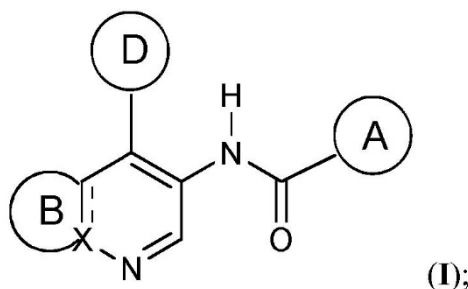


PATENTNI ZAHTJEVI

1. Spoj formule (I):



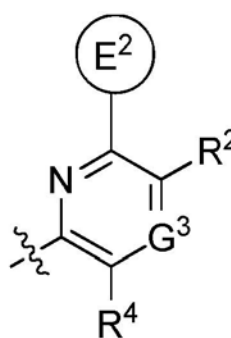
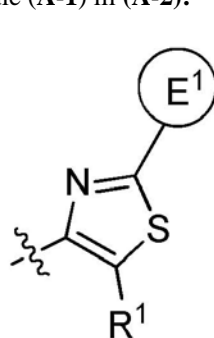
5 ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, pri čemu:

X je C;

A, B i D su prstenovi;

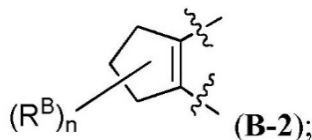
veza $--$ predstavlja C=C vezu;

prsten A je formule (A-1) ili (A-2):



10 gdje su E¹ i E² prstenovi;

prsten B je prema formuli (B-2):



gdje je n odabrano od 0, 1, 2 i 3;

15 prsten D je piperidinski prsten, koji je supstituiran sa k supstitutima neovisno izabranim iz R^D, pri čemu je k 0, 1, 2 ili 3;

prsten E¹ je fenil opcionalno supstituiran s 1, 2 ili 3, supstituenta neovisno izabranih od R^E;

prsten E² je fenil opcionalno supstituiran sa 1, 2 ili 3, supstituenta neovisno izabranih od R^E;

G³ je N ili CR³;

20 R¹ je izabran od H, F i NH₂;

R² je izabran od H, halo i CN;

R³ je izabran od H, halo i CN;

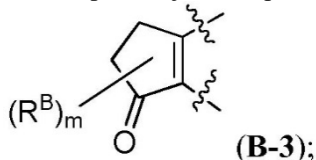
R⁴ je izabran od H, F i NH₂;

25 svaki R^B je neovisno izabran od Cy^B, halo, C₁₋₆ alkil, C₂₋₆ alkenil, C₂₋₆ alkinil, C₁₋₆ haloalkil, CN, NO₂, OR^{a1}, SR^{a1}, C(O)R^{b1}, C(O)NR^{c1}R^{d1}, C(O)OR^{a1}, OC(O)R^{b1}, OC(O)NR^{c1}R^{d1}, C(=NR^{e1})NR^{c1}R^{d1}, NR^{c1}C(=NR^{e1})NR^{c1}R^{d1}, NR^{c1}R^{d1}, NR^{c1}C(O)R^{b1}, NR^{c1}C(O)OR^{a1}, NR^{c1}C(O)NR^{c1}R^{d1}, NR^{c1}S(O)R^{b1}, NR^{c1}S(O)₂R^{b1}, NR^{c1}S(O)₂NR^{c1}R^{d1}, S(O)R^{b1}, S(O)NR^{c1}R^{d1}, S(O)₂R^{b1}, S(O)₂NR^{c1}R^{d1} i okso; pri čemu spomenuti C₁₋₆ alkil, C₂₋₆ alkenil, i C₂₋₆ alkinil supstituenti od R^B su svaki opcionalno supstituirani s 1, 2 ili 3 supstituenta neovisno izabranih od Cy^B, halo, CN, NO₂, OR^{a1}, SR^{a1}, C(O)R^{b1}, C(O)NR^{c1}R^{d1}, C(O)OR^{a1}, OC(O)R^{b1}, OC(O)NR^{c1}R^{d1}, C(=NR^{e1})NR^{c1}R^{d1}, NR^{c1}C(=NR^{e1})NR^{c1}R^{d1}, NR^{c1}R^{d1}, NR^{c1}C(O)R^{b1}, NR^{c1}C(O)OR^{a1}, NR^{c1}C(O)NR^{c1}R^{d1}, NR^{c1}S(O)R^{b1}, NR^{c1}S(O)₂R^{b1}, NR^{c1}S(O)₂NR^{c1}R^{d1}, S(O)R^{b1}, S(O)NR^{c1}R^{d1}, S(O)₂R^{b1}, S(O)₂NR^{c1}R^{d1} i okso;

