



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3083627 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

C07D 487/04 (2006.01) A61P 33/02 (2006.01)

A61K 31/519 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2019.02.04
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.09.05
(86)	European Application Nr.	14825046.7
(86)	European Filing Date	2014.12.18
(87)	The European Application's Publication Date	2016.10.26
(30)	Priority	2013.12.19, US, 201361918089 P
(84)	Designated Contracting States:	AL ; AT ; BE ; BG ; CH ; CY ; CZ ; DE ; DK ; EE ; ES ; FI ; FR ; GB ; GR ; HR ; HU ; IE ; IS ; IT ; LI ; LT ; LU ; LV ; MC ; MK ; MT ; NL ; NO ; PL ; PT ; RO ; RS ; SE ; SI ; SK ; SM ; TR
	Designated Extension States:	BA
(73)	Proprietor	Novartis AG, Lichtstrasse 35, 4056 Basel, Sveits
(72)	Inventor	BIGGART, Agnes, Novartis Institute for Functional Genomics Inc. dba Genomics Institute of the Novartis Research Foundation 10675 John Jay Hopkins Drive, San Diego, California 92121, USA LIANG, Fang, Novartis Institute for Functional Genomics Inc. dba Genomics Institute of the Novartis Research Foundation 10675 John Jay Hopkins Drive, San Diego, California 92121, USA MATHISON, Casey Jacob Nelson, Novartis Institute for Functional Genomics Inc. dba Genomics Institute of the Novartis Research Foundation 10675 John Jay Hopkins Drive, San Diego, California 92121, USA MOLTENI, Valentina, Novartis Institute for Functional Genomics Inc. dba Genomics Institute of the Novartis Research Foundation 10675 John Jay Hopkins Drive, San Diego, California 92121, USA NAGLE, Advait Suresh, Novartis Institute for Functional Genomics Inc. dba Genomics Institute of the Novartis Research Foundation 10675 John Jay Hopkins Drive, San Diego, California 92121, USA SUPEK, Frantisek, Novartis Institute for Functional Genomics Inc. dba Genomics Institute of the Novartis Research Foundation 10675 John Jay Hopkins Drive, San Diego, California 92121, USA YEH, Vince, Novartis Institute for Functional Genomics Inc. dba Genomics Institute of the Novartis Research Foundation 10675 John Jay Hopkins Drive, San Diego, California 92121, USA
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

(54)	Title	[1,2,4]TRIAZOLO[1,5-A]PYRIMIDINE DERIVATIVES AS PROTOZOAN PROTEASOME INHIBITORS FOR THE TREATMENT OF PARASITIC DISEASES SUCH AS LEISHMANIASIS
------	-------	--

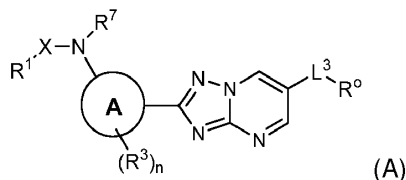
(56) References

Cited: NOVINSON T ET AL: "NOVEL HETEROCYCLIC NITROFURFURAL HYDRAZONES. IN VIVO ANTITRYPANOSOMAL ACTIVITY", JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, AMERICAN CHEMICAL SOCIETY, US, vol. 19, no. 4, 1 January 1976 (1976-01-01), pages 512-516, XP002030876, ISSN: 0022-2623, DOI: 10.1021/JM00226A013, WO-A1-2014/151784, WO-A1-98/10779

Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters concerning the validity of the patent, language of the application/patent granted at the EPO will be used as the basis for the decision. The patent documents published by the EPO are available through Espacenet (<http://worldwide.espacenet.com>) or via the search engine on our website here: <https://search.patentstyret.no/>

Patentkrav

1. Forbindelse med formel (A):



eller et farmasøytisk akseptabelt salt, eller stereoisomer derav; hvori ring A er fenyl eller pyridyl;

X er -C(O)- eller -S(O)₂-;

R¹ er valgt blant nitro, C₁₋₆alkyl, C₁₋₆alkoksy, amino, C₁₋₆alkylamino, di-C₁₋₆alkylamino, -N(C₂H₅)₂, C₃₋₆sykloalkyl, C₄₋₆heterosykloalkyl, C₄₋₈heterosykloalkenyl, og C₅₋₉heteroaryl, hvori C₁₋₆alkoksyet, C₁₋₆alkylaminoet, C₃₋₆sykloalkylet, C₄₋₆heterosykloalkylet, C₄₋₈heterosykloalkenylet, eller C₅₋₉heteroarylet til R¹ er usubstituert eller substituert av 1 til 2 substituenten uavhengig valgt blant halogen, cyano, C₁₋₄alkyl, halogenC₁₋₄alkyl, C₁₋₄alkoksy, amino, C₁₋₄alkylamino, diC₁₋₄alkylamino, hydroksykarbonyl, og

C₁₋₄alkylkarbonyl;

R³ er valgt blant hydrogen, halogen, cyano, C₁₋₄alkyl, og halogenC₁₋₄alkyl, og n er 0, 1 eller 2;

