cl, Br ili I);
- alkil¹ grupe;
- cikloalkil, aril ili heteroaril grupe fakultativno zamijenjene odgovarajućom osnovnom azidnom funkcijom;
- 20 – trifluorometil, O-alkil¹, karboksil, cijano, nitro, formil, hidroksi, NH-alkil¹, N(alkil¹)(alkil¹) i amino grupe, od kojih su potonji azidni supstituenti fakultativno u obliku odgovarajuće osnovne azidne funkcije;
- NHCO-R ili NHCOO-R ili NHCONH-R ili NHSO₂-R ili NHSO₂NH-R ili CO-R ili COO-R ili CONH-R ili SO₂-R ili SO₂NH-R grupe gdje R odgovara atomu vodika, alkil¹, aril ili heteroaril grupi; ili
- 25 (iv) **heteroaril**¹ grupa definirana kao piridil, pirimidinil, pirazinil, piridazinil, tienil, tijazol, imidazolil, pirazol, pirolil, furanil, oksazolil, izoksazolil, triazolil, tetrazolil, indolil, benzimidazol ili kinolinil grupa koja može između ostalog nositi bilo koju kombinaciju na bilo kojem položaju ciklusa, jednog ili više supstituenata poput:
- atoma halogena (odabran između F, Cl, Br ili I);
- 30 – alkil¹ grupe;
- cikloalkil, aril ili heteroaril grupe fakultativno zamijenjene odgovarajućom osnovnom azidnom funkcijom;
- trifluorometil, O-alkil¹, karboksil, cijano, nitro, formil, hidroksi, NH-alkil¹, N(alkil¹)(alkil¹) i amino grupa, od kojih su potonji azidni substituenti koji su fakultativno u obliku odgovarajuće osnovne azidne funkcije;
- NHCO-R ili NHCOO-R ili NHCONH-R ili NHSO₂-R ili NHSO₂NH-R ili CO-R ili COO-R ili CONH-R ili SO₂-R ili SO₂NH-R grupe gdje R odgovara atomu vodika ili alkil¹ grupi, ili
- 35 (v) O-aril¹ ili NH-aril¹ ili O-heteroaril¹ ili NH-heteroaril¹ grupe,
- (vi) trifluorometil, O-alkil¹, karboksil, cijano, nitro, formil, hidroksi, NH-alkil¹, N(alkil¹)(alkil¹) i amino grupe, od kojih su potonji azidni supstituenti fakultativno u obliku odgovarajuće osnovne azidne funkcije, ili
- 40 (vii) NHCO-R ili NHCOO-R ili NHCONH-R ili NHSO₂-R ili NHSO₂NH-R ili CO-R ili COO-R ili CONH-R ili SO₂-R ili SO₂NH-R grupe gdje R odgovara atomu vodika, alkil¹, aril ili heteroaril grupi;

R₇ je odabran između:

- 45 (i) atoma vodika, atoma halogena (odabran između F, Cl, Br ili I), ili
- (ii) **alkil**¹ grupe koja je definirana kao linearna cikloalkil grupa ili razgranata cikloalkil grupa koja sadrži od 1 do 10 atoma ugljika i fakultativno je zamijenjena jednim ili više heteroatoma poput atoma halogena (odabran između F, Cl, Br ili I), atoma kisika ili atoma dušika (koji je fakultativno u obliku odgovarajuće osnovne azidne funkcije); kao i trifluorometil, karboksil, cijano, nitro, formil grupe; kao i CO-R, COO-R, CONH-R, SO₂-R i SO₂NH-R, grupe gdje je R linearna alkilna grupa ili razgranata alkilna grupa koja sadrži od 1 do 10 atoma ugljika i fakultativno zamijenjena najmanje jednim heteroatomom, posebno atomom halogena (odabran između F, Cl, Br ili I), atomom kisika i atomom dušika, koji je fakultativno u obliku odgovarajuće osnovne azidne funkcije; kao i cikloalkil ili aril ili heteroaril grupe fakultativno zamijenjene odgovarajućom osnovnom azidnom funkcijom, ili
- 50 (iii) **aril** grupe definirane kao fenil grupa ili njena zamjenska varijanta koja nosi bilo koju kombinaciju na bilo kojem položaju ciklusa, jednog ili više supstituenata poput:
- 55 – atoma halogena (odabran između F, Cl, Br ili I);
- **alkil**^{1bis} grupe koja je alkil grupa definirana kao linearna cikloalkil grupa ili razgranata cikloalkil grupa koja sadrži od 1 do 10 atoma ugljika i fakultativno je zamijenjena jednim heteroatomom poput atoma halogena (odabran između F, Cl, Br ili I), atoma kisika ili atoma dušika;
- 60

