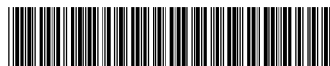




(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO



(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20141200 T1

HR P20141200 T1

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

(51) MKP:

C07D 471/04 (2006.01)
C07D 519/00 (2006.01)
A61K 31/437 (2006.01)
A61P 25/00 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)
A61P 3/10 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 13.02.2015.

(21) Broj predmeta: P20141200T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 11.12.2014.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2011071685
Datum podnošenja međunarodne prijave: 05.12.2011.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 11791543.9
Datum podnošenja europske prijave patenta: 05.12.2011.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2012076430
Datum međunarodne objave: 14.06.2012.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2649070 A1
Datum objave europske prijave patenta: 16.10.2013.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2649070 B1
Datum objave europskog patenta: 17.09.2014.

(31) Broj prve prijave: 10194014 (32) Datum podnošenja prve prijave: 07.12.2010. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: EP

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelji:

F. Hoffmann - La Roche AG, Grenzacherstrasse 124, 4070 Basel, CH
Alexander Flohr, Nachtigallenweg 9, 79540 Loerrach, DE
Luca Gobbi, Neue Bahnhofstrasse 156, 4132 Muttenz, CH
Katrin Groebke Zbinden, Laubibergstrasse 61, 4410 Liestal, CH
Matthias Koerner, Kolpingstrasse 10, 79639 Grenzach-Wyhlen, DE
Jens-Uwe Peters, Winkelmatte 8, 79639 Grenzach-Wyhlen, DE
CPZ - CENTAR ZA PATENTE d.o.o., 10000 Zagreb, HR

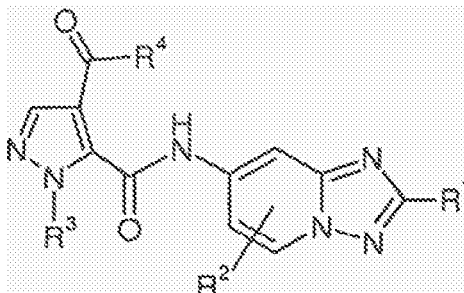
(74) Zastupnik:

(54) Naziv izuma: **SPOJEVI TRIAZOLOPIRIDINA**

HR P20141200 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

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



(I)

u kojoj

- 10 R¹ je halogen, C₁₋₇-alkil, C₁₋₇-haloalkil, C₁₋₇-hidroksialkil, C₁₋₇-alkoksi, C₁₋₇-alkoksi-C₁₋₇-alkil, -C(O)-NR⁹R¹⁰, aril, heteroaril ili NR⁷R⁸,

gdje navedeni aril i navedeni heteroaril mogu biti supstituirani s 1 do 3 supstituenta neovisno odabranih iz skupine koju čine halogen, C₁₋₇-alkil, C₁₋₇-alkoksi, C₁₋₇-alkoksi-C₁₋₇-alkil, C₁₋₇-haloalkil i C₁₋₇-haloalkoksi;

R² je vodik, halogen, C₁₋₇-alkil, C₁₋₇-haloalkil, C₁₋₇-hidroksialkil, C₁₋₇-alkoksi ili C₁₋₇-alkoksi-C₁₋₇-alkil;

- 15 R³ je vodik, C₁₋₇-alkil, C₁₋₇-haloalkil, C₁₋₇-hidroksialkil, C₁₋₇-alkoksi ili C₁₋₇-alkoksi-C₁₋₇-alkil;

R⁴ je hidroksil, C₁₋₇-alkoksi ili NR⁵R⁶;

R⁵ i R⁶ su neovisno vodik, C₁₋₇-alkil, C₁₋₇-haloalkil, C₁₋₇-hidroksialkil, C₁₋₇-alkoksi-C₁₋₇-alkil, cikloalkil ili heterociklil, ili

- 20 R⁵ i/ili R⁶ su C₁₋₇-alkil supstituiran sa supstituentom odabranim iz skupine koju čine heteroaril, C₁₋₇-alkil-heteroaril i C₁₋₇-alkoksi-C(O)-, ili

R⁵ i R⁶, zajedno s atomom dušika na kojega su priključeni, tvore heterociklil, biciklo-heterociklil ili spiro-heterociklil, gdje navedeni heterociklil može biti supstituiran s 1 do 3 supstituenta neovisno odabranih iz skupine koju čine hidroksil, halogen, C₁₋₇-alkil, C₁₋₇-alkoksi, C₁₋₇-alkoksi-C₁₋₇-alkil, C₁₋₇-haloalkil i okso;