R⁷ er valgt blant hydrogen eller C₁₋₄alkyl;

L³ er en binding, fenylene eller C₅₋₆heteroarylen;

R⁰ er valgt blant hydrogen, hydroksyl, halogen, nitro, -N=CHN(CH₃)₂, C₁₋₄alkyl, C₄₋₆heterosykloalkylC₁₋₄alkyl, C₁₋₄alkoksy, -NR^{2a}R^{2b}, -NR⁵C(O)R⁶, -NR⁵S(O)₂R⁸, -Si(CH₃)₃, C₃₋₆sykloalkyl, C₅₋₆sykloalkenyl, C₄₋₆heterosykloalkyl, C₅₋₈heterosykloalkenyl, C₆₋₁₀aryl og C₅₋₆heteroaryl; hvori

C₁₋₄alkylet eller C₁₋₄alkoksyet av R⁰ er usubstituert eller substituert av 1-2 substituenten uavhengig valgt blant C₁₋₄alkoksy, amino, fenyl og C₅₋₆heteroaryl; hvori fenyl- eller C₅₋₆heteroarylsubstituenten til R⁰ er usubstituert eller videre substituert av halogen eller C₁₋₄alkyl;

C₃₋₆sykloalkylet, C₅₋₆sykloalkenylet, C₄₋₆heterosykloalkylet, C₅₋₈heterosykloalkenylet, C₆₋₁₀arylet, eller C₅₋₆heteroarylet til R⁰ er usubstituert eller substituert av 1 til 4

substituenten uavhengig valgt blant halogen, okso, C₁₋₄alkyl, hydroksyC₁₋₄alkyl, halogenC₁₋₄alkyl, -(CH₂)₁₋₄NR^aR^b, C₄₋₆heterosykloalkylC₁₋₄alkyl, benzyl, C₁₋₄alkoksy, amino, C₁₋₄alkylamino, diC₁₋₄alkylamino, usubstituert C₄₋₆heterosykloalkyl og C₁₋₄alkylsubstituert C₄₋₆heterosykloalkyl, hvori R^a og R^b hver er uavhengig valgt blant hydrogen, C₁₋₄alkyl, og C₃₋₆sykloalkyl;

R^{2a} er hydrogen eller C₁₋₄alkyl;

R^{2b} er valgt blant hydrogen, C₁₋₄alkyl og -C(O)OCH(CH₃)₂, hvori C₁₋₄alkylet til R^{2b} er usubstituert eller substituert av amino, C₄₋₆heterosykloalkyl, fenyl eller C₅₋₆heteroaryl, hvori C₄₋₆heterosykloalkyl-, fenyl- eller C₅₋₆heteroarylsubstituenten til R^{2b} er usubstituert eller substituert av hydroksyl, halogen eller C₁₋₄alkyl;

5 R⁵ er hydrogen eller C₁₋₄alkyl;

R⁶ er valgt blant hydrogen, C₁₋₄alkyl, C₁₋₄alkoksy, C₃₋₆sykloalkyloksy, amino, C₃₋₆sykloalkyl, C₅₋₆heterosykloalkyl, og C₅₋₆heteroaryl, hvori C₁₋₄alkylet, C₁₋₄alkoksyet, C₃₋₆sykloalkyloksyet, eller aminoet til R⁶ er usubstituert eller substituert av 1 til 2 substituenten uavhengig valgt blant halogen, hydroksyl, C₁₋₄alkyl,

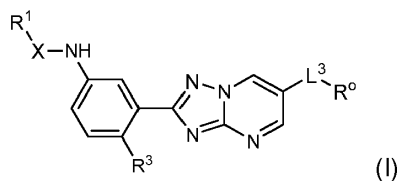
10 halogenC₁₋₄alkyl, C₁₋₄alkoksy, -NR^{9a}R^{9b}, C₃₋₆sykloalkyl, C₅₋₆heterosykloalkyl, og C₅₋₆heteroaryl, hvori R^{9a} er hydrogen eller C₁₋₄alkyl, R^{9b} er valgt blant hydrogen, C₁₋₄alkyl, C₁₋₄alkylkarbonyl og C₁₋₄alkoksykarbonyl, og C₅₋₆heterosykloalkyl- eller C₅₋₆heteroarylsubstituenten til R⁶ hver er usubstituert eller substituert av 1-2

substituenten uavhengig valgt blant hydroksyl, C₁₋₄alkyl og C₁₋₄alkoksykarbonyl,

15 C₃₋₆sykloalkylet eller C₅₋₆heterosykloalkylet til R⁶ er usubstituert eller substituert av 1 til 2 substituenten uavhengig valgt blant halogen, cyano, hydroksyl, C₁₋₄alkyl, halogenC₁₋₄alkyl, C₁₋₄alkoksyC₁₋₄alkyl, C₁₋₄alkoksy, amino, C₁₋₄alkylamino, di-C₁₋₄alkylamino, aminokarbonyl, C₁₋₄alkoksykarbonyl, og C₁₋₄alkoksykarbonylaminoC₁₋₄alkyl, og

20 C₅₋₆heteroarylet til R⁶ er usubstituert eller substituert av 1 til 2 substituenten uavhengig valgt blant hydroksyl, C₁₋₄alkyl, C₁₋₄alkoksy, amino, C₁₋₄alkylamino, di-C₁₋₄alkylamino, og C₁₋₄alkoksykarbonyl; og R⁸ er C₁₋₄alkyl eller C₁₋₄alkylamino.

2. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori forbindelsen er av formel (I):



25

eller et farmasøytisk akseptabelt salt, eller stereoisomer derav; hvori

X er -C(O)- eller -S(O)₂-;

R¹ er valgt blant nitro, C₁₋₄alkyl, C₁₋₆alkoksy, amino, C₁₋₆alkylamino, di-C₁₋₆alkylamino, -N(C₂H₅)₂, C₃₋₆sykloalkyl, C₄₋₆heterosykloalkyl, C₄₋₈heterosykloalkenyl, og C₅₋₉heteroaryl,

30 hvori C₁₋₆alkoksyet, C₁₋₆alkylaminoet, C₃₋₆sykloalkylet, C₄₋₆heterosykloalkylet, C₄₋₈heterosykloalkenylet, eller C₅₋₉heteroarylet til R¹ er usubstituert eller substituert av 1 til 2 substituenten uavhengig valgt blant halogen, cyano, C₁₋₄alkyl, halogenC₁₋₄alkyl, C₁₋₄alkoksy, amino, C₁₋₄alkylamino, diC₁₋₄alkylamino, hydroksykarbonyl, og C₁₋₄alkylkarbonyl;

35 R³ er valgt blant hydrogen, halogen, cyano, C₁₋₄alkyl, og halogenC₁₋₄alkyl;

L³ er en binding, fenylen eller C₅₋₆heteroarylen;

R⁰ er valgt blant hydrogen, hydroksyl, halogen, nitro, -N=CHN(CH₃)₂, C₁₋₄alkyl, C₄₋₆heterosykloalkyl, C₁₋₄alkyl, C₁₋₄alkoksy, -NR^{2a}R^{2b}, -NR⁵C(O)R⁶, -NR⁵S(O)₂R⁸, -Si(CH₃)₃, C₃₋₆sykloalkyl, C₅₋₆sykloalkenyl, C₄₋₆heterosykloalkyl, C₅₋₆heterosykloalkenyl, C₆₋₁₀aryl og C₅₋₆heteroaryl; hvori

C₁₋₄alkylet eller C₁₋₄alkoksyet av R⁰ er usubstituert eller substituert av 1-2 substituenten uavhengig valgt blant C₁₋₄alkoksy, amino, fenyl og C₅₋₆heteroaryl; hvori fenyl- eller C₅₋₆heteroarylsubstituenten til R⁰ er usubstituert eller videre substituert av halogen eller C₁₋₄alkyl;

C₃₋₆sykloalkylet, C₅₋₆sykloalkenylet, C₄₋₆heterosykloalkylet, C₅₋₆heterosykloalkenylet, C₆₋₁₀arylet, eller C₅₋₆heteroarylet til R⁰ er usubstituert eller substituert av 1 til 4 substituenten uavhengig valgt blant halogen, okso, C₁₋₄alkyl, hydroksyC₁₋₄alkyl, halogenC₁₋₄alkyl, -(CH₂)₁₋₄NR^aR^b, C₄₋₆heterosykloalkyl, C₁₋₄alkyl, benzyl, C₁₋₄alkoksy, amino, C₁₋₄alkylamino, diC₁₋₄alkylamino, usubstituert C₄₋₆heterosykloalkyl og

C₁₋₄alkylsubstituert C₄₋₆heterosykloalkyl, hvori R^a og R^b hver er uavhengig valgt blant hydrogen, C₁₋₄alkyl, og C₃₋₆sykloalkyl;

R^{2a} er hydrogen eller C₁₋₄alkyl;

R^{2b} er valgt blant hydrogen, C₁₋₄alkyl og -C(O)OCH(CH₃)₂, hvori C₁₋₄alkylet til R^{2b} er usubstituert eller substituert av amino, C₄₋₆heterosykloalkyl, fenyl eller C₅₋₆heteroaryl,

hvori C₄₋₆heterosykloalkyl-, fenyl- eller C₅₋₆heteroarylsubstituenten til R^{2b} er usubstituert eller substituert av hydroksyl, halogen eller C₁₋₄alkyl;

R⁵ er hydrogen eller C₁₋₄alkyl;

R⁶ er valgt blant hydrogen, C₁₋₄alkyl, C₁₋₄alkoksy, C₃₋₆sykloalkyloksy, amino, C₃₋₆sykloalkyl, C₅₋₆heterosykloalkyl, og C₅₋₆heteroaryl, hvori

