



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2444400 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 471/04 (2006.01)
A61K 31/4985 (2006.01)
A61K 31/53 (2006.01)
A61K 31/5377 (2006.01)
A61K 31/5383 (2006.01)
A61K 31/553 (2006.01)
A61P 31/16 (2006.01)
A61P 43/00 (2006.01)
C07D 471/14 (2006.01)
C07D 498/14 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2018.08.20
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.03.28
(86)	European Application Nr.	10789443.8
(86)	European Filing Date	2010.06.14
(87)	The European Application's Publication Date	2012.04.25
(30)	Priority	2009.06.15, JP, 2009142166
(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 ; SE ; SI ; SK ; SM ; TR
	Designated Extension States:	BA ME RS
(73)	Proprietor	Shionogi & Co., Ltd., 1-8, Doshomachi 3-chome Chuo-ku Osaka-shi, Osaka 541-0045, JP-Japan
(72)	Inventor	AKIYAMA, Toshiyuki, c/o Shionogi&Co. Ltd.12-4 Sagisu 5-chomeFukushima-ku, Osaka-shiOsaka 553-0002, JP-Japan TAKAYA, Kenji, c/o Shionogi&Co. Ltd.12-4 Sagisu 5-chomeFukushima-ku, Osaka-shiOsaka 553-0002, JP-Japan KAWAI, Makoto, c/o Shionogi&Co. Ltd.12-4 Sagisu 5-chomeFukushima-ku, Osaka-shiOsaka 553-0002, JP-Japan TAODA, Yoshiyuki, c/o Shionogi&Co. Ltd.12-4 Sagisu 5-chomeFukushima-ku, Osaka-shiOsaka 553-0002, JP-Japan MIKAMIYAMA, Minako, 12-2, Nogami 3-chomeTakarazuka-shi, Hyogo665-0022, JP-Japan MORIMOTO, Kenji, c/o Shionogi&Co. Ltd.1-1 Futabacho 3-chome, Toyonaka-shiOsaka 561-0825, JP-Japan KAGEYAMA, Chika, c/o Shionogi&Co. Ltd.12-4 Sagisu 5-chomeFukushima-ku, Osaka-shiOsaka 553-0002, JP-Japan TOMITA, Kenji, c/o Shionogi&Co. Ltd.12-4 Sagisu 5-chomeFukushima-ku, Osaka-

shiOsaka 553-0002, JP-Japan
 MIKAMIYAMA, Hidenori, c/o Shionogi&Co. Ltd.12-4 Sagisu 5-chomeFukushima-ku,
 Osaka-shiOsaka 553-0002, JP-Japan
 SUZUKI, Naoyuki, c/o Shionogi&Co. Ltd.12-4 Sagisu 5-chomeFukushima-ku,
 Osaka-shiOsaka 553-0002, JP-Japan

(74) Agent or Attorney ZACCO NORWAY AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

(54) Title **SUBSTITUTED POLYCYCLIC CARBAMOYLPYRIDONE DERIVATIVE**

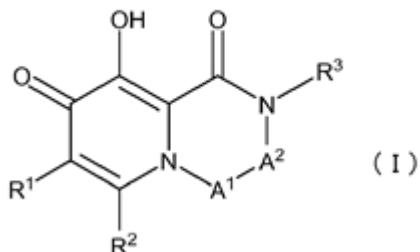
(56) References
 Cited: WO-A1-2005/016927, WO-A1-2005/087766, WO-A1-2006/066414, WO-A1-2006/088173,
 PARKES, K.E. ET AL.: 'Use of a pharmacophore model to discover a new class of influenza
 endonuclease inhibitors' JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY vol. 46, no. 7, 2003, pages
 1153 - 1164, XP008148626, JP-T- 2006 506 352, JP-T- 2007 528 379, JP-T- 2008 540 343,
 TOMASSINI, J. ET AL.: 'Inhibition of cap (M7 GpppXm)-dependent endonuclease of influenza
 virus by 4-substituted 2,4-dioxobutanoic acid compounds' ANTIMICROBIAL AGENTS
 CHEMOTHERAPY vol. 38, no. 12, 1994, pages 2827 - 2837, XP002119719, WO-A1-
 2007/049675

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 representert ved formelen (I), farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav, for anvendelse i behandling og/eller forebygging av en influensainfeksjonssykdom:

[Kjemisk formel 1]



(hvor)