- 25 R⁷ i R⁸ su neovisno vodik, C₁₋₇-alkil, C₁₋₇-haloalkil, C₁₋₇-hidroksialkil, C₁₋₇-alkoksi-C₁₋₇-alkil ili cikloalkil, ili

R⁷ i R⁸ zajedno s atomom dušika na kojega su priključeni, tvore heterociklil opcijski supstituiran sa supstituentom odabranim iz skupine koju čine hidroksil, halogen i okso; i

R⁹ i R¹⁰ su neovisno vodik, C₁₋₇-alkil, C₁₋₇-haloalkil, C₁₋₇-hidroksialkil ili C₁₋₇-alkoksi-C₁₋₇-alkil,

ili njegova farmaceutski prikladna sol.

- 30 2. Spoj prema zahtjevu 1, naznačen time, da

R¹ je C₁₋₇-alkil, -C(O)-NH-C₁₋₇-haloalkil, aril, heteroaril ili NR⁷R⁸, gdje navedeni aril i navedeni heteroaril mogu biti supstituirani s 1 do 3 supstituenta neovisno odabranih iz skupine koju čine hidroksil, halogen, C₁₋₇-alkil, C₁₋₇-alkoksi i C₁₋₇-haloalkil;

R² je vodik, halogen ili C₁₋₇-alkil;

- 35 R³ je vodik ili C₁₋₇-alkil;

R⁴ je hidroksil, C₁₋₇-alkoksi ili NR⁵R⁶;

R⁵ i R⁶ su neovisno vodik, C₁₋₇-alkil, C₁₋₇-haloalkil, C₁₋₇-alkoksi- C₁₋₇-alkil, C₁₋₇-alkil supstituiran s C₁₋₇-alkil-heteroarilom ili heterociklilom, ili

- 40 R⁵ i R⁶ zajedno s atomom dušika na kojega su priključeni, tvore heterociklil koji može biti supstituiran s 1 do 3 supstituenta neovisno odabranih iz skupine koju čine hidroksil, halogen, C₁₋₇-alkil, C₁₋₇-alkoksi, C₁₋₇-haloalkil i okso; i

R⁷ i R⁸ su neovisno C₁₋₇-alkil ili zajedno s atomom dušika na kojega su priključeni, tvore morfolinil-prsten, ili njegova farmaceutski prikladna sol.

- 45 3. Spoj ili njegova farmaceutski prikladna sol prema zahtjevu 1, naznačen/a time, da

R¹ je halogen, C₁₋₇-alkil, -C(O)-NR⁹R¹⁰, fenil, piridinil ili NR⁷R⁸, gdje navedeni fenil i navedeni piridinil mogu biti supstituirani s 1 do 3 supstituenta neovisno odabranih iz skupine koju čine hidroksil, halogen, C₁₋₇-alkil, C₁₋₇-alkoksi, C₁₋₇-haloalkil i C₁₋₇-haloalkoksi;

R⁷ i R⁸ su neovisno C₁₋₇-alkil, C₁₋₇-haloalkil ili cikloalkil, ili

R⁷ i R⁸, zajedno s atomom dušika na kojega su priključeni, tvore pirolidin-1-il, 2-oksopirolidin-1-il ili morfolin-4-il;

- 50 i

R⁹ i R¹⁰ su neovisno vodik, C₁₋₇-alkil, C₁₋₇-haloalkil ili C₁₋₇-alkoksi-C₁₋₇-alkil.

4. Spoj ili njegova farmaceutski prikladna sol prema zahtjevu 3, naznačen/a time, da

R¹ je fenil, 3-fluorofenil, 2-metoksifenil, 3-metoksi-fenil, piridin-3-il, 2-fluoropiridin-4-il, dimetilamino, etil-metil-amino, ciklopropil-metil-amino, pirolidin-1-il ili morfolin-4-il.

5. Spoj ili njegova farmaceutske prikladna sol prema bilo kojem zahtjevu 1 do 4, **naznačen/a time, da** R² je vodik, halogen ili C₁₋₇-alkil.

6. Spoj ili njegova farmaceutske prikladna sol prema bilo kojem zahtjevu 1 do 5, **naznačen/a time, da** R² je vodik.

7. Spoj ili njegova farmaceutske prikladna sol prema bilo kojem zahtjevu 1 do 6, **naznačen/a time, da** R² je vodik, halogen ili C₁₋₇-alkil.