- cikloalkil, aril ili heteroaril grupe fakultativno zamijenjene odgovarajućom osnovnom azidnom funkcijom;
- trifluorometil, O-alkil¹, karboksil, cijano, nitro, formil, hidroksi, NH-alkil¹, N(alkil¹)(alkil¹) i amino grupe, od kojih je potonji azidni supstituent fakultativno u obliku odgovarajuće osnovne azidne funkcije;
- NHCO-R ili NHCOO-R ili NHCONH-R ili NHSO₂-R ili NHSO₂NH-R ili CO-R ili COO-R ili CONH-R ili SO₂-R ili SO₂NH-R grupe gdje R odgovara atomu vodika, alkil¹, aril ili heteroaril grupi; ili

(iv) **heteroaril¹** grupe definirane kao piridil, pirimidinil, pirazinil, piridazinil, tienil, tijazol, imidazolil, pirazol, pirolil, furanil, oksazolil, izoksazolil, triazolil, tetrazolil, indolil, benzimidazol ili kinolinil grupa koja može između ostalog nositi bilo koju kombinaciju na bilo kojem položaju u prstenu, jednog ili više supstituenata poput:

- atoma halogena (odabran između F, Cl, Br ili I);
- alkil¹ grupe;
- cikloalkil, aril ili heteroaril grupe fakultativno zamijenjene odgovarajućom osnovnom azidnom funkcijom;
- trifluorometil, O-alkil¹, karboksil, cijano, nitro, formil, hidroksi, NH-alkil¹, N(alkil¹)(alkil¹) i amino grupe, od kojih je potonji azidni supstituent fakultativno u obliku odgovarajuće osnovne azidne funkcije;
- NHCO-R ili NHCOO-R ili NHCONH-R ili NHSO₂-R ili NHSO₂NH-R ili CO-R ili COO-R ili CONH-R ili SO₂-R ili SO₂NH-R grupe gdje R odgovara atomu vodika ili alkil¹ grupi, ili

(v) O-aril¹ ili NH-aril¹ ili O-heteroaril¹ ili NH-heteroaril¹ grupe,

(vi) trifluorometil, O-alkil¹, karboksil, cijano, nitro, formil, hidroksi, NH-alkil¹, N(alkil¹)(alkil¹) i amino grupe, od kojih je potonji azidni supstituent fakultativno u obliku odgovarajuće osnovne azidne funkcije, ili

(vii) NHCO-R ili NHCOO-R ili NHCONH-R ili NHSO₂-R ili NHSO₂NH-R ili CO-R ili COO-R ili CONH-R ili SO₂-R ili SO₂NH-R grupe gdje R odgovara atomu vodika, alkil¹, aril ili heteroaril grupi;

X je:

- NR₉R₁₀ gdje su R₉ i/ili R₁₀ atom vodika ili

(i) alkil¹ grupa, CF₃ ili

(ii) aril¹, heteroaril ili cikloalkil grupa fakultativno zamijenjena odgovarajućom osnovnom azidnom funkcijom; ili

(iii) CO-R, COO-R, CON-RR' ili SO₂-R grupe gdje su R i R' atom vodika, alkil¹, aril¹ ili heteroaril¹ grupa, fakultativno zamijenjena odgovarajućom osnovnom azidnom funkcijom; ili