R^1 er hydrogen, halogen, hydrokso, karboksy, cyano, formyl, lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkynyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkyloksy eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkenylloksy eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkylkarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkyloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykelkarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykelokso eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykeloksokarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, heterosykelkarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, heterosykelokso eventuelt substituert med substituentgruppe A, heterosykeloksokarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe A,

-Z-N(R^{X1})(R^{X2}),

-Z-N(R^{X3})-SO₂-(R^{X4}),

-Z-C(=O)-N(R^{X5})-SO₂-(R^{X6}),

-Z-N(R^{X7})-C(=O)- R^{X8} ,

-Z-C(=O)-N(R^{X9})(R^{X10}),

-Z-S- R^{X11} ,

-Z-SO₂- R^{X12} ,

-Z-S(=O)- R^{X13} ,

-Z-N(R^{X14})-C(=O)-O- R^{X15} ,

$-Z-N(R^{X16})-C(=O)-N(R^{X17})(R^{X18}),$

$-Z-C(=O)-N(R^{X19})-C(=O)-N(R^{X20})(R^{X21})$ eller

$-Z-N(R^{X22})-C(=O)-C(=O)-R^{X23}$

(hvor $R^{X1}, R^{X2}, R^{X3}, R^{X5}, R^{X7}, R^{X8}, R^{X9}, R^{X10}, R^{X11}, R^{X14}, R^{X15}, R^{X16}, R^{X17}, R^{X18}, R^{X19},$

5 $R^{X20}, R^{X21}, R^{X22}$ og R^{X23} hver er uavhengig valgt fra en substituentgruppe bestående av hydrogen, lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkynyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A og heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A,

10 R^{X4}, R^{X6}, R^{X12} og R^{X13} hver er uavhengig valgt fra en substituentgruppe bestående av lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkynyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A og heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A,

15 R^{X1} og R^{X2}, R^{X9} og R^{X10}, R^{X17} og $R^{X18},$ og R^{X20} og R^{X21} hver kan tas sammen med et tilstøtende atom for å danne et heterosykel, og

Z er en binding eller rettlinjett eller forgrenet lavalkylen);

20 R^2 er hydrogen, halogen, hydroksy, karboksy, cyano, formyl, lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkynyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkyloksy eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkenyloksy eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkylkarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkyloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykelkarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykeloksy eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykeloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, heterosykelkarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, heterosykeloksy eventuelt

substituert med substituentgruppe A, heterosykeloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe A,

-Z-N(R^{Y1})-SO₂-R^{Y2},

-Z-N(R^{Y3})-C(=O)-R^{Y4},

5 -Z-N(R^{Y5})-C(=O)-O-R^{Y6},

-Z-C(=O)-N(R^{Y7})(R^{Y8}),

-Z-N(R^{Y9})(R^{Y10}) eller

-Z-SO₂-R^{Y11}

10 (hvor R^{Y1}, R^{Y3}, R^{Y4}, R^{Y5}, R^{Y6}, R^{Y7}, R^{Y8}, R^{Y9} og R^{Y10} hver er uavhengig valgt fra en substituentgruppe bestående av hydrogen, lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkynyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A og heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A,

15 R^{Y2} og R^{Y11} hver er uavhengig valgt fra en substituentgruppe bestående av lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkynyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A og heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A,

20 R^{Y7} og R^{Y8}, og R^{Y9} og R^{Y10} kan tas sammen med et tilstøtende atom for å danne en heterosykel, og

Z er en binding eller rettlinjet eller forgrenet lavalkylen);

30 R³ er hydrogen, hydroksy, karboksy, cyano, formyl, lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkynyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkyloksy eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkenyloksy eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkylkarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkyloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykeloksy-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykelkarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykeloksy eventuelt substituert med substituentgruppe A,