35 svaki R^D je neovisno izabran od Cy^D, halo, C₁₋₆ alkil, C₂₋₆ alkenil, C₂₋₆ alkinil, C₁₋₆ haloalkil, CN, NO₂, OR^{a2}, SR^{a2}, C(O)R^{b2}, C(O)NR^{c2}R^{d2}, C(O)OR^{a2}, OC(O)R^{b2}, OC(O)NR^{c2}R^{d2}, C(=NR^{e2})NR^{c2}R^{d2}, NR^{c2}C(=NR^{e2})NR^{c2}R^{d2}, NR^{c2}R^{d2}, NR^{c2}C(O)R^{b2}, NR^{c2}C(O)OR^{a2}, NR^{c2}C(O)NR^{c2}R^{d2}, NR^{c2}S(O)R^{b2}, NR^{c2}S(O)₂R^{b2}, NR^{c2}S(O)₂NR^{c2}R^{d2}, S(O)R^{b2}, S(O)NR^{c2}R^{d2}, S(O)₂R^{b2}, S(O)₂NR^{c2}R^{d2} i okso; pri čemu spomenuti C₁₋₆ alkil, C₂₋₆ alkenil, i C₂₋₆ alkinil supstituenti od R^D su svaki opcionalno supstituirani s 1, 2 ili 3 supstituenta neovisno izabranih od Cy^D, halo, CN, NO₂, OR^{a2}, SR^{a2}, C(O)R^{b2}, C(O)NR^{c2}R^{d2}, C(O)OR^{a2}, OC(O)R^{b2}, OC(O)NR^{c2}R^{d2}, C(=NR^{e2})NR^{c2}R^{d2}, NR^{c2}C(=NR^{e2})NR^{c2}R^{d2}, NR^{c2}R^{d2}, NR^{c2}C(O)R^{b2}, NR^{c2}C(O)OR^{a2},

- ili bilo koji R^{c4} i R^{d4} vezani za isti N atom, zajedno s N atomom za koji su vezani, formiraju 4-, 5-, 6-ili 7-članu heterocikloalkil grupu opcionalno supstituiranu s 1, 2 ili 3 supstituenta neovisno izabranih od C_{1-6} alkil, C_{3-7} cikloalkil, 3-7 -članih heterocikloalkil, C_{6-10} aril, 5-6 -članih heteroaril, C_{1-6} haloalkil, halo, CN, OR^{a5} , SR^{a5} , $C(O)R^{b5}$, $C(O)NR^{c5}R^{d5}$, $C(O)OR^{a5}$, $OC(O)R^{b5}$, $OC(O)NR^{c5}R^{d5}$, $NR^{c5}R^{d5}$, $NR^{c5}C(O)R^{b5}$, $NR^{c5}C(O)NR^{c5}R^{d5}$, $NR^{c5}C(O)OR^{a5}$, $C(=NR^{e5})NR^{c5}R^{d5}$, $NR^{c5}C(=NR^{e5})NR^{c5}R^{d5}$, $S(O)R^{b5}$, $S(O)NR^{c5}R^{d5}$, $S(O)2R^{b5}$, $NR^{c5}S(O)2R^{b5}$, $NR^{c5}S(O)2NR^{c5}R^{d5}$ i $S(O)2NR^{c5}R^{d5}$, pri čemu spomenuti C_{1-6} alkil, C_{3-7} cikloalkil, 3-7 -članih heterocikloalkil, C_{6-10} aril, i 5-6 -članih heteroaril su opcionalno supstituirani s 1, 2 ili 3 supstituenta neovisno izabranih od halo, C_{1-4} alkil, C_{1-4} haloalkil, C_{1-4} cijanoalkil, CN, OR^{a5} , SR^{a5} , $C(O)R^{b5}$, $C(O)NR^{c5}R^{d5}$, $C(O)OR^{a5}$, $OC(O)R^{b5}$, $OC(O)NR^{c5}R^{d5}$, $NR^{c5}R^{d5}$, $NR^{c5}C(O)R^{b5}$, $NR^{c5}C(O)NR^{c5}R^{d5}$, $NR^{c5}C(O)OR^{a5}$, $C(=NR^{e5})NR^{c5}R^{d5}$, $NR^{c5}C(=NR^{e5})NR^{c5}R^{d5}$, $S(O)R^{b5}$, $S(O)NR^{c5}R^{d5}$, $S(O)2R^{b5}$, $NR^{c5}S(O)2R^{b5}$, $NR^{c5}S(O)2NR^{c5}R^{d5}$ i $S(O)2NR^{c5}R^{d5}$; svaki R^{a5} , R^{b5} , R^{c5} i R^{d5} je neovisno izabran od H, C_{1-4} alkil, C_{1-4} haloalkil, C_{2-4} alkenil i C_{2-4} alkinil, pri čemu spomenuti C_{1-4} alkil, C_{2-4} alkenil, i C_{2-4} alkinil, je opcionalno supstituiran s 1, 2 ili 3 supstituenta neovisno izabranih od OH, CN, amino, halo, C_{1-4} alkil, C_{1-4} alkoksi, C_{1-4} alkiltio, C_{1-4} alkilamino, di(C_{1-4} alkil)amino, C_{1-4} haloalkil, i C_{1-4} haloalkoksi;
- ili bilo koji R^{c5} i R^{d5} vezani za isti N atom, zajedno s N atomom za koji su vezani, formiraju 3-, 4-, 5-, 6-, ili 7-članu heterocikloalkil grupu opcionalno supstituiranu s 1, 2 ili 3 supstituenta neovisno izabranih od OH, CN, amino, halo, C_{1-6} alkil, C_{1-4} alkoksi, C_{1-4} alkiltio, C_{1-4} alkilamino, di(C_{1-4} alkil)amino, C_{1-4} haloalkil i C_{1-4} haloalkoksi; i svaki R^{e1} , R^{e2} , R^{e3} , R^{e4} i R^{e5} je neovisno izabran od H, C_{1-4} alkil i CN.