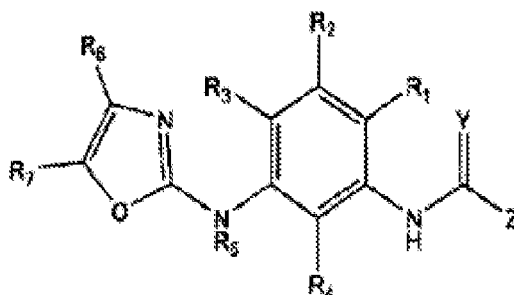
- CO-NR₉R₁₀ gdje su R₉ i/ili R₁₀ atom vodika ili

(i) alkil¹ grupa, CF₃ ili

(ii) heteroaril¹ ili cikloalkil grupa fakultativno zamijenjena odgovarajućom osnovnom azidnom funkcijom.

2. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time** da je X NR₉R₁₀, R₉ je H a R₁₀ je alkil¹ grupa.

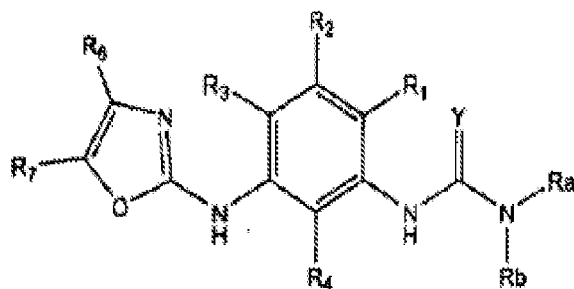
3. Spoj prema zahtjevu 1 formule 1:



FORMULA II

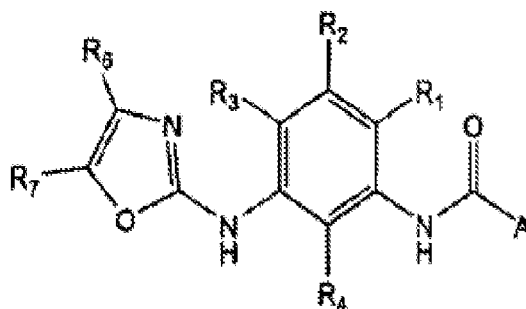
naznačen time da je Y odabran između O a Z odgovara H, NRaRb, alkil¹, aril¹, O-alkil¹ ili O-aril¹ grupi gdje su Ra i Rb neovisno odabrani između H ili alkil¹ ili aril¹ ili heteroaril¹ grupe, koja je fakultativno zamijenjena odgovarajućom osnovnom azidnom funkcijom i u kojoj R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆ i R₇ imaju značenje definirano u zahtjevu 1.

4. Spoj prema zahtjevu 3 formule II-1:



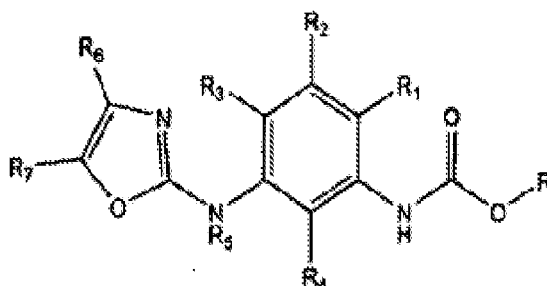
FORMULA II-1

- 5 **naznačen time** da je $R_5=H$, $Y=O$ ili S , a R_a i R_b su neovisno odabrani između H ili alkil¹ ili aril¹ ili heteroaril¹ grupe, koja je fakultativno zamijenjena odgovarajućom osnovnom azidnom funkcijom i u kojoj R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , R_6 i R_7 imaju značenje definirano u zahtjevu 1.
5. Spoj formule II-2:



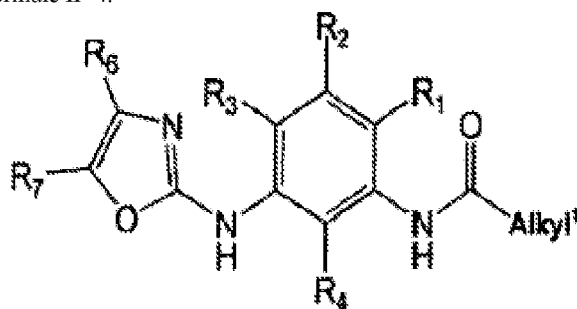
FORMULA II- 2

- 10 **naznačen time** da je A aril¹ ili heteroaril¹ grupa, a u kojoj R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_6 , R_7 , aril¹ i heteroaril¹ imaju značenje definirano u zahtjevu 1.
- 15 6. Spoj formule II- 3:



FORMULA II- 3

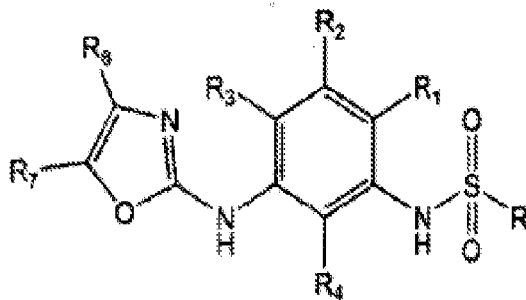
- 20 **naznačen time** da je R neovisno alkil¹, aril¹ ili heteroaril¹ grupa i u kojoj R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_6 i R_7 imaju značenje definirano u zahtjevu 1.
7. Spoj prema zahtjevu 1 formule II- 4:



FORMULA II- 4

naznačen time da $R_1, R_2, R_3, R_4, R_6, R_7$ i alkil¹ imaju značenje definirano u zahtjevu 1.

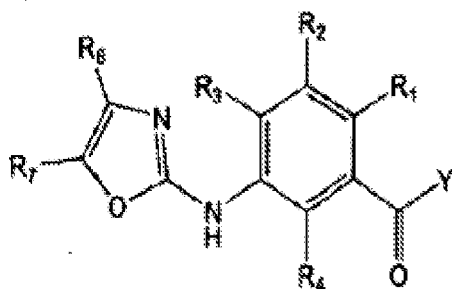
8. Sastav formule I-3:



FORMULA I-3

naznačen time da X jest NHSO_2R grupa, R neovisno alkil¹, aril¹ ili heteroaril¹ grupa i u kojoj alkil¹, aril¹, heteroaril¹, R_1, R_2, R_3, R_4, R_6 i R_7 imaju značenje definirano u zahtjevu 1.

9. Spoj prema zahtjevu 1 formule III:



FORMULA III

naznačen time da je Y odabran između NRaRb , alkil¹, aril¹ ili Ra grupe gdje su Ra i Rb neovisno odabrani između H ili alkil¹ ili aril¹ ili heteroaril¹ grupe, koja je fakultativno zamijenjena odgovarajućom osnovnom azidnom funkcijom i u kojoj $R_1, R_2, R_3, R_4, R_5, R_6$ i R_7 imaju značenje definirano u zahtjevu 1.