- A, karbosykeloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, heterosykeloksy-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, heterosykelkarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, heterosykeloksy eventuelt substituert med substituentgruppe A, heterosykeloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe A,
- 5 -Z-N(R^{Z1})-SO₂-R^{Z2},
 -Z-N(R^{Z3})-C(=O)-R^{Z4},
 10 -Z-N(R^{Z5})-C(=O)-O-R^{Z6},
 -Z-C(=O)-N(R^{Z7})(R^{Z8}),
 -Z-N(R^{Z9})(R^{Z10}),
 -Z-SO₂-R^{Z11} eller
 -Z-N(R^{Z12})-O-C(=O)-R^{Z13}
- 15 (hvor R^{Z1}, R^{Z3}, R^{Z4}, R^{Z5}, R^{Z6}, R^{Z7}, R^{Z8}, R^{Z9}, R^{Z10}, R^{Z12} og R^{Z13} hver er uavhengig valgt fra en substituentgruppe bestående av hydrogen, lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkynyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, en
- 20 heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A og heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A,
 R^{Z2} og R^{Z11} hver er uavhengig valgt fra en substituentgruppe bestående av lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkynyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, en
- 25 heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A og heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A,
- 30 R^{Z7} og R^{Z8}, og R^{Z9} og R^{Z10} hver kan tas sammen med et tilstøtende atom for å danne en heterosykel, og
 Z er en binding eller rettlinjert eller forgrenet lavalkylen) og;
 a) enten A¹ eller A² er CR⁵R⁶, og den andre er NR⁷ eller
 b) A¹ er CR⁸R⁹, og A² er CR¹⁰R¹¹,
- 35 R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰ og R¹¹ er hver uavhengig valgt fra en substituentgruppe bestående av hydrogen, karboksy, cyano, lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe A,

- lavalkynyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkylkarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkyloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykeloksyfavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykelkarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykeloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, heterosykeloksyfavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, heterosykelkarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, heterosykeloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe A,
- Z-S-R^{V1},
- Z-S(=O)-R^{V2},
- Z-SO₂-R^{V3},
- C(=O)-C(=O)-R^{V4},
- C(=O)-N(R^{V5})(R^{V6}),
- Z-N(R^{V7})-C(=O)-O-R^{V8} eller
- Z-N(R^{V9}-C(=O)-R^{V10}
- (hvor R^{V1}, R^{V4}, R^{V5}, R^{V6}, R^{V7}, R^{V8}, R^{V9} og R^{V10} hver er uavhengig valgt fra en substituentgruppe bestående av hydrogen, lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkynyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A og heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A,
- R^{V2} og R^{V3} hver er uavhengig valgt fra en substituentgruppe bestående av lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkynyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A og heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A,
- R^{V5} og R^{V6} kan tas sammen med et tilstøtende atom for å danne en heterosykel, og

Z er en binding eller rettlinjett eller forgrenet lavalkylen), og

R^5 og R^6 kan tas sammen med et tilstøtende atom for å danne en karbosykel;

1) når A^1 er CR^5R^6 , og A^2 er NR^7 ,

kan R^3 og R^7 tas sammen med et tilstøtende atom for å danne en heterosykel eventuelt substituert med substituentgruppe B eller kan danne en kondensert ring,

2) når A^1 er NR^7 , og A^2 er CR^5R^6 ,

kan R^3 og R^6 tas sammen med et tilstøtende atom for å danne en heterosykel eventuelt substituert med substituentgruppe B eller kan danne en kondensert ring, eller

3) når A^1 er CR^8R^9 , og A^2 er $CR^{10}R^{11}$,

kan R^8 og R^{10} tas sammen med et tilstøtende atom for å danne en binding, og R^8 og R^{10} kan tas sammen med et tilstøtende atom for å danne en karbosykel eller heterosykel, eller

R^3 og R^{11} kan tas sammen med et tilstøtende atom for å danne en heterosykel eventuelt substituert med substituentgruppe B eller kan danne en kondensert ring;

under forutsetning av at følgende tilfelle av c) og d) er utelukket;

c) R^5 , R^6 og R^7 er alle hydrogen

d) R^8 , R^9 , R^{10} og R^{11} er alle hydrogen;

substituentgruppe A: halogen, cyano, hydroksy, karboksy, formyl, amino, okso, nitro, lavalkyl, halogenolavalkyl, lavalkyloksy, lavalkyltio, hydroksylavalkyl, en karbosyklisk gruppe, en heterosyklisk gruppe, en heterosyklisk gruppe substituert med okso, karbosykel-lavalkyloksy, karbosykeloksy-lavalkyl, karbosykel-lavalkyloksylavalkyl, heterosykel-lavalkyloksy, heterosykeloksy-lavalkyl, heterosykel-lavalkyloksylavalkyl, halogenolavalkyloksy, lavalkyloksylavalkyl, lavalkyloksylavalkyloksy, lavalkylkarbonyl, lavalkylkarbonyloksy, lavalkyloksykarbonyl, lavalkylamino, lavalkylkarbonylamino, halogenlavalkylkarbonylamino, lavalkylaminokarbonyl, lavalkylsulfonyl, lavalkylsulfinyl og lavalkylsulfonylamino;