C₁₋₄alkylet, C₁₋₄alkoksyet, C₃₋₆sykloalkyloksyet, eller aminoet til R⁶ er usubstituert eller substituert av 1 til 2 substituenten uavhengig valgt blant halogen, hydroksyl, C₁₋₄alkyl, halogenC₁₋₄alkyl, C₁₋₄alkoksy, -NR^{9a}R^{9b}, C₃₋₆sykloalkyl, C₅₋₆heterosykloalkyl, og C₅₋₆heteroaryl, hvori R^{9a} er hydrogen eller C₁₋₄alkyl, R^{9b} er valgt blant hydrogen, C₁₋₄alkyl, C₁₋₄alkylkarbonyl og C₁₋₄alkoksykarbonyl, og C₅₋₆heterosykloalkyl- eller

C₅₋₆heteroarylsubstituenten til R⁶ hver er usubstituert eller substituert av 1-2 substituenten uavhengig valgt blant hydroksyl, C₁₋₄alkyl og C₁₋₄alkoksykarbonyl, C₃₋₆sykloalkylet eller C₅₋₆heterosykloalkylet til R⁶ er usubstituert eller substituert av 1 til 2 substituenten uavhengig valgt blant halogen, cyano, hydroksyl, C₁₋₄alkyl, halogenC₁₋₄alkyl, C₁₋₄alkoksy, C₁₋₄alkyl, C₁₋₄alkoksy, amino, C₁₋₄alkylamino, di-C₁₋₄alkylamino, aminokarbonyl, C₁₋₄alkoksykarbonyl, og C₁₋₄alkoksykarbonylaminoC₁₋₄alkyl, og

C₅₋₆heteroarylet til R⁶ er usubstituert eller substituert av 1 til 2 substituenten uavhengig valgt blant hydroksyl, C₁₋₄alkyl, C₁₋₄alkoksy, amino, C₁₋₄alkylamino, di-C₁₋₄alkylamino, og C₁₋₄alkoksykarbonyl; og

R⁸ er C₁₋₄alkyl eller C₁₋₄alkylamino.

5

3. Forbindelsen ifølge krav 1 eller 2, hvori X er -C(O)-.

4. Forbindelsen ifølge ett av kravene 1 til 3, hvori R¹ er valgt blant C₁₋₄alkyl, C₁₋₄alkoksy, amino, C₁₋₄alkylamino, diC₁₋₄alkylamino, -N(C₂H₅)₂, C₃₋₆sykloalkyl, C₄₋₆heterosykloalkyl, og C₅₋₆heteroaryl, hvori

10

C₁₋₄alkoksyet eller C₁₋₄alkylaminoet til R¹ er usubstituert eller substituert av 1 til 2 substituenten uavhengig valgt blant C₁₋₄alkyl og C₁₋₄alkoksyet; og

C₃₋₆sykloalkylet, C₄₋₆heterosykloalkylet eller C₅₋₆heteroarylet til R¹ er usubstituert eller substituert av 1 til 2 substituenten uavhengig valgt blant halogen, cyano, C₁₋₄alkyl,

15

halogenC₁₋₄alkyl, C₁₋₄alkoksy, amino, C₁₋₄alkylamino, diC₁₋₄alkylamino, og hydroksykarbonyl.

5. Forbindelsen ifølge ett av kravene 1 til 4, hvori R³ er halogen.

20

6. Forbindelsen ifølge ett av kravene 1 til 5, hvori L³ er en binding.

7. Forbindelsen ifølge ett av kravene 1 til 6, hvori R⁰ er valgt blant hydrogen, hydroksyl, halogen, C₁₋₄alkyl, C₁₋₄alkoksy, amino, C₁₋₄alkylamino, diC₁₋₄alkylamino, -NH(CH₂)₁₋₂-fenyl, -NR⁵C(O)R⁶, -Si(CH₃)₃, C₃₋₆sykloalkyl, C₅₋₆sykloalkenyl,

25

C₄₋₆heterosykloalkyl, C₅₋₆heterosykloalkenyl, fenyl, og C₅₋₆heteroaryl, hvori

C₃₋₆sykloalkylet, C₅₋₆sykloalkenylet, C₄₋₆heterosykloalkylet, C₅₋₆heterosykloalkenylet, fenylet eller C₅₋₆heteroarylet til R⁰ er usubstituert eller substituert av 1 til 4 substituenten uavhengig valgt blant halogen, C₁₋₄alkyl, -(CH₂)₁₋₄OH, halogenC₁₋₄alkyl, -(CH₂)₁₋₄NR^aR^b,

C₄₋₆heterosykloalkylC₁₋₄alkyl, benzyl, C₁₋₄alkoksy, amino, C₁₋₄alkylamino,

30

diC₁₋₄alkylamino, usubstituert C₆heterosykloalkyl og C₁₋₄alkylsubstituert

C₄₋₆heterosykloalkyl, hvori R^a og R^b hver er uavhengig valgt blant hydrogen, C₁₋₄alkyl, og C₃₋₆sykloalkyl;

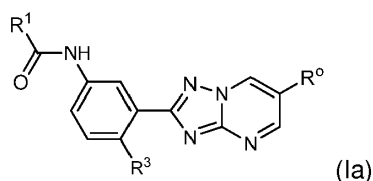
R⁵ er hydrogen eller C₁₋₄alkyl; og

R⁶ er valgt blant C₁₋₄alkyl, C₁₋₄alkoksy, C₃₋₆sykloalkyl, C₅₋₆heterosykloalkyl og

35

C₅₋₆heteroaryl, hver av disse er usubstituert eller substituert av 1 til 2 substituenten uavhengig valgt blant hydroksyl, C₁₋₄alkyl, C₁₋₄alkoksy, amino og C₁₋₄alkylamino.