2. Spoj prema zahtjevu 1, ili njegova farmaceutska prihvatljiva sol, pri čemu je prsten B prema formuli (B-3):



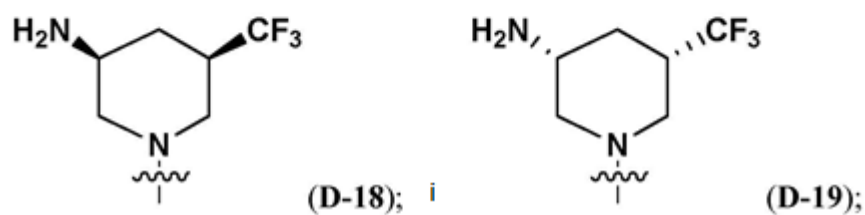
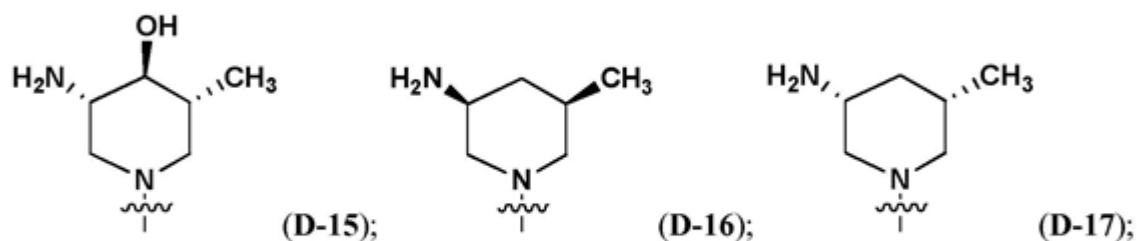
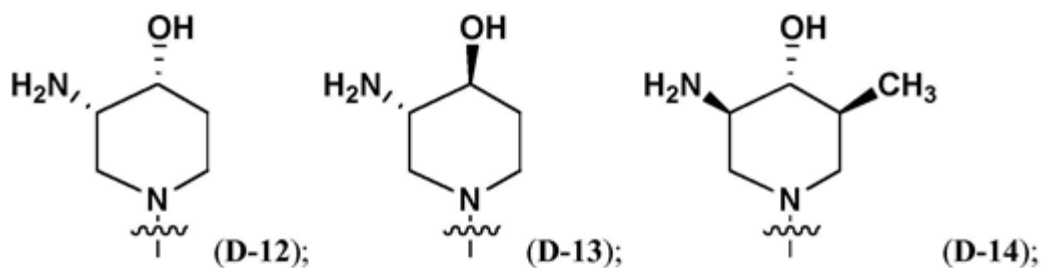
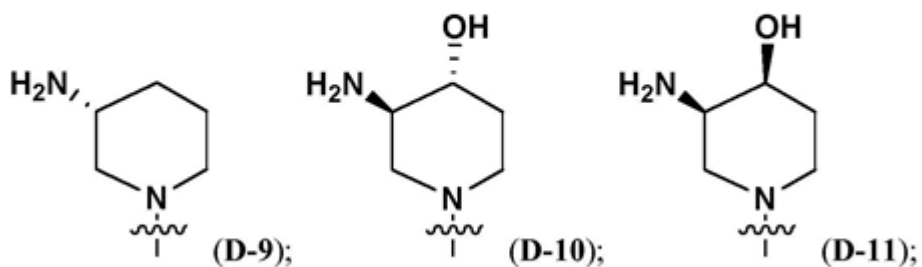
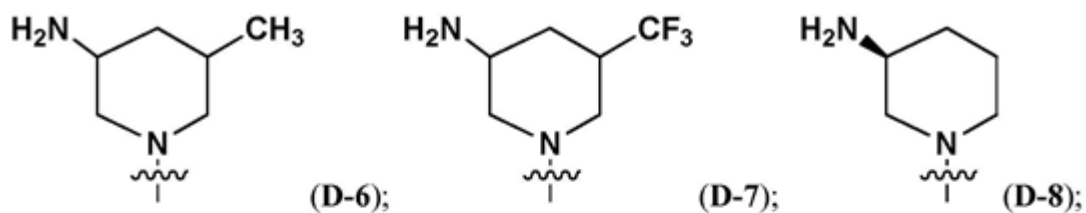
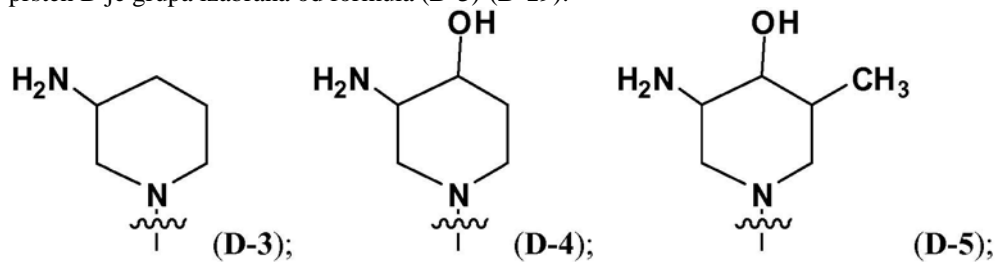
gdje je m 0, 1 ili 2.