8. Spoj ili njegova farmaceutske prikladna sol prema bilo kojem zahtjevu 1, 3 do 7, **naznačen/a time, da**

R⁴ je hidroksil, C₁₋₇-alkoksi ili NR⁵R⁶;

R⁵ i R⁶ su neovisno vodik, C₁₋₇-alkil, C₁₋₇-haloalkil, C₁₋₇-hidroksialkil, C₁₋₇-alkoksi-C₁₋₇-alkil, ciklopropil, ciklopentil, oksetanil ili tetrahidrofuranil, ili

R⁵ i/ili R⁶ su C₁₋₇-alkil supstituiran sa supstutentom odabranim iz skupine koju čine C₁₋₇-alkil-piridinil i metoksikarbonil, ili

R⁵ i R⁶, zajedno s atomom dušika na kojega su priključeni, tvore heterociklil odabran iz skupine koju čine azetidini, pirolidini, piperazini, morfolini i tiomorfolini, gdje navedeni heterociklil može biti supstituiran s 1 do 3 supstituenta neovisno odabranih iz skupine koju čine halogen, C₁₋₇-alkil, C₁₋₇-alkoksi i okso, ili R⁵ i R⁶, zajedno s atomom dušika na kojega su priključeni, tvore 2-oksa-5-azabicyclo[2.2.1]heptanil, 2-oksa-6-azaspiro[3.3]heptanil ili 1,4-diaza-bicyclo[3.2.1]oktanil.

9. Spoj ili njegova farmaceutske prikladna sol prema bilo kojem zahtjevu 1 do 8, **naznačen/a time, da**

R⁴ je NR⁵R⁶;

R⁵ i R⁶ su neovisno metil, etil, 2-fluoroetil, 2-metoksietil ili ciklopropil, ili

R⁵ i R⁶, zajedno s atomom dušika na kojega su priključeni, tvore heterociklil odabran iz skupine koju čine azetidini, 3-fluoroazetidini, morfolin-4-il i pirolidini, ili

R⁵ i R⁶, zajedno s atomom dušika na kojega su priključeni, tvore 2-oksa-6-azaspiro[3.3]heptanil ili 1,4-diaza-bicyclo[3.2.1]oktanil.

10. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 9, **naznačen time, da** je odabran iz skupine koju čine:

metil 1-metil-5-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-ilkarbamoil)-1H-pirazol-4-karboksilat,

1-metil-5-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-ilkarbamoil)-1H-pirazol-4-karboksilna kiselina,

4-((azetidin-1-karbonil)-1-metil-N-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-5-karboksamid,

N4-(2-metoksietil)-N4,1-dimetil-N5-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,

N4-etil-N4,1-dimetil-N5-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,

N4,N4-bis(2-metoksietil)-1-metil-N5-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,

N4-etil-1-metil-N5-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,

4-((azetidin-1-karbonil)-1-metil-N-(2-morfolino-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-5-karboksamid,

4-((azetidin-1-karbonil)-1-metil-N-(8-metil-2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-5-karboksamid,

4-((azetidin-1-karbonil)-1-metil-N-(6-metil-2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-5-karboksamid,

N4,N4,1-trimetil-N5-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,

1-metil-4-(morfolin-4-karbonil)-N-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-5-karboksamid,

1-metil-N-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-4-(pirolidin-1-karbonil)-1H-pirazol-5-karboksamid,

(S)-1-metil-N5-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-N4-(tetrahidrofuran-3-il)-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,

(R)-1-metil-N5-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-N4-(tetrahidrofuran-3-il)-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,

N4-(3-metoksipropil)-1-metil-N5-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,

1-metil-N4-(oksetan-3-il)-N5-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,

N4,N4-dietil-1-metil-N5-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,

N4-izopropil-1-metil-N5-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,

N4,1-dimetil-N4-((6-metilpiridin-3-il)metil)-N5-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-4,5-

dikarboksamid,

N4-(2-fluoroetil)-N4,1-dimetil-N5-(2-morfolino-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,

4-((1,1-dioksa-lambda*6*-tiomorfolin-4-karbonil)-2-metil-2H-pirazol-3-karboksilna kiselina-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-amid,

N4,1-dimetil-N5-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,

4-((3-metoksiazetidin-1-karbonil)-1-metil-N-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-5-karboksamid,