8. Forbindelsen ifølge krav 2, hvori forbindelsen er representert med formel Ia:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt, eller stereoisomer derav; hvori

R^1 er valgt blant C_{1-4} alkoksy, di- C_{1-4} alkylamino, C_{3-6} sykloalkyl, C_{4-6} heterosykloalkyl og

C_{5-6} heteroaryl, hvori C_{3-6} sykloalkylet, C_{4-6} heterosykloalkylet eller C_{5-6} heteroarylet til R^1 er
usubstituert eller substituert av 1 til 2 substituenten uavhengig valgt blant halogen,
 C_{1-4} alkyl, C_{1-4} alkoksy, di- C_{1-4} alkylamino, og hydroksykarbonyl;

R^3 er halogen;

R^0 er valgt blant hydrogen, halogen, C_{1-4} alkyl, $-NR^{2a}R^{2b}$, $-\text{Si}(\text{CH}_3)_3$, C_{3-6} sykloalkyl,

C_{5-6} sykloalkenyl, C_{4-6} heterosykloalkyl, C_{5-6} heterosykloalkenyl, fenyl og C_{5-6} heteroaryl;
hvori

R^{2a} er hydrogen eller C_{1-4} alkyl;

R^{2b} er valgt blant hydrogen, C_{1-4} alkyl og $-\text{C}(\text{O})\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$; og

C_{3-6} sykloalkylet, C_{5-6} sykloalkenylet, C_{4-6} heterosykloalkylet, C_{5-6} heterosykloalkenylet,

fenylet eller C_{5-6} heteroarylet til R^0 er usubstituert eller substituert av 1 til 4 substituenten
uavhengig valgt blant halogen, C_{1-4} alkyl, halogen- C_{1-4} alkyl, C_{4-6} heterosykloalkyl- C_{1-4} alkyl,
benzyl, C_{1-4} alkoksy, usubstituert C_6 heterosykloalkyl og C_{1-4} alkyl substituert
 C_6 heterosykloalkyl.

9. Forbindelsen ifølge krav 8, hvori

R^1 er oksazolyl eller pyrrolidinyl, hvori oksazolylet eller pyrrolidinet er usubstituert eller
substituert av 1 til 2 substituenten uavhengig valgt blant halogen, C_{1-4} alkyl, C_{1-4} alkoksy,
di- C_{1-4} alkylamino og hydroksykarbonyl;

R^3 er fluor eller klor;

R^0 er valgt blant C_{1-4} alkyl, pyrrolidinyl, fenyl og pyridinyl, hvori pyrrolidinylet, fenylet eller
pyridinylet er usubstituert eller substituert av en substituent valgt blant halogen,
 C_{1-4} alkyl, halogen- C_{1-4} alkyl, C_{1-4} alkoksy, usubstituert C_6 heterosykloalkyl og
 C_{1-4} alkylsubstituert C_6 heterosykloalkyl.

10. Forbindelse ifølge krav 1, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller stereoisomer
derav, hvori forbindelsen er valgt blant gruppen som består av:

N-(4-fluor-3-(6-fenyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-
karboksamid;

N-(4-fluor-3-(6-fenyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2-metyloksazol-5-
karboksamid;

- 2-(dimetylamino)-N-(4-fluor-3-(6-fenyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)oksazol-5-karboksamid;
 N-(4-fluor-3-(6-fenyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)syklobutankarboksamid;
 N-(4-fluor-3-(6-fenyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)pyrrolidin-1-
 5 karboksamid;
 (R)-N-(4-fluor-3-(6-fenyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-3-metoksypyrrolidin-1-karboksamid;
 3-(4-fluor-3-(6-fenyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-1,1-dimetyl(deuterert)urea;
 10 N-(4-fluor-3-(6-fenyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-3,3-dimetylazetidin-1-karboksamid;
 N-(4-fluor-3-(6-fenyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)azetidin-1-karboksamid;
 (R)-3-fluor-N-(4-fluor-3-(6-fenyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)pyrrolidin-1-karboksamid;
 15 (2S,4R)-4-fluor-1-((4-fluor-3-(6-fenyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)karbamoyl)pyrrolidin-2-karboksylsyre;
 3-fluor-N-(4-fluor-3-(6-fenyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)azetidin-1-karboksamid;
 N-(4-fluor-3-(6-fenyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-3-metylazetidin-1-
 20 karboksamid;
 3,3-difluor-N-(4-fluor-3-(6-fenyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)azetidin-1-karboksamid;
 Isopropyl (4-fluor-3-(6-fenyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)karbamat;
 N-(4-klor-3-(6-fenyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)furan-2-karboksamid;
 25 N-(4-klor-3-(6-fenyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)pyrrolidin-1-karboksamid;
 N-(4-fluor-3-(6-(pyridin-2-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
 N-(4-fluor-3-(6-(pyridin-2-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2-metyloksazol-5-karboksamid;
 30 N-(4-fluor-3-(6-(pyridin-2-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)azetidin-1-karboksamid;
 N-(3-(6-(tert-butyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)-4-fluorfenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
 N-(3-(6-klor-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)-4-fluorfenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-
 35 karboksamid;
 N-(3-(6-klor-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)-4-fluorfenyl)-2-metyloksazol-5-karboksamid;
 N-(3-(6-klor-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)-4-fluorfenyl)pyrrolidin-1-karboksamid;