3. Spoj prema zahtjevu 1 ili 2, ili njegova farmaceutska prihvatljiva sol, pri čemu:-
- n je 0; ili
 - n je 1.
4. Spoj prema zahtjevu 2, ili njegova farmaceutska prihvatljiva sol, pri čemu:-
- m je 0; ili
 - m je 1.
5. Spoj prema bilo kojem zahtjevu 1 do 4, ili njegova farmaceutska prihvatljiva sol, pri čemu:-
- svaki R^B je neovisno izabran od halo, C_{1-6} alkil, C_{1-6} haloalkil, CN, OR^{a1} i okso; ili
 - svaki R^B je neovisno izabran od halo, C_{1-6} alkil, C_{1-6} haloalkil, CN, i OR^{a1} ; ili
 - svaki R^B je neovisno izabran od CN, OH, metoksi i okso; ili
 - svaki R^B je neovisno izabran od CN, OH i metoksi.
6. Spoj prema bilo kojem zahtjevu 1 do 5, ili njegova farmaceutska prihvatljiva sol, pri čemu:-
- prsten B je nesupstituiran ili supstituiran s 1 supstituentom izabranim od R^B ; ili
 - prsten B je nesupstituiran.
7. Spoj prema bilo kojem zahtjevu 1 do 6, ili njegova farmaceutska prihvatljiva sol, pri čemu atom azota iz prstena D formira vezu s ostatkom molekula.
8. Spoj prema bilo kojem zahtjevu 1 do 7, ili njegova farmaceutska prihvatljiva sol, pri čemu:-
- svaki R^D je neovisno izabran od halo, C_{1-6} alkil, C_{2-6} alkenil, C_{2-6} alkinil, C_{1-6} haloalkil, CN, NO_2 , OR^{a2} , SR^{a2} , $C(O)R^{b2}$, $C(O)NR^{c2}R^{d2}$, $C(O)OR^{a2}$, $NR^{c2}R^{d2}$, $S(O)R^{b2}$, $S(O)NR^{c2}R^{d2}$, $S(O)2R^{b2}$, i $S(O)2NR^{c2}R^{d2}$; ili
 - svaki R^D je neovisno izabran od C_{1-6} alkil, OR^{a2} , i $NR^{c2}R^{d2}$.
9. Spoj prema bilo kojem zahtjevu 1 do 7, ili njegova farmaceutska prihvatljiva sol, pri čemu svaki R^D je neovisno izabran od metil, OH, i NH_2 .
10. Spoj prema zahtjevu 9, ili njegova farmaceutska prihvatljiva sol, pri čemu je prsten D piperidin-1-il prsten supstituiran u položaju 3 s amino grupom.
11. Spoj prema zahtjevu 10, ili njegova farmaceutska prihvatljiva sol, pri čemu:-
- konfiguracija atoma ugljika u položaju 3 piperidin-1-il prstena koji formira prsten D je (S); ili
 - konfiguracija atoma ugljika u položaju 3 piperidin-1-il prstena koji formira prsten D je (R).
12. Spoj prema bilo kojem zahtjevu 1 do 6, ili njegova farmaceutska prihvatljiva sol, pri čemu:-
- prsten D je (3S)-aminopiperidin-1-il, (3R,4R)-3-amino-4-hidroksipiperidinil, (3R,4S)-3-amino-4-hidroksipiperidinil, (3R,4R,5R)-3-amino-4-hidroksi-5-metilpiperidinil, (3R,4R,5S)-3-amino-4-hidroksi-5-metilpiperidinil, (3R,4S,5R)-3-amino-4-hidroksi-5-metilpiperidinil ili (3R,4S,5S)-3-amino-4-hidroksi-5-metilpiperidinil;
 - prsten D je (3R)-aminopiperidin-1-il, (3S,4S)-3-amino-4-hidroksipiperidinil, (3S,4R)-3-amino-4-hidroksipiperidinil, (3S,4R,5R)-3-amino-4-hidroksi-5-metilpiperidinil, (3S,4R,5S)-3-amino-4-hidroksi-5-

metilpiperidinil, (3*S*,4*S*,5*R*)-3-amino-4-hidroksi-5-metilpiperidinil ili (3*S*,4*S*,5*S*)-3-amino-4-hidroksi-5-metilpiperidinil.

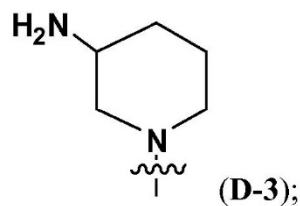
13. Spoj prema bilo kojem zahtjevu 1 do 12, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, pri čemu: -

a) prsten D je grupa izabrana od formula (D-3)-(D-19):



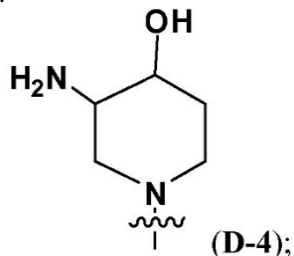
ili

b) prsten D je grupa formule (D-3):



ili

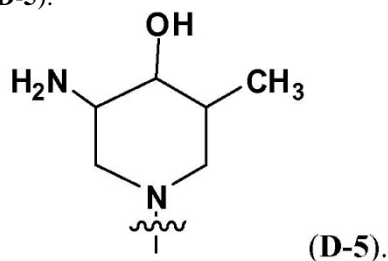
c) prsten D je grupa formule (D-4):



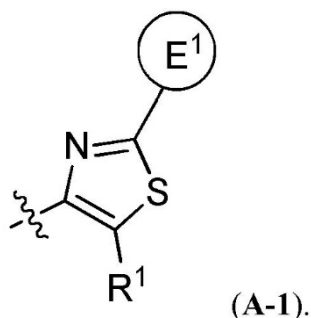
5

ili

d) prsten D je grupa formule (D-5):



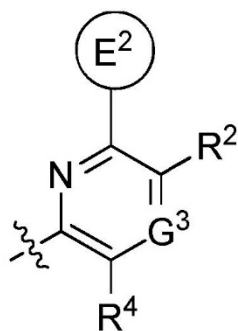
14. Spoj prema bilo kojem zahtjevu 1 do 13, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, pri čemu je prsten A prema formuli (A-1):