4-((3-fluoroazetidin-1-karbonil)-1-metil-N-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-5-karboksamid,

1-metil-2H-pirazol-3,4-dikarboksilna kiselina-4-[(2-fluoro-etil)-metil-amid]-3-[(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]

piridin-7-il)-amid],

izopropil-1-metil-5-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-ilkarbamoil)-1H-pirazol-4-karboksilat,

etil-1-metil-5-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-ilkarbamoil)-1H-pirazol-4-karboksilat,

1-metil-4-(morfolin-4-karbonil)-N-(2-morfolino-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-5-karboksamid,

4-((azetidin-1-karbonil)-N-(6-fluoro-2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1-metil-1H-pirazol-5-karboksamid,

N-(6-fluoro-2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1-metil-4-(pirolidin-1-karbonil)-1H-pirazol-5-karboksamid,

N-(6-fluoro-2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1-metil-4-(morfolin-4-karbonil)-1H-pirazol-5-karboksamid,

7-((4-(azetidin-1-karbonil)-1-metil-1H-pirazol-5-karboksamido)-N-(3,3,3-trifluoropropil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-2-karboksamid,
N-(2-izopropil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1-metil-4-(pirolidin-1-karbonil)-1H-pirazol-5-karboksamid,
4-((azetidin-1-karbonil)-N-(2-(dimetilamino)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1-metil-1H-pirazol-5-karboksamid,
5 N-(2-(dimetilamino)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1-metil-4-(morfolin-4-karbonil)-1H-pirazol-5-karboksamid,
N-(2-(dimetilamino)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1-metil-4-(pirolidin-1-karbonil)-1H-pirazol-5-karboksamid,
N-(2-(dimetilamino)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-4-(3-fluoroazetidin-1-karbonil)-1-metil-1H-pirazol-5-karboksamid,
N4,N4-dietil-1-metil-N5-(2-morfolino-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,
10 N4,N4,1-trimetil-N5-(2-morfolino-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,
N4-etil-N4,1-dimetil-N5-(2-morfolino-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,
1-metil-N-(2-morfolino-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-4-(pirolidin-1-karbonil)-1H-pirazol-5-karboksamid,
4-(3-fluoroazetidin-1-karbonil)-1-metil-N-(2-morfolino-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-5-karboksamid,
15 4-((azetidin-1-karbonil)-1-metil-N-(2-(piridin-3-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-5-karboksamid,
1-metil-4-(morfolin-4-karbonil)-N-(2-(piridin-3-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-5-karboksamid,
1-metil-N-(2-(piridin-3-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-4-(pirolidin-1-karbonil)-1H-pirazol-5-karboksamid,
4-(3-fluoroazetidin-1-karbonil)-1-metil-N-(2-(piridin-3-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-5-karboksamid,
20 N4-ciklopropil-N4,1-dimetil-N5-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,
N4,1-dimetil-N5-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-N4-(2,2,2-trifluoroetil)-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,
4-((azetidin-1-karbonil)-N-(2-izopropil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1-metil-1H-pirazol-5-karboksamid,
4-(3-fluoroazetidin-1-karbonil)-N-(2-izopropil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1-metil-1H-pirazol-5-karboksamid,
25 N4-ciklopentil-N4,1-dimetil-N5-(2-morfolino-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,
N4-ciklopropil-N4,1-dimetil-N5-(2-morfolino-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,
N4,1-dimetil-N5-(2-morfolino-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-N4-(2,2,2-trifluoroetil)-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,
N4-ciklopropil-N4,1-dimetil-N5-(2-(piridin-3-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,
30 N4-[2-fluoroetil)-N4,1-dimetil-N5-(2-(piridin-3-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,
4-(((1S,4S)-2-oksa-5-azabicyklo[2.2.1]heptan-5-karbonil)-1-metil-N-(2-(piridin-3-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-5-karboksamid,
4-((azetidin-1-karbonil)-2-metil-2H-pirazol-3-karboksilna kiselina-[2-(etil-metil-amino)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il]-amid,
35 1-metil-4-(morfolin-4-karbonil)-2H-pirazol-3-karboksilna kiselina-[2-(etil-metil-amino)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il]-amid,
4-((azetidin-1-karbonil)-1-metil-N-(2-(pirolidin-1-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-5-karboksamid,
1-metil-4-(morfolin-4-karbonil)-N-(2-(pirolidin-1-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-5-karboksamid,
40 7-((4-(azetidin-1-karbonil)-1-metil-1H-pirazol-5-karboksamido)-N,N-dimetil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-2-karboksamid,
7-((4-(azetidin-1-karbonil)-1-metil-1H-pirazol-5-karboksamido)-N-etil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-2-karboksamid,
7-((4-(azetidin-1-karbonil)-1-metil-1H-pirazol-5-karboksamido)-N-(2-metoksietil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-2-karboksamid,
45 4-((azetidin-1-karbonil)-N-(2-bromo-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1-metil-1H-pirazol-5-karboksamid,
4-((azetidin-1-karbonil)-1-metil-N-(2-(piridin-4-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-5-karboksamid,
4-((azetidin-1-karbonil)-1-metil-N-(2-(2-metilpiridin-4-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-5-karboksamid,
4-((azetidin-1-karbonil)-1-metil-N-(2-(5-metilpiridin-3-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-5-karboksamid,
50 N-(2-(2-metoksifenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1-metil-4-(morfolin-4-karbonil)-1H-pirazol-5-karboksamid,
4-((azetidin-1-karbonil)-N-(2-((2-fluoroetil)(metil)amino)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1-metil-1H-pirazol-5-karboksamid,
N-(2-((2-fluoroetil)(metil)amino)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1-metil-4-(morfolin-4-karbonil)-1H-pirazol-5-karboksamid,
55 N5-(2-((2-fluoroetil)(metil)amino)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-N4,N4,1-trimetil-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,
N4-etil-N5-(2-((2-fluoroetil)(metil)amino)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-N4,1-dimetil-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,
60 N4-ciklopropil-N5-(2-((2-fluoroetil)(metil)amino)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-N4,1-dimetil-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,