10. Spoj prema zahtjevu 1 ili zahtjevu 2, **naznačen time** da je odabran između:

- 4-{[4-metil-3-(4-piridin-3-il-oksazol-2-il-amino)-fenil-amino]-metil} metil ester benzojeve kiseline;
- 4-metil-N1-(5-piridin-3-il-oksazol-2-il)-N3-(5-piridin-4-il-oksazol-2-il)-benzen-1,3-diamin;
- 4-metil-N1-(5-fenil-oksazol-2-il)-N3-(5-piridin-4-il-oksazol-2-il)-benzen-1,3-diamin;
- 4-metil-N1-(5-fenil-[1,3,4]oksadiazol-2-il)-N3-(5-piridin-4-il-oksazol-2-il)-benzen-1,3-diamin;
- N1-benzooksazol-2-il-4-metil-N3-(5-piridin-4-il-oksazol-2-il)-benzen-1,3-diamin;
- N-[4-metil-3-(5-piridin-3-il-oksazol-2-il-amino)-fenil]-acetamid;
- 2-cijano-N-[4-metil-3-(5-piridin-4-il-oksazol-2-il-amino)-fenil]-acetamid;
- 2-etoksi-N-[4-metil-3-(5-piridin-3-il-oksazol-2-il-amino)-fenil]-acetamid;
- 3-metoksi-N-[4-metil-3-(5-piridin-3-il-oksazol-2-il-amino)-fenil]-propionamid;
- 1-[4-metil-3-(5-piridin-3-il-oksazol-2-il-amino)-fenil]-3-p-tolil-urea
- 1-(4-cijanofenil)-3-[4-metil-3-(5-piridin-3-il-oksazol-2-il-amino)-fenil]-urea;
- 1-(4-fluorofenil)-3-[4-metil-3-(5-piridin-3-il-oksazol-2-il-amino)-fenil]-urea;
- 1-(2-fluorofenil)-3-[4-metil-3-(5-piridin-3-il-oksazol-2-il-amino)-fenil]-urea;
- 1-[4-metil-3-(5-piridin-3-il-oksazol-2-il-amino)-fenil]-3-(4-trifluorometil-fenil)-urea;
- 1-(4-klorofenil)-3-[4-metil-3-(5-piridin-3-il-oksazol-2-il-amino)-fenil]-urea;
- 1-[4-metil-3-(5-fenil-oksazol-2-il-amino)-fenil]-3-(3-trifluorometil-fenil)-urea;
- 1-(4-cijanofenil)-3-[4-metil-3-(5-piridin-3-il-oksazol-2-il-amino)-fenil]-tiourea;
- 1-(4-cijanofenil)-3-[4-metil-3-(5-piridin-4-il-oksazol-2-il-amino)-fenil]-tiourea;
- (2-{2-metil-5-[3-(4-trifluorometil-fenil)-ureido]-fenilaminol-oksazol-5-il} etil-eter octene kiseline
- 1-benzil-3-[4-metil-3-(5-piridin-4-il-oksazol-2-il-amino)-fenil]-tiourea;
- 4-(4-metil-piperazin-1-il-metil)-N-[4-metil-3-(5-piridin-3-il-oksazol-2-il-amino)-fenil]-benzamid;
- 3-dimetilamino-N-[4-metil-3-(5-piridin-3-il-oksazol-2-il-amino)-fenil]-benzamid;
- 3-bromo-N-[4-metil-3-(5-piridin-3-il-oksazol-2-il-amino)-fenil]-benzamid;
- N-[4-metoksi-3-(5-piridin-3-il-oksazol-2-il-amino)-fenil]-3-trifluorometil-benzamid;