10

15. Spoj prema zahtjevu 14, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, pri čemu je R^1 izabran od H i NH_2 .
16. Spoj prema zahtjevu 14 ili 15, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, pri čemu je prsten E^1 fenil koji je 2,6-disupstituiran sa supstuentima neovisno izabranim od R^E .
17. Spoj prema bilo kojem zahtjevu 1 do 16, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, pri čemu je svaki R^E neovisno izabran od halo, C_{1-6} alkil, C_{1-6} haloalkil, CN, OR^{a3} , $C(O)R^{b3}$, $C(O)NR^{c3}R^{d3}$, $C(O)OR^{a5}$, $NR^{c3}R^{d3}$, $S(O)R^{b5}$, $S(O)NR^{c3}R^{d3}$, $S(O)_2R^{b5}$, i $S(O)_2NR^{c3}R^{d3}$.
18. Spoj prema zahtjevu 17, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, pri čemu je svaki R^E neovisno izabran od halo.
19. Spoj prema zahtjevu 18, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, pri čemu:-
- prsten E^1 je fenil koji je 2,6-dihalo-supstituiran; ili
 - prsten E^1 je 2,6-difluorofenil.
20. Spoj prema bilo kojem zahtjevu 1 do 13, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, pri čemu:-
- G^3 je CR^3 ; ili
 - G^3 je N.
21. Spoj prema bilo kojem zahtjevu 1 do 13 i 20, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, pri čemu prsten A je formula (A-2):

25

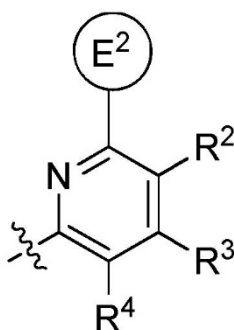


(A-2).

22. Spoj prema zahtjevu 21, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, pri čemu:-

- a) G³ je CR³; ili
- b) G³ je N.

23. Spoj prema bilo kojem zahtjevu 1 do 13 i 20 do 22, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, pri čemu je prsten A formula (A-2a):



(A-2a).

24. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 20 do 23, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, pri čemu:-

- a) R² je H ili halogen; ili
- b) R² je F.

25. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 20 do 24, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, pri čemu R³ je H.

26. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 20 do 25, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, pri čemu R⁴ je izabran od H i NH₂.

27. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 20 do 26, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, pri čemu je prsten E² fenil koji je 2,6-disupstituiran sa supstitutima neovisno izabranim od R^E.

28. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 20 do 27, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, pri čemu svaki R^E je neovisno izabran od halo, C₁₋₆ alkil, C₁₋₆ haloalkil, CN, OR^{a3}, C(O)R^{b3}, C(O)NR^{c3}R^{d3}, C(O)OR^{a3}, NR^{c3}R^{d3}, S(O)R^{b3}, S(O)NR^{c3}R^{d3}, S(O)₂R^{b3}, i S(O)₂NR^{c3}R^{d3}.

29. Spoj prema zahtjevu 28, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, pri čemu svaki R^E je neovisno izabran od halo.

30. Spoj prema zahtjevu 29, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, pri čemu:-

- a) prsten E² je fenil koji je 2,6-dihalo-supstituiran; ili
- b) prsten E² je 2,6-difluorofenil.

31. Spoj prema bilo kojem zahtjevu 1 do 30, pri čemu:-

- a) R^{a1}, R^{b1}, R^{c1}, R^{d1}, R^{a2}, R^{b2}, R^{c2}, R^{d2}, R^{a3}, R^{b3}, R^{c3} i R^{d3} su svaki neovisno H ili C₁₋₆ alkil; i/ili
- b) R^{a4}, R^{b4}, R^{c4} i R^{d4} su svaki neovisno H ili C₁₋₆ alkil; i/ili
- c) R^{a5}, R^{b5}, R^{c5} i R^{d5} su svaki neovisno H ili C₁₋₆ alkil.

32. Spoj prema bilo kojem zahtjevu 1 do 31, pri čemu:-

- a) R^{e1}, R^{e2}, R^{e3}, R^{e4} i R^{e5} su svaki neovisno H ili C₁₋₆ alkil; ili
- b) R^{e1}, R^{e2}, R^{e3}, R^{e4} i R^{e5} su svaki H.

33. Spoj prema zahtjevu 1 :-

- a) izabran od sljedećih spojeva, ili njihovih farmaceutski prihvatljivih soli:

N-{4-[3-aminopiperidin-1-il]-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-2-(2,6-difluorofenil)-1,3-tiazol-4-karboksamid;

5-amino-*N*-{4-[3-aminopiperidin-1-il]-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-2-(2,6-difluorofenil)-1,3-tiazol-4-karboksamid;

5-amino-*N*-{4-[3-aminopiperidin-1-il]-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-2-(2,6-difluorofenil)-1,3-tiazol-4-karboksamid;

N-{4-[3-aminopiperidin-1-il]-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-2-(2,6-difluorofenil)-1,3-tiazol-4-karboksamid;

5-amino-*N*-{4-[3-aminopiperidin-1-il]-7-metoksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-2-(2,6-difluorofenil)-1,3-tiazol-4-karboksamid;