- 4-((azetidin-1-karbonil)-2-metil-2H-pirazol-3-karboksilna kiselina-[2-(3-metoksi-fenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il]-amid,
- 1-metil-4-(morfolin-4-karbonil)-2H-pirazol-3-karboksilna kiselina-[2-(3-metoksi-fenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il]-amid,
- 5 2-metil-2H-pirazol-3,4-dikarboksilna kiselina-4-[(2-metoksi-etil)-metil-amid]-3-{{2-(3-metoksi-fenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il}-amid},
- 2-metil-2H-pirazol-3,4-dikarboksilna kiselina-4-dimetilamid-3-{{2-(3-metoksi-fenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il}-amid},
- 10 2-metil-2H-pirazol-3,4-dikarboksilna kiselina-4-(etil-metil-amid)-3-{{2-(3-metoksi-fenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il}-amid},
- 2-metil-4-(morfolin-4-karbonil)-2H-pirazol-3-karboksilna kiselina-[2-(3-hidroksi-fenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il]-amid,
- 2-metil-4-(morfolin-4-karbonil)-2H-pirazol-3-karboksilna kiselina-{{2-[3-(2-fluoro-etoksi)-fenil]-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il}-amid},
- 15 2-metil-4-(morfolin-4-karbonil)-2H-pirazol-3-karboksilna kiselina-[2-(3-fluorometoksifenil)-[1,2,4] triazolo[1,5-a]piridin-7-il]-amid,
- 2-metil-2H-pirazol-3,4-dikarboksilna kiselina-4-(etil-metil-amid) 3-{{2-[3-(2-fluoro-etoksi)-fenil]-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il}-amid},
- 20 2-metil-2H-pirazol-3,4-dikarboksilna kiselina-4(etil-metil-amid)-3-{{2-(3-fluorometoksi-fenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il}-amid},
- 2-etil-2H-pirazol-3,4-dikarboksilna kiselina-4-dimetilamid-3-{{2-[3-(2-fluoro-etoksi)-fenil]-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il}-amid},
- 2-metil-2H-pirazol-3,4-dikarboksilna kiselina-4-dimetilamid-3-{{2-(3-fluorometoksifenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il}-amid},
- 25 2-metil-2H-pirazol-3,4-dikarboksilna kiselina-3-{{2-(3-hidroksi-fenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7- il}-amid}4-[(2-metoksi-etil)-metil-amid],
- 2-metil-2H-pirazol-3,4-dikarboksilna kiselina-3-{{2-[3-(2-fluoro-etoksi)-fenil]-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7- il}-amid}-4-[(2-metoksi-etil)-metil-amid],
- 30 2-metil-2H-pirazol-3,4-dikarboksilna kiselina-3-{{2-(3-fluorometoksi-fenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a] piridin-7-il}-amid}4-[(2-metoksi-etil)-metil-amid],
- 4-((azetidin-1-karbonil)-2-metil-2H-pirazol-3-karboksilna kiselina-{{2-[3-(2-fluoro-etoksi)-fenil][1,2,4] triazolo[1,5-a]piridin-7-il}-amid},
- 4-((azetidin-1-karbonil)-2-metil-2H-pirazol-3-karboksilna kiselina-[2-(3-fluorometoksifenil)[1,2,4] triazolo[1,5-a]piridin-7-il]-amid,
- 35 2-metil-2H-pirazol-3,4-dikarboksilna kiselina-4-[(2-hidroksi-etil)-metil-amid]-3-[(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-amid],
- {metil-[1-metil-5-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-ilkarbamoil)-1H-pirazol-4-karbonil]-amino }-octena kiselina-metil ester,
- 2-metil-2H-pirazol-3,4-dikarboksilna kiselina -4-[(2-hidroksi-etil)-metil-amid]-3-[(2-morfolin-4-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il]-amid,
- 40 {metil-[1-metil-5-(2-morfolin-4-il-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-ilkarbamoil)-1H-pirazol-4-karbonil]-amino }-octena kiselina-metil ester,
- 2-metil-2H-pirazol-3,4-dikarboksilna kiselina-4-[(2-fluoro-etil)-amid]-3-[(2-fenil[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-amid],
- 45 2-metil-2H-pirazol-3,4-dikarboksilna kiselina-4-dimetilamid-3-{{2-(2-metoksi-fenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il}-amid},
- 2-metil-2H-pirazol-3,4-dikarboksilna kiselina-4-(etil-metil-amid)-3-{{2-(2-metoksi-fenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il}-amid},
- 2-metil-2H-pirazol-3,4-dikarboksilna kiselina-4-[(2-metoksi-etil)-metil-amid]-3-{{2-(2-metoksi-fenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il}-amid},
- 50 2-metil-2H-pirazol-3,4-dikarboksilna kiselina-4-dimetilamid-3-{{2-[2-(2-fluoro-etoksi)-fenil]-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il}-amid},
- 2-metil-2H-pirazol-3,4-dikarboksilna kiselina-4-(etil-metil-amid)-3-{{2-[2-(2-fluoro-etoksi)-fenil]-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il}-amid},
- 55 4-((azetidin-1-karbonil)-N-(2-(2-metoksifenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1-metil-1H-pirazol-5-karboksamid,
- N4-ciklopropil-N5-(2-(2-metoksifenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-N4,1-dimetil-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,
- N5-(2-(3-fluorofenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-N4,N4,1-trimetil-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,
- 4-((azetidin-1-karbonil)-N-(2-(3-fluorofenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1-metil-1H-pirazol-5-karboksamid,
- 60 N-(2-(3-fluorofenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1-metil-4-(morfolin-4-karbonil)-1H-pirazol-5-karboksamid,
- N-(2-(3-fluorofenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-4-(3-metoksiazetidin-1-karbonil)-1-metil-1H-pirazol-5-karboksamid,