- 4-(3-dimetilamino-propilamino)-*N*-[4-metil-3-(5-piridin-3-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-3-trifluorometil-benzamid;
 - *N*-[4-fluoro-3-(5-piridin-3-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-3-trifluorometil-benzamid;
 - [4-metil-3-(5-piridin-4-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-amid 1H-indol-6-karboksilne kiseline;
 - 3-izopropoksi-*N*-[4-metil-3-(5-piridin-4-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-benzamid;
 - *N*-[4-metil-3-(5-piridin-2-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-3-trifluorometil-benzamid;
 - 3,5-dimethoksi-*N*-[4-metil-3-(5-piridin-4-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-benzamid;
 - *N*-[3-(5-piridin-3-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-3-trifluorometil-benzamid;
 - *N*-[4-metil-3-(5-fenil-oksazol-2-ilamino)-fenil]-3-trifluorometil-benzamid;
 - 3-fluoro-4-(4-metil-piperazin-1-ilmetil)-*N*-[4-metil-3-(5-piridin-3-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-benzamid;
 - *N*-[4-kloro-3-(5-piridin-3-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-3-trifluorometil-benzamid;
 - *N*-[4-metil-3-(5-piridin-3-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-tereftalamid;
 - [4-metil-3-(5-piridin-4-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-amid 5-metil-izoksazol-4-karboksilne kiseline;
 - 4-cijano-*N*-[4-metil-3-(5-piridin-4-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-benzamid;
 - *N*-[4-metil-3-(5-piridin-3-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-izonikotinamid;
 - *N*-[4-metil-3-(4-piridin-3-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-3-trifluorometil-benzamid;
 - izobutil ester [4-metil-3-(5-piridin-3-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-karbaminske kiseline;
 - izobutil ester (5-izobutoksikarbonilamino-metil-fenil)-(5-piridin-3-il-oksazol-2-il)-karbaminske kiseline;
 - izobutil ester [4-metil-3-(5-piridin-4-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-karbaminske kiseline;
 - *N*-[4-metil-3-(5-piridin-4-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-2-*m*-tolil-acetamid;
 - 2-(4-fluorofenil)-*N*-[4-metoksi-3-(5-piridin-4-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-acetamid;
 - 2-(2,4-difluorofenil)-*N*-[4-metil-3-(5-fenil-oksazol-2-ilamino)-fenil]-acetamid;
 - 2-(3-bromofenil)-*N*-[4-metil-3-(5-piridin-2-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-acetamid;
 - 3-(4-fluorofenil)-*N*-[4-metil-3-(5-piridin-4-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-propionamid;
 - 2-(4-fluorofenil)-*N*-[4-metil-3-(5-piridin-3-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-acetamid;
 - *N*-{3-[5-(4-cijanofenil)-oksazol-2-ilamino]-4-metilfenil}-2-(2,4-difluoro-fenil)-acetamid;
 - [4-metil-3-(5-piridin-3-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-amid 4-metil-pentanske kiseline;
 - *N*-[4-metil-3-(5-piridin-3-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-2-piperazin-1-il-acetamid;
 - *N*-[4-metil-3-(5-piridin-3-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-3-piperazin-1-il-propionamid;
 - 2-(2,6-diklorofenil)-*N*-[4-metil-3-(5-piridin-4-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-acetamid;
 - *N*-[4-metil-3-(5-piridin-3-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-3-pirolidin-1-il-propionamid;
 - *N*-[4-metoksi-3-(5-piridin-4-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-2-(4-trifluorometril-fenil)-acetamid;
 - *N*-(4-metoksifenil)-*N*-[4-metil-3-(5-piridin-4-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-acetamid;
 - *N*-[4-metil-3-(5-piridin-4-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-*C*-fenil-metansulfonamid;
 - *N*-(4-cijanofenil)-4-metil-3-(5-piridin-3-il-oksazol-2-ilamino)-benzamid;
 - *N*-(3-dimetilamino-fenil)-4-metil-3-(5-piridin-4-il-oksazol-2-ilamino)-benzamid;
 - *N*-(2-dimetilaminoetil)-4-metil-3-(5-piridin-3-il-oksazol-2-ilamino)-benzamid;
 - *N*-(3-fluoro-4-metilfenil)-4-metil-3-(5-piridin-4-il-oksazol-2-ilamino)-benzamid;
 - *N*-(3-klorofenil)-4-metil-3-(5-piridin-3-il-oksazol-2-ilamino)-benzamid;
 - *N*-benzil-4-metil-3-(5-piridin-4-il-oksazol-2-ilamino)-benzamid;
 - *N*-(4-metoksi-benzil)-4-metil-3-(5-piridin-4-il-oksazol-2-ilamino)-benzamid;
 - [4-metil-3-(5-piridin-4-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-morfolin-4-il-metanon;
 - [4-metil-3-(5-piridin-4-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-piperazin-1-il-metanon;
 - *N*-(4-fluorofenil)-2-[4-metil-3-(5-piridin-4-il-oksazol-2-ilamino)-fenil]-acetamid.
11. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva od 1 do 10, **naznačen time** da je R₆ atom vodika a R₇ je piridil grupa koja, između ostalog, može nositi bilo koju kombinaciju, na bilo kojem položaju ciklusa, jednog ili više supstituenata poput:
- atoma halogena (odabran između F, Cl, Br ili I);
 - alkil¹ grupe;
 - aril¹ grupe;
 - trifluorometil, O-alkil¹, karboksil, cijano, nitro, formil, hidroksi, NH-alkil¹, N(alkil¹)(alkil¹) i amino grupe, od kojih su potonji azidni supstituenti koji su fakultativno u obliku odgovarajuće osnovne azidne funkcije;
 - NHCO-R ili NHCOO-R ili NHCONH-R ili NHSO₂-R ili NHSO₂NH-R ili CO-R ili COO-R ili CONH-R ili SO₂-R ili SO₂NH-R grupe gdje R odgovara atomu vodika ili alkil¹ grupi.
12. Farmaceutski pripravak, **naznačen time** da sadrži spoj prema bilo kojem od zahtjeva od 1 do 11.
13. Farmaceutski pripravak prema zahtjevu 12, **naznačen time** da sadrži, između ostalog, farmaceutski prihvatljivu podlogu.
14. Farmaceutski sastav prema zahtjevu 13, u obliku tableta, pilula, dražeja, kapsula, tekućina, gelova, sirupa, krema ili suspenzija.