N-{4-[3-amino-5-metilpiperidin-1-il]-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-[2,6-difluoro-4-(1-hidroksi-1-metiletil)fenil]-5-fluoropiridin-2-karboksamid
N-{4-[3-amino-5-ciklopropil-4-hidroksipiperidin-1-il]-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-(2,6-difluorofenil)-5-fluoropiridin-2-karboksamid
5 *N*-{4-[3-amino-5-metilpiperidin-1-il]-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-[2,6-difluoro-4-(tetrahidro-2*H*-piran-3-iloksi)fenil]-5-fluoropiridin-2-karboksamid
N-{4-[3-amino-5-(trifluorometil)piperidin-1-il]-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-[2,6-difluoro-4-(1-hidroksi-1-metiletil)fenil]-5-fluoropiridin-2-karboksamid;

ili

b) izabran od sljedećih spojeva, ili njihovih farmaceutski prihvatljivih soli:

N-(4-[(3*S*)-3-aminopiperidin-1-il]-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il)-2-(2,6-difluorofenil)-1,3-tiazol-4-karboksamid;
5-amino-*N*-{4-[(3*S*)-3-aminopiperidin-1-il]-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-2-(2,6-difluorofenil)-1,3-tiazol-4-karboksamid;
15 5-amino-*N*-{4-[(3*S*)-3-aminopiperidin-1-il]-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-2-(2,6-difluorofenil)-1,3-tiazol-4-karboksamid;
5-amino-*N*-{4-[(3*S*)-3-aminopiperidin-1-il]-(7*R*)-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-2-(2,6-difluorofenil)-1,3-tiazol-4-karboksamid;
5-amino-*N*-{4-[(3*S*)-3-aminopiperidin-1-il]-(7*S*)-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-2-(2,6-difluorofenil)-1,3-tiazol-4-karboksamid;
20 *N*-{4-[(3*S*)-3-aminopiperidin-1-il]-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-2-(2,6-difluorofenil)-1,3-tiazol-4-karboksamid;
N-{4-[(3*S*)-3-aminopiperidin-1-il]-(7*R*)-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-2-(2,6-difluorofenil)-1,3-tiazol-4-karboksamid;
25 *N*-{4-[(3*S*)-3-aminopiperidin-1-il]-(7*S*)-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-2-(2,6-difluorofenil)-1,3-tiazol-4-karboksamid;
5-amino-*N*-{4-[(3*S*)-3-aminopiperidin-1-il]-7-metoksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-2-(2,6-difluorofenil)-1,3-tiazol-4-karboksamid;
5-amino-*N*-{4-[(3*S*)-3-aminopiperidin-1-il]-(7*R*)-7-metoksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-2-(2,6-difluorofenil)-1,3-tiazol-4-karboksamid;
30 5-amino-*N*-{4-[(3*S*)-3-aminopiperidin-1-il]-(7*S*)-7-metoksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-2-(2,6-difluorofenil)-1,3-tiazol-4-karboksamid;
5-amino-*N*-{4-[(3*S*)-3-aminopiperidin-1-il]-7-cijano-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-2-(2,6-difluorofenil)-1,3-tiazol-4-karboksamid;
35 5-amino-*N*-{4-[(3*S*)-3-aminopiperidin-1-il]-(7*R*)-7-cijano-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-2-(2,6-difluorofenil)-1,3-tiazol-4-karboksamid;
5-amino-*N*-{4-[(3*S*)-3-aminopiperidin-1-il]-(7*S*)-7-cijano-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-2-(2,6-difluorofenil)-1,3-tiazol-4-karboksamid;
40 5-amino-*N*-{4-[(3*S*)-3-aminopiperidin-1-il]-7-hidroksi-7-metil-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-2-(2,6-difluorofenil)-1,3-tiazol-4-karboksamid;
5-amino-*N*-{4-[(3*S*)-3-aminopiperidin-1-il]-(7*R*)-7-hidroksi-7-metil-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-2-(2,6-difluorofenil)-1,3-tiazol-4-karboksamid;
5-amino-*N*-{4-[(3*S*)-3-aminopiperidin-1-il]-(7*S*)-7-hidroksi-7-metil-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-2-(2,6-difluorofenil)-1,3-tiazol-4-karboksamid;
45 5-amino-*N*-{4-[(3*S*)-3-aminopiperidin-1-il]-7-okso-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-2-(2,6-difluorofenil)-1,3-tiazol-4-karboksamid;
N-{4-[(3*S*)-3-aminopiperidin-1-il]-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-(2,6-difluorofenil)-5-fluoropiridin-2-karboksamid;
50 *N*-{4-[(3*S*)-3-aminopiperidin-1-il]-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-(2,6-difluorofenil)-5-fluoropiridin-2-karboksamid;
N-{4-[(3*S*)-3-aminopiperidin-1-il]-(7*R*)-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-(2,6-difluorofenil)-5-fluoropiridin-2-karboksamid;
N-{4-[(3*S*)-3-aminopiperidin-1-il]-(7*S*)-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-(2,6-difluorofenil)-5-fluoropiridin-2-karboksamid;
55 3-amino-*N*-{4-[(3*S*)-3-aminopiperidin-1-il]-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-(2,6-difluorofenil)-5-fluoropiridin-2-karboksamid;
3-amino-*N*-{4-[(3*S*)-3-aminopiperidin-1-il]-(7*R*)-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-(2,6-difluorofenil)-5-fluoropiridin-2-karboksamid;
3-amino-*N*-{4-[(3*S*)-3-aminopiperidin-1-il]-(7*S*)-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-(2,6-difluorofenil)-5-fluoropiridin-2-karboksamid;
60 5-amino-*N*-{4-[(3*R*,4*R*)-3-amino-4-hidroksipiperidin-1-il]-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-2-(2,6-difluorofenil)-1,3-tiazol-4-karboksamid;