substituentgruppe B: halogen, cyano, hydroksy, karboksy, formyl, amino, okso, nitro, lavalkyl, halogenolavalkyl, lavalkyloksy, karbosykel-lavalkyloksy, heterosykel-lavalkyloksy, halogenolavalkyloksy, lavalkyloksylavalkyl, lavalkyloksylavalkyloksy, lavalkylkarbonyl, lavalkyloksykarbonyl, lavalkylamino, lavalkylkarbonylamino, lavalkylaminokarbonyl, lavalkylsulfonyl, lavalkylsulfonylamino, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med

substituentgruppe A og heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A); og

hvor lavalkyl betyr rettlinjert eller forgrenet alkyl med et karbontall på 1 til 6;

lavalkenyl betyr rettlinjert eller forgrenet alkenyl med et karbontall på 2 til 6;

5 lavalkynyl betyr rettlinjert eller forgrenet alkynyl med et karbontall på 2 til 8;

lavalkylen betyr divalent rettlinjert eller forgrenet alkyl med et karbontall på 1 til 6;

en lavalkyldel av "lavalkyloksy", "lavalkylkarbonyl", "lavalkyloksykarbonyl",

"karbosykel-lavalkyl", "heterosykel-lavalkyl", "karbosykeloksy-lavalkyl",

10 "heterosykeloksy-lavalkyl", "halogenolavalkyl", "karbosykel-lavalkyloksy",

"heterosykel-lavalkyloksy", "halogenolavalkyloksy", "lavalkyloksy-lavalkyl",

"lavalkyloksy-lavalkyloksy", "lavalkylkarbonyl", "lavalkyloksykarbonyl",

"lavalkylamino", "lavalkylkarbonylamino", "lavalkylaminokarbonyl",

"lavalkylsulfonyl", "lavalkylsulfonylamino", "lavalkyltio", "hydroksylavalkyl",

15 "karbosykel-lavalkyloksy-lavalkyl", "heterosykel-lavalkyloksy-lavalkyl",

"lavalkylkarbonyloksy", "halogenolavalkylkarbonylamino" og "lavalkylsulfinyl" er det samme som "lavalkyl"; og

en lavalkenyldel av "lavalkenyloksy" er det samme som "lavalkenyl".

20 **2.** Forbindelsen, det farmasøytisk akseptable saltet eller solvatet derav for anvendelse i behandling og/eller forebygging av en influensainfeksjonssykdom ifølge krav 1, hvor R^1 er hydrogen, halogen, hydroksy, karboksy, cyano, formyl,

lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkynyl eventuelt substituert med

25 substituentgruppe A, lavalkyloksy eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkenyloksy eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkylkarbonyl

eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkyloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert

med substituentgruppe A, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykelkarbonyl eventuelt substituert med

30 substituentgruppe A, karbosykeloksy eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykeloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, en

heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, heterosykelkarbonyl

eventuelt substituert med substituentgruppe A, heterosykeloksy eventuelt substituert med substituentgruppe A, heterosykeloksykarbonyl eventuelt

35 substituert med substituentgruppe A, heterosykeloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe A,

- Z-N(R^{X1})(R^{X2}),
 -Z-N(R^{X3})-SO₂-(R^{X4}),
 -Z-C(=O)-N(R^{X5})-SO₂-(R^{X6}),
 -Z-N(R^{X7})-C(=O)-R^{X8},
 5 -Z-S-R^{X11},
 -Z-SO₂-R^{X12},
 -Z-S(=O)-R^{X13},
 -Z-N(R^{X14})-C(=O)-O-R^{X15},
 -Z-N(R^{X16})-C(=O)-N(R^{X17})(R^{X18}) eller
 10 -Z-N(R^{X22})-C(=O)-C(=O)-R^{X23}
 (substituentgruppe A, R^{X1}, R^{X2}, R^{X3}, R^{X4}, R^{X5}, R^{X6}, R^{X7}, R^{X8}, R^{X11}, R^{X12}, R^{X13}, R^{X14},
 R^{X15}, R^{X16}, R^{X17}, R^{X18}, R^{X22}, R^{X23} og Z har samme betydning som de i krav 1).