- N-(3-(6-klor-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)-4-fluorfenyl)-3-fluorazetidin-1-karboksamid;
- N-(3-(6-klor-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)-4-fluorfenyl)-3,3-difluorazetidin-1-karboksamid;
- 5 (R)-N-(3-(6-klor-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)-4-fluorfenyl)-3-metoksypyrrolidin-1-karboksamid;
- N-(3-(6-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)-4-fluorfenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- 3-(3-(6-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)-4-fluorfenyl)-1,1-dimetylurea;
- 10 N-(3-(6-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)-4-fluorfenyl)-3-fluorazetidin-1-karboksamid;
- N-(3-(6-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)-4-fluorfenyl)azetidin-1-karboksamid;
- 15 (R)-N-(3-(6-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)-4-fluorfenyl)-3-fluorpyrrolidin-1-karboksamid;
- N-(3-(6-brom-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)-4-klorfenyl)furan-2-karboksamid;
- N-(3-(6-syklopropyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)-4-fluorfenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- 20 N-(3-(6-(syklopent-1-en-1-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)-4-fluorfenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- N-(4-fluor-3-(6-(2,2,6,6-tetrametyl-3,6-dihydro-2H-pyran-4-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- N-(4-fluor-3-(6-(1-metyl-1,2,5,6-tetrahydropyridin-3-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- 25 N-(3-(6-((1R,5S)-8-azabisyklo[3.2.1]okt-3-en-3-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)-4-fluorfenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- N-(4-fluor-3-(6-(2,2,6,6-tetrametyl-1,2,3,6-tetrahydropyridin-4-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- 30 N-(3-(6-(1-benzyl-1,2,3,6-tetrahydropyridin-4-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)-4-fluorfenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- N-(4-fluor-3-(6-(1-metyl-1,2,3,6-tetrahydropyridin-4-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- N-(3-(6-(2,5-dihydro-1H-pyrrol-3-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)-4-fluorfenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- 35 N-(4-fluor-3-(6-(4-(2-morfolinoetyl)fenyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;

- N-(4-fluor-3-(6-(2-fluorfenyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- N-(4-fluor-3-(6-(5-metyl-1H-pyrazol-4-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- 5 N-(4-fluor-3-(6-(1-metyl-1H-pyrazol-5-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- N-(4-fluor-3-(6-(1-metyl-1H-pyrazol-3-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- N-(4-fluor-3-(6-(2-fluorfenyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- 10 N-(4-fluor-3-(6-(6-metoksypyridin-3-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- N-(3-([1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)-4-fluorfenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- 15 N-(4-fluor-3-(6-(pyridin-3-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- N-(4-fluor-3-(6-(6-metoksypyridin-2-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- N-(4-fluor-3-(6-(2-metoksypyridin-3-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- 20 N-(4-fluor-3-(6-(6-(piperazin-1-yl)pyridin-3-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- N-(4-fluor-3-(6-(6-(4-metyl-piperazin-1-yl)pyridin-3-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- 25 N-(4-fluor-3-(6-(6-isopropoksypyridin-3-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- N-(3-(6-(5-klorpyridin-3-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)-4-fluorfenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- N-(4-fluor-3-(6-(6-morfolinopyridin-3-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- 30 N-(4-fluor-3-(6-(3-fluorpyridin-2-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- N-(4-fluor-3-(6-(3-(trifluormetyl)pyridin-2-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- 35 N-(4-fluor-3-(6-(3-metylpyridin-2-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- N-(4-fluor-3-(6-(3-metoksypyridin-2-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;