- N*-{4-[(3*R*,4*R*,5*S*)-3-amino-4-hidroksi-4,5-dimetilpiperidin-1-il]-(7*S*)-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-(2,6-difluorofenil)-5-fluoropiridin-2-karboksamid;
- N*-{4-[(3*R*,4*S*,5*S*)-3-amino-4-hidroksi-4,5-dimetilpiperidin-1-il]-(7*S*)-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-(2,6-difluorofenil)-5-fluoropiridin-2-karboksamid;
- 5 *N*-{4-[(3*S*,5*R*)-3-amino-5-metilpiperidin-1-il]-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-[2,6-difluoro-4-(metoksimetil)fenil]-5-fluoropiridin-2-karboksamid;
- N*-{4-[(3*S*,5*R*)-3-amino-5-metilpiperidin-1-il]-(7*R*)-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-[2,6-difluoro-4-(metoksimetil)fenil]-5-fluoropiridin-2-karboksamid;
- 10 *N*-{4-[(3*S*,5*R*)-3-amino-5-metilpiperidin-1-il]-(7*S*)-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-[2,6-difluoro-4-(metoksimetil)fenil]-5-fluoropiridin-2-karboksamid;
- N*-{4-[(3*R*,4*R*,5*S*)-3-amino-4-hidroksi-5-metilpiperidin-1-il]-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-[2,6-difluoro-4-(metoksimetil)fenil]-5-fluoropiridin-2-karboksamid;
- N*-{4-[(3*R*,4*R*,5*S*)-3-amino-4-hidroksi-5-metilpiperidin-1-il]-(7*R*)-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-[2,6-difluoro-4-(metoksimetil)fenil]-5-fluoropiridin-2-karboksamid;
- 15 *N*-{4-[(3*R*,4*R*,5*S*)-3-amino-4-hidroksi-5-metilpiperidin-1-il]-(7*S*)-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-[2,6-difluoro-4-(metoksimetil)fenil]-5-fluoropiridin-2-karboksamid;
- N*-{4-[(3*S*,5*R*)-3-amino-5-metilpiperidin-1-il]-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-[2,6-difluoro-4-(1-hidroksi-1-metiletil)fenil]-5-fluoropiridin-2-karboksamid;
- N*-{4-[(3*S*,5*R*)-3-amino-5-metilpiperidin-1-il]-(7*R*)-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-[2,6-difluoro-4-(1-hidroksi-1-metiletil)fenil]-5-fluoropiridin-2-karboksamid;
- 20 *N*-{4-[(3*S*,5*R*)-3-amino-5-metilpiperidin-1-il]-(7*S*)-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-[2,6-difluoro-4-(1-hidroksi-1-metiletil)fenil]-5-fluoropiridin-2-karboksamid;
- N*-{4-[(3*R*,4*R*,5*S*)-3-amino-5-ciklopropil-4-hidroksipiperidin-1-il]-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-(2,6-difluorofenil)-5-fluoropiridin-2-karboksamid;
- 25 *N*-{4-[(3*R*,4*R*,5*S*)-3-amino-5-ciklopropil-4-hidroksipiperidin-1-il]-(7*R*)-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-(2,6-difluorofenil)-5-fluoropiridin-2-karboksamid;
- N*-{4-[(3*R*,4*R*,5*S*)-3-amino-5-ciklopropil-4-hidroksipiperidin-1-il]-(7*S*)-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-(2,6-difluorofenil)-5-fluoropiridin-2-karboksamid;
- N*-{4-[(3*S*,5*R*)-3-amino-5-metilpiperidin-1-il]-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-[2,6-difluoro-4-(tetrahidro-2*H*-piran-3-iloksi)fenil]-5-fluoropiridin-2-karboksamid;
- 30 *N*-{4-[(3*S*,5*R*)-3-amino-5-metilpiperidin-1-il]-(7*R*)-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-[2,6-difluoro-4-(tetrahidro-2*H*-piran-3-iloksi)fenil]-5-fluoropiridin-2-karboksamid;
- N*-{4-[(3*S*,5*R*)-3-amino-5-metilpiperidin-1-il]-(7*S*)-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-[2,6-difluoro-4-(tetrahidro-2*H*-piran-3-iloksi)fenil]-5-fluoropiridin-2-karboksamid;
- 35 *N*-{4-[(3*S*,5*R*)-3-amino-5-(trifluorometil)piperidin-1-il]-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-[2,6-difluoro-4-(1-hidroksi-1-metiletil)fenil]-5-fluoropiridin-2-karboksamid;
- N*-{4-[(3*S*,5*R*)-3-amino-5-(trifluorometil)piperidin-1-il]-(7*R*)-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-[2,6-difluoro-4-(1-hidroksi-1-metiletil)fenil]-5-fluoropiridin-2-karboksamid; i
- 40 *N*-{4-[(3*S*,5*R*)-3-amino-5-(trifluorometil)piperidin-1-il]-(7*S*)-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-[2,6-difluoro-4-(1-hidroksi-1-metiletil)fenil]-5-fluoropiridin-2-karboksamid.
34. Spoj prema zahtjevu 1, pri čemu je spoj *N*-{4-[3-amino-4-hidroksi-5-metilpiperidin-1-il]-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-(2,6-difluorofenil)-5-fluoropiridin-2-karboksamid ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.
35. Spoj prema zahtjevu 1, pri čemu je spoj *N*-{4-[(3*R*,4*R*,5*S*)-3-amino-4-hidroksi-5-metilpiperidin-1-il]-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-(2,6-difluorofenil)-5-fluoropiridin-2-karboksamid ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.
- 45 36. Spoj prema zahtjevu 1, pri čemu je spoj *N*-{4-[(3*R*,4*R*,5*S*,7*R*)-3-amino-4-hidroksi-5-metilpiperidin-1-il]-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-(2,6-difluorofenil)-5-fluoropiridin-2-karboksamid ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.
37. Spoj prema zahtjevu 1, pri čemu je spoj *N*-{4-[(3*R*,4*R*,5*S*,7*S*)-3-amino-4-hidroksi-5-metilpiperidin-1-il]-7-hidroksi-6,7-dihidro-5*H*-ciklopenta[*b*]piridin-3-il}-6-(2,6-difluorofenil)-5-fluoropiridin-2-karboksamid ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.
38. Sastav koji sadrži spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 37, ili njegovu farmaceutski prihvatljivu sol, i najmanje jedan farmaceutski prihvatljiv nosač.
- 55 39. Postupak inhibiranja Pim1, Pim2, ili Pim3 enzima koji obuhvaća kontakt enzima *in vitro* sa spojem prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 37, ili njegovom farmaceutski prihvatljivom soli.
40. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 37, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, za upotrebu u postupku liječenja bolesti ili stanja koje je povezano s povišenom razinom izražavanja ili aktivnosti najmanje jednog od Pim1, Pim2 i Pim3.
- 60 41. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 37, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, za upotrebu u postupku liječenja karcinoma.
42. Spoj, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, za upotrebu prema zahtjevu 41, pri čemu:-