15. Kozmetički ili farmaceutski pripravak za topikalnu primjenu, **naznačen time** da sadrži spoj prema bilo kojem od zahtjeva od 1 do 11.
16. Uporaba spoja prema bilo kojem od zahtjeva od 1 do 11, **naznačena time** da je za proizvodnju lijeka.
- 5 17. Uporaba spoja prema bilo kojem od zahtjeva od 1 do 10, **naznačena time** da je za proizvodnju lijeka namijenjenog liječenju neoplastičnih bolesti poput mastocitoze, mastocitoma kod pasa, čvrstih tumora, gastrointestinalnog stromalnog tumora kod ljudi („GIST“), karcinoma pluća malih stanica, karcinoma pluća ne-malih stanica, akutne mijelocitične leukemije, mijelodisplastičnog sindroma, kronične mijelotične leukemije, mijeloma 414, kolorektalnog karcinoma, karcinoma želuca, gastrointestinalnog stromalnog tumora mokraćnog mjehura, karcinoma testisa, glioblastoma, astrocitoma, karcinoma mokraćnog mjehura i karcinoma dišnih puteva.
- 10 18. Uporaba spoja prema bilo kojem od zahtjeva od 1 do 11, **naznačena time** da je za proizvodnju lijeka namijenjenog liječenju alergijskih bolesti poput astme, alergijskog rinitisa, alergijskog sinusitisa, anafilaktičkog sindroma, urtikarije, Quinckeovog edema, atipijskog dermatitisa alergijskog kontaktnog dermatitisa, čvorastog eritema, poliformnog eritema, nekroznog kožnog venulitisa, kožne upale zbog uboda insekata i parazitskih infestacija koje aspiriraju krv.
- 15 19. Uporaba spoja prema jednom od bilo kojih zahtjeva od 1 do 11, **naznačena time** da je za proizvodnju lijeka namijenjenog liječenju upalnih bolesti poput reumatskog artritisa, konjunktivitisa, reumatskog spondilitisa, artroze, gihta i drugih artritičnih stanja.
- 20 20. Uporaba spoja prema bilo kojem od zahtjeva od 1 do 11, **naznačena time** da je za proizvodnju lijeka namijenjenog liječenju autoimunih bolesti poput multiple skleroze, psorijaze, upalne bolesti crijeva, hemoragičkog rektokolitisa, Chronove bolesti, reumatskog artritisa i poliartritisa, lokalizirane i sistemske sklerodermije, eritemski diseminiranog lupusa, eritemskog diskoidnog lupusa, kožnog lupusa, dermatomiozitisa, polimiozitisa, Sjorgenovog sindroma, čvorastog panarteritisa, autoimune enteropatije kao i proliferativnog glomerulonefritisa.
- 25 21. Uporaba spoja prema jednom od bilo kojih zahtjeva od 1 do 1, **naznačena time** da je za proizvodnju lijeka namijenjenog liječenju bolesti transplantata protiv domaćina ili odbacivanja transplantata kod bilo kojeg transplantiranog organa uključujući bubrege, gušteraču, jetru, srce, pluća i leđnu moždinu.