- N-(4-fluor-3-(6-(5-metylpyrazin-2-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- N-(4-fluor-3-(6-(pyrazin-2-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- 5 N-(3-(6-(3-klorpyridin-2-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)-4-fluorfenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- N-(4-fluor-3-(6-(trimetylsilyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- N-(4-fluor-3-(6-(piperidin-1-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-
- 10 dimetyloksazol-5-karboksamid;
- N-(4-fluor-3-(6-morfolino-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- N-(3-(6-(etyl(metyl)amino)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)-4-fluorfenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- 15 N-(3-(6-(azetidin-1-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)-4-fluorfenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- N-(4-fluor-3-(6-(3-fluorazetidin-1-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- N-(4-fluor-3-(6-(isopropyl(metyl)amino)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-
- 20 dimetyloksazol-5-karboksamid;
- N-(3-(6-(dimetylamino)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)-4-fluorfenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- N-(3-(6-(dietylamino)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)-4-fluorfenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- 25 N-(3-(6-(3,3-difluorazetidin-1-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)-4-fluorfenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- N-(4-fluor-3-(6-(pyrrolidin-1-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- (R)-N-(4-fluor-3-(6-(3-fluorpyrrolidin-1-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-
- 30 2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- N-(4-fluor-3-(6-(piperazin-1-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- N-(4-fluor-3-(6-(isopropylamino)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;
- 35 Isopropyl (2-(5-(2,4-dimetyloksazol-5-karboksamido)-2-fluorfenyl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-6-yl)karbamat;
- N-(4-fluor-3-(6-(pyridin-2-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-N,2,4-trimetyloksazol-5-karboksamid;

N-(4-fluor-3-(6-(3-metylpyridin-2-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-N,2,4-trimetyloksazol-5-karboksamid;

N-(3-(6-(3-(difluormetyl)pyridin-2-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)-4-fluorfenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;

5 N-(3-(6-(7-azabisyklo[2.2.1]hept-2-en-2-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)-4-fluorfenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;

2,4-dimetyl-N-(4-(6-fenyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)pyridin-2-yl)oksazol-5-karboksamid;

10 2,4-dimetyl-N-(5-(6-fenyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)pyridin-3-yl)oksazol-5-karboksamid;

2,4-dimetyl-N-(2-(6-fenyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)pyridin-4-yl)oksazol-5-karboksamid;

N-(2,4-difluor-3-(6-fenyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;

15 2,4-dimetyl-N-(6-(6-fenyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)pyridin-2-yl)oksazol-5-karboksamid;

N-(4-fluor-3-(6-(pyrrolidin-1-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;

20 N-(2,4-difluor-5-(6-fenyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;

(R)-3-fluor-N-(3-(6-fenyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)pyrrolidin-1-karboksamid;

(R)-N-(3-(6-klor-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)-4-fluorfenyl)-3-fluorpyrrolidin-1-karboksamid;

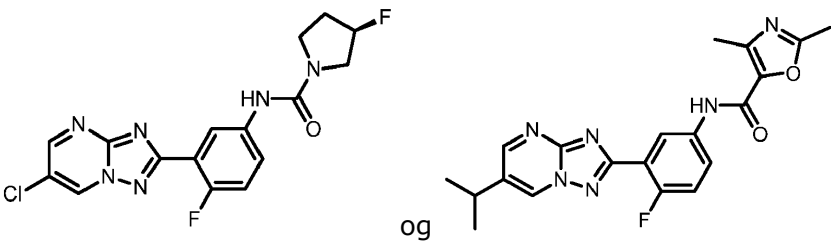
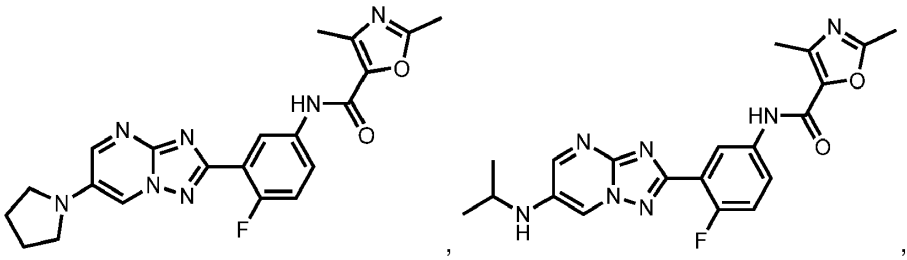
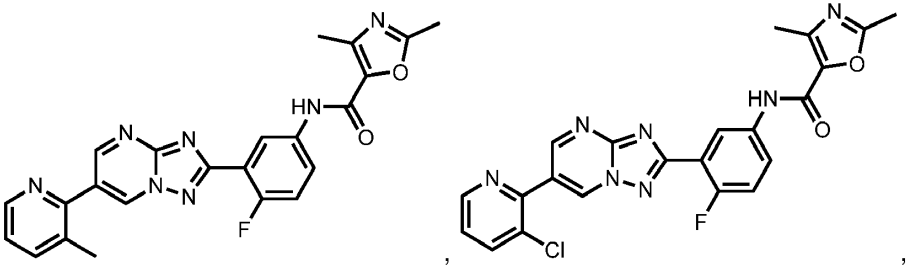
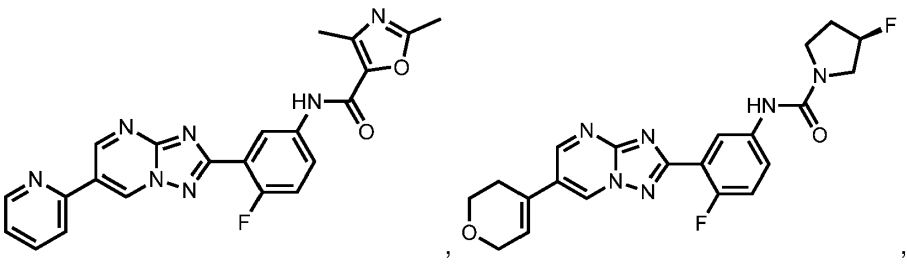
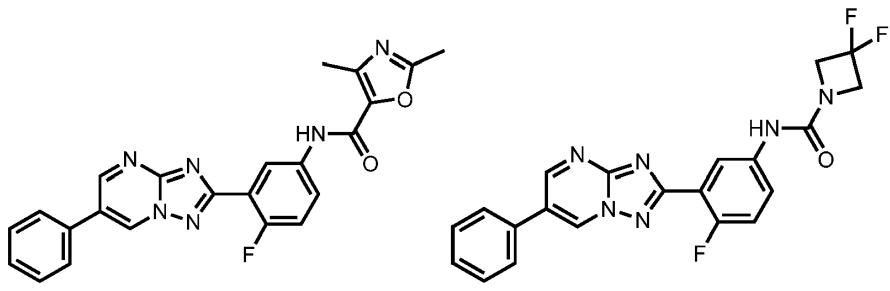
25 N-(4-fluor-3-(6-isopropyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid;