N-(2-(3-fluorofenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1-metil-4-(4-metilpiperazin-1-karbonil)-1H-pirazol-5-karboksamid,
 N5-(2-(2-fluoropiridin-3-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-N4,N4,1-trimetil-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,
 4-((azetidin-1-karbonil)-N-(2-(2-fluoropiridin-3-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1-metil-1H-pirazol-5-karboksamid,
 N-(2-(2-fluoropiridin-3-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1-metil-4-(morfolin-4-karbonil)-1H-pirazol-5-karboksamid,
 1-metil-N-(2-morfolino-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-4-(2-oksa-6-azaspiro[3.3]heptan-6-karbonil)-1H-pirazol-5-karboksamid,
 N4-ciklopropil-1-metil-N5-(2-morfolino-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,
 4-((3-fluoroazetidin-1-karbonil)-N-(2-((2-fluoroetil)(metil)amino)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1-metil-1H-pirazol-5-karboksamid,
 N-(2-((2-fluoroetil)(metil)amino)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1-metil-4-(pirolidin-1-karbonil)-1H-pirazol-5-karboksamid,
 N4-etil-N4,1-dimetil-N5-(2-(piridin-3-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,
 N-(2-(2-fluoropiridin-4-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1-metil-4-(morfolin-4-karbonil)-1H-pirazol-5-karboksamid,
 4-((azetidin-1-karbonil)-N-(2-(2-fluoropiridin-4-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1-metil-1H-pirazol-5-karboksamid,
 4-((azetidin-1-karbonil)-N-(2-(6-fluoropiridin-2-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1-metil-1H-pirazol-5-karboksamid,
 N5-(2-(6-fluoropiridin-2-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-N4,N4,1-trimetil-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,
 N-(2-(6-fluoropiridin-2-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1-metil-4-(morfolin-4-karbonil)-1H-pirazol-5-karboksamid,
 1-metil-4-(2-oksa-6-azaspiro[3.3]heptan-6-karbonil)-2H-pirazol-3-karboksilna kiselina-(2-pirolidin-1-il-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-amid,
 2-metil-2H-pirazol-3,4-dikarboksilna kiselina-4-(ciklopropil-metil-amid)-3-[(2-pirolidin-1-il-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-amid],
 2-metil-2H-pirazol-3,4-dikarboksilna kiselina-4-(etil-metil-amid)-3-[(2-pirolidin-1-il-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-amid],
 5-[2-(ciklopropil-metil-amino)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il-karbamoil]-1-metil-1H-pirazol-4-karboksilna kiselina,
 2-metil-2H-pirazol-3,4-dikarboksilna kiselina-4-(ciklopropil-metil-amide)-3-[[2-(ciklopropil-metil-amino)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il]-amid],
 4-((azetidin-1-karbonil)-2-metil-2H-pirazol-3-karboksilna kiselina-[2-(ciklopropil-metil-amino)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il]-amid,
 2-metil-4-(morfolin-4-karbonil)-2H-pirazol-3-karboksilna kiselina-[2-(ciklopropil-metil-amino)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il]-amid,
 4-((1,4-diaza-biciklo[3.2.1]oktan-4-karbonil)-2-metil-2H-pirazol-3-karboksilna kiselina-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-amid,
 4-((azetidin-1-karbonil)-2-metil-2H-pirazol-3-karboksilna kiselina-{2-[2-(2-fluoro-etoksi)-fenil]-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il}-amid,
 2-metil-4-(morfolin-4-karbonil)-2H-pirazol-3-karboksilna kiselina-{2-[2-(2-fluoro-etoksi)-fenil]-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il}-amid,
 2-metil-2H-pirazol-3,4-dikarboksilna kiselina-3-({2-[2-(2-fluoro-etoksi)-fenil]-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il}-amid)-4-[(2-metoksi-etil)-metil-amid], i
 metil-4-(morfolin-4-karbonil)-N-(2-(2-okso-pirolidin-1-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-5-karboksamid,