- a) karcinom je karcinom gdje je izražavanje ili aktivnost najmanje jednog od Pim1, Pim2 i Pim3 ushodno regulirana; i/ili
- b) karcinom je karcinom gdje se aktivira onkogen; i/ili
- 5 c) karcinom je karcinom gdje se aktivira Myc ili BCL2; i/ili
- d) karcinom je čvrsti tumor ili hematološki karcinom; i/ili
- e) karcinom je karcinom prostate, karcinom debelog crijeva, karcinom jednjaka, karcinom endometrija, karcinom jajnika, karcinom materice, karcinom bubrega, karcinom jetre, karcinom gušterače, karcinom želuca, karcinom dojke, karcinom pluća, karcinom glave ili vrata, karcinom štitnjače, glioblastom, sarkom, karcinom mokraćnog mjehura, limfom, leukemija, akutna limfoblastna leukemija, akutna mijelogeni leukemija, kronična limfocitna leukemija, kronična mijelogeni leukemija, difuzni limfom velikih B stanica, limfom stanica plašta, ne-Hodgkinov limfom, Hodgkinov limfom ili multipli mijelom; ili
- 10 f) karcinom je karcinom prostate, karcinom gušterače, akutna mijelogeni leukemija, difuzni limfom velikih B stanica ili multipli mijelom; ili
- g) karcinom je karcinom prostate; ili
- 15 h) karcinom je karcinom gušterače; ili
- i) karcinom je akutna mijelogeni leukemija; ili
- j) karcinom je difuzni limfom velikih B stanica; ili
- k) karcinom je multipli mijelom.
43. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 37, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, za upotrebu u:-
- 20 a) postupku liječenja mijeloproliferativnog poremećaja; ili
- b) postupku liječenja mijeloproliferativnog poremećaja, pri čemu je mijeloproliferativni poremećaj policitemija vera, esencijalna trombocitemija, kronična mijelogeni leukemija, mijelofibroza, primarna mijelofibroza, mijelofibroza s mijeloidnom metaplazijom, mijelofibroza nakon policitemije vere/esencijalne trombocitemije, mijelofibroza nakon esencijalne trombocitemije ili mijelofibroza nakon policitemije vere.
- 25 44. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 37, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, za upotrebu u:-
- a) postupku liječenja imunološkog poremećaja; ili
- b) postupku liječenja imunološkog poremećaja, pri čemu je imunološki poremećaj autoimuna bolest; ili
- 30 c) postupku liječenja imunološkog poremećaja, pri čemu je imunološki poremećaj multipla skleroza, reumatoidni artritis, alergija, alergija na hranu, astma, lupus, upalna bolest crijeva ili ulcerozni kolitis, Crohnova bolest, sindrom iritabilnog crijeva, pankreatitis, divertikuloza, Gravesova bolest, dječji reumatoidni artritis, osteoartritis, psorijazni artritis, ankilozantni spondilitis, miastenija gravis, vaskulitis, autoimuni tireoiditis, dermatitis, psorijaza, skleroderma, sistemska skleroza, vitiligo, bolest "presatka protiv primatelja ", Sjogrenov sindrom, glomerulonefritis, ili dijabetes melitus tip 1.
45. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 37, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, za upotrebu u postupku liječenja ateroskleroze.
- 35 46. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 37, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, za upotrebu u postupku smanjenja angiogeneze ili metastaza tumora.
47. Spoj prema zahtjevu 36, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, za upotrebu u postupku liječenja karcinoma, pri čemu je karcinom akutna mijelogeni leukemija.
- 40 48. Spoj prema zahtjevu 36, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, za upotrebu u postupku liječenja karcinoma, pri čemu je karcinom difuzni limfom velikih B stanica.
49. Spoj prema zahtjevu 36, ili njegova farmaceutske prihvatljiva sol, za upotrebu u postupku liječenja karcinoma, pri čemu je karcinom mijelofibroza.