2,4-dimetyl-N-(3-(6-fenyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)oksazol-5-karboksamid;

30 N-(3-(6-(3,6-dihydro-2H-pyran-4-yl)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)-2,4-dimetyloksazol-5-karboksamid; og

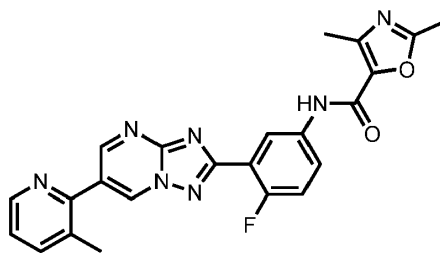
(R)-3-fluor-N-(3-(6-fenyl-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-2-yl)fenyl)pyrrolidin-1-karboksamid.

35 **11.** Forbindelse ifølge krav 10, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori forbindelsen er valgt blant gruppen som består av:



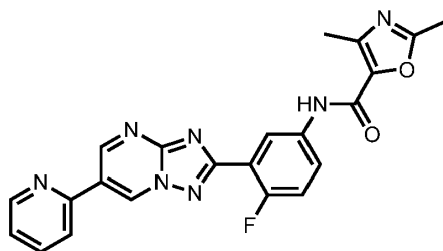
og

12. Forbindelse ifølge krav 11, som er:



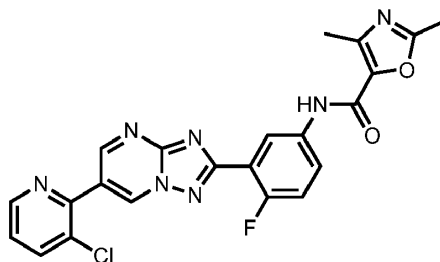
eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

5 **13.** Forbindelse ifølge krav 11, som er:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

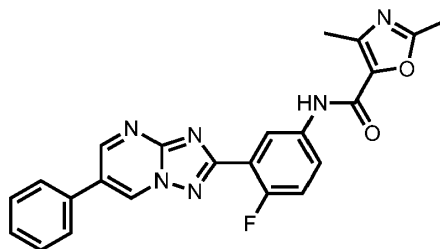
14. Forbindelse ifølge krav 11, som er:



10

eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

15. Forbindelse ifølge krav 11, som er:



15

eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

16. Farmasøytisk sammensetning som omfatter en forbindelse ifølge ett av kravene 1 til 15 som en aktiv bestanddel eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og minst én eksipients.

20

- 17.** Forbindelse eller et farmasøytisk akseptabelt salt ifølge ett av kravene 1 til 15 eller en sammensetning ifølge krav 16, for anvendelse ved behandling, forebygging, inhibering, forbedring eller utryddelse av patologien og/eller symptomologien til en sykdom forårsaket av en parasitt, hvori sykdommen er valgt blant leishmaniasis, human afrikansk trypanosomiasis og Chagas sykdom.
- 18.** Forbindelsen eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav eller sammensetning for anvendelse ifølge krav 17 i kombinasjon med et andre middel, hvori sykdommen er leishmaniasis, og det andre midlet er valgt blant stiboglukonat, megluminantimoniater, amfotericin, miltefosin og paromomycin.
- 19.** Forbindelsen eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav eller sammensetning for anvendelse ifølge krav 17 i kombinasjon med et andre middel, hvori sykdommen er human afrikansk trypanosomiasis, og det andre midlet er valgt blant pentamidin, suramin, melarsoprol, eflornitin og nifurtimox.
- 20.** Forbindelsen eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav eller sammensetning for anvendelse ifølge krav 17 i kombinasjon med et andre middel, hvori sykdommen er Chagas sykdom, og det andre midlet er valgt blant benznidazol, nifurtimox og amfotericin.