ili njegova farmaceutski prikladna sol.

11. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 10, **naznačen time, da** je odabran iz skupine koju čine:

4-((azetidin-1-karbonil)-1-metil-N-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-5-karboksamid,
 N4-etil-N4,1-dimetil-N5-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,
 4-((azetidin-1-karbonil)-1-metil-N-(2-morfolino-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-5-karboksamid,
 1-metil-4-(morfolin-4-karbonil)-N-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-5-karboksamid,
 1-metil-N-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-4-(pirolidin-1-karbonil)-1H-pirazol-5-karboksamid,
 4-((3-fluoroazetidin-1-karbonil)-1-metil-N-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-5-karboksamid,
 1-metil-2H-pirazol-3,4-dikarboksilna kiselina-4-[(2-fluoro-etil)-metil-amid]-3-[(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-amid],
 1-metil-4-(morfolin-4-karbonil)-N-(2-morfolino-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-5-karboksamid,
 4-((azetidin-1-karbonil)-N-(2-(dimetilamino)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1-metil-1H-pirazol-5-karboksamid,
 N-(2-(dimetilamino)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1-metil-4-(pirolidin-1-karbonil)-1H-pirazol-5-karboksamid,

N-(2-(dimetilamino)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-4-(3-fluoroazetidin-1-karbonil)-1-metil-1H-pirazol-5-karboksamid,

4-((azetidin-1-karbonil)-1-metil-N-(2-(piridin-3-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-5-karboksamid,

1-metil-4-(morfolin-4-karbonil)-N-(2-(piridin-3-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-5-karboksamid,

N4-ciklopropil-N4,1-dimetil-N5-(2-fenil-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,

N4-ciklopropil-N4,1-dimetil-N5-(2-morfolino-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,

N4-ciklopropil-N4,1-dimetil-N5-(2-(piridin-3-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,

1-metil-4-(morfolin-4-karbonil)-2H-pirazol-3-karboksilna kiselina-[2-(etil-metil-amino)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]

piridin-7-il]-amid,

1-metil-4-(morfolin-4-karbonil)-N-(2-(pirolidin-1-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1H-pirazol-5-karboksamid,

N-(2-(2-metoksifenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1-metil-4-(morfolin-4-karbonil)-1H-pirazol-5-karboksamid,

2-metil-4-(morfolin-4-karbonil)-2H-pirazol-3-karboksilna kiselina-[2-(3-metoksi-fenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]

piridin-7-il]-amid,

2-metil-2H-pirazol-3,4-dikarboksilna

kiselina-4-[(2-metoksi-etil)-metil-amid]-3-[[2-(3-metoksi-fenil)-

[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il]-amid},

N5-(2-(3-fluorofenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-N4,N4,1-trimetil-1H-pirazol-4,5-dikarboksamid,

4-((azetidin-1-karbonil)-N-(2-(2-fluoropiridin-4-il)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-1-metil-1H-pirazol-5-

karboksamid,

2-metil-4-(2-oksa-6-aza-spiro[3.3]heptan-6-karbonil)-2H-pirazol-3-karboksilna kiselina-(2-pirolidin-1-il-[1,2,4]

triazolo[1,5-a]piridin-7-il)-amid,

2-metil-2H-pirazol-3,4-dikarboksilna kiselina-4-(ciklopropil-metil-amid)-3-[(2-pirolidin-1-il-[1,2,4]triazolo[1,5-a]

piridin-7-il)-amid],

4-((azetidin-1-karbonil)-2-metil-2H-pirazol-3-karboksilna kiselina-[2-(ciklopropil-metil-amino)-[1,2,4]triazolo

[1,5-a]piridin-7-il)-amid, i

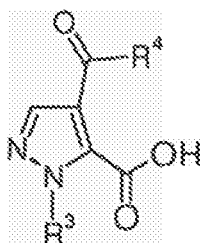
4-(1,4-diaza-biciklo[3.2.1]oktan-4-karbonil)-2-metil-2H-pirazol-3-karboksilna kiselina-(2-fenil-[1,2,4]triazolo

[1,5-a]piridin-7-il)-amid,

ili njegova farmaceutski prikladna sol.

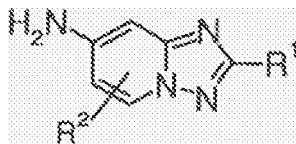
12. Postupak proizvodnje spoja formule (I), prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 11, **naznačen time, da** taj postupak obuhvaća

reakciju spoja formule (2):



(2)

sa spojem formule (3)



(3)

gdje su R^1 , R^2 , R^3 i R^4 kao što su definirani u bilo kojem od zahtjeva 1 do 11, te ako se želi, pretvaranje spoja u njegovu farmaceutski prikladnu sol.

13. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 11, **naznačen time, da** se upotrebljava kao terapijska djelotvorna tvar.

14. Farmaceutski sastav, **naznačen time, da** sadrži spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 11, te terapijski inertan nosač.

15. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 11, **naznačen time, da** se upotrebljava za liječenje ili profilaksu sljedećih stanja; psihotički poremećaji, shizofrenija, pozitivni, negativni i/ili kognitivni simptomi povezani sa shizofrenijom, deluzijski poremećaj, psihotički poremećaj izazvan nekom tvari, stanja anksioznosti, stanje panike, opsesivno/kompulzivni poremećaji, poremećaj od akutnog stresa, poremećaj generalizirane anksioznosti, ovisnost o lijekovima, poremećaj pokreta, Parkinsonova bolest, sindrom nemirnih nogu, stanje kognitivne deficijencije, Alzheimerova bolest, demencija zbog višestrukog infarkta, poremećaj raspoloženja, depresija, bipolarni poremećaji, neuropsihijatrijska stanja, psihoze, poremećaj s nedostatkom koncentracije/poremećaj s hiperaktivnosti, poremećaji pažnje, dijabetes i poremećaji povezani s time, dijabetes mellitus tipa 2, neurodegenerativni poremećaji, Huntingtonova bolest, multipla skleroza, udar, ozljeda leđne moždine, čvrsti tumori, hematološke maligne promjene, karcinom renalnih stanica ili rak dojke.