15 **3.** Forbindelsen, det farmasøytisk akseptable saltet eller solvatet derav for
 anvendelse i behandling og/eller forebygging av en influensainfeksjonssykdom
 ifølge krav 1, hvori

R¹ er hydrogen, halogen, hydroksy, karboksy, lavalkyl eventuelt substituert med
 substituentgruppe A, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe A,
 lavalkyloksy eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkylkarbonyl
 20 eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkyloksykarbonyl eventuelt
 substituert med substituentgruppe A, en heterosyklisk gruppe eventuelt
 substituert med substituentgruppe A,

-Z-N(R^{X1})(R^{X2}),
 -Z-N(R^{X7})-C(=O)-R^{X8} eller
 25 -Z-N(R^{X14})-C(=O)-O-R^{X15}
 (substituentgruppe A, R^{X1}, R^{X2}, R^{X7}, R^{X8}, R^{X14}, R^{X15} og Z har samme betydning som
 de i krav 1).

30 **4.** Forbindelsen, det farmasøytisk akseptable saltet eller solvatet derav for
 anvendelse i behandling og/eller forebygging av en influensainfeksjonssykdom
 ifølge krav 1, hvori

R¹ er hydrogen, halogen, hydroksy, karboksy, lavalkyl eventuelt substituert med
 substituentgruppe A, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe A,
 lavalkyloksy eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkylkarbonyl
 35 eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkyloksykarbonyl eventuelt
 substituert med substituentgruppe A, en heterosyklisk gruppe eventuelt
 substituert med substituentgruppe A eller



(substituentgruppe A, R^{X1} , R^{X2} og Z har samme betydning som de i krav 1).

5 **5.** Forbindelsen, det farmasøytisk akseptable saltet eller solvatet derav for anvendelse i behandling og/eller forebygging av en influensainfeksjonssykdom ifølge krav 1, hvori R^1 er hydrogen eller karboksy.

10 **6.** Forbindelsen, det farmasøytisk akseptable saltet eller solvatet derav for anvendelse i behandling og/eller forebygging av en influensainfeksjonssykdom ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5, hvori

R^2 er hydrogen, lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A eller $-ZN(R^{Y9})(R^{Y10})$

(substituentgruppe A, R^{Y9} , R^{Y10} og Z har samme betydning som de i krav 1).

15

7. Forbindelsen, det farmasøytisk akseptable saltet eller solvatet derav for anvendelse i behandling og/eller forebygging av en influensainfeksjonssykdom ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5, hvori

R^2 er hydrogen eller lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A

20

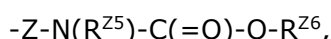
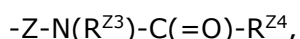
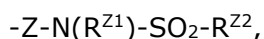
(substituentgruppe A har samme betydning som i krav 1).

8. Forbindelsen, det farmasøytisk akseptable saltet eller solvatet derav for anvendelse i behandling og/eller forebygging av en influensainfeksjonssykdom ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7, hvori

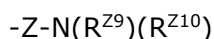
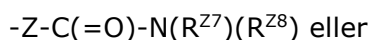
25

R^3 er hydrogen, lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, lavalkynyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykeloksy-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A,

30



35



(substituentgruppe A, R^{Z1} , R^{Z2} , R^{Z3} , R^{Z4} , R^{Z5} , R^{Z6} , R^{Z7} , R^{Z8} , R^{Z9} , R^{Z10} og Z har samme betydning som de i krav 1).

5 **9.** Forbindelsen, det farmasøytisk akseptable saltet eller solvatet derav for anvendelse i behandling og/eller forebygging av en influensainfeksjonssykdom ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8, hvori

A^1 er CR^8R^9 , A^2 er $CR^{10}R^{11}$,

R^9 , R^{10} og R^{11} er hydrogen eller lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, og

10 R^8 er lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykeloksy-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, heterosykeloksy-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A,

-Z-S- R^{V1} ,

-Z-S(=O)- R^{V2} eller

-Z-SO₂- R^{V3}

20 (substituentgruppe A, R^{V1} , R^{V2} , R^{V3} og Z har samme betydning som de i krav 1).

10. Forbindelsen, det farmasøytisk akseptable saltet eller solvatet derav for anvendelse i behandling og/eller forebygging av en influensainfeksjonssykdom ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8, hvori

25 A^1 er CR^8R^9 , A^2 er $CR^{10}R^{11}$,

R^8 , R^9 og R^{11} er hydrogen eller lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, og

30 R^{10} er lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, karbosykeloksy-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe A, heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A, heterosykeloksy-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A,

35 -Z-S- R^{V1} ,

-Z-S(=O)- R^{V2} eller

-Z-SO₂- R^{V3}

(substituentgruppe A, R^{V1} , R^{V2} , R^{V3} og Z har samme betydning som de i krav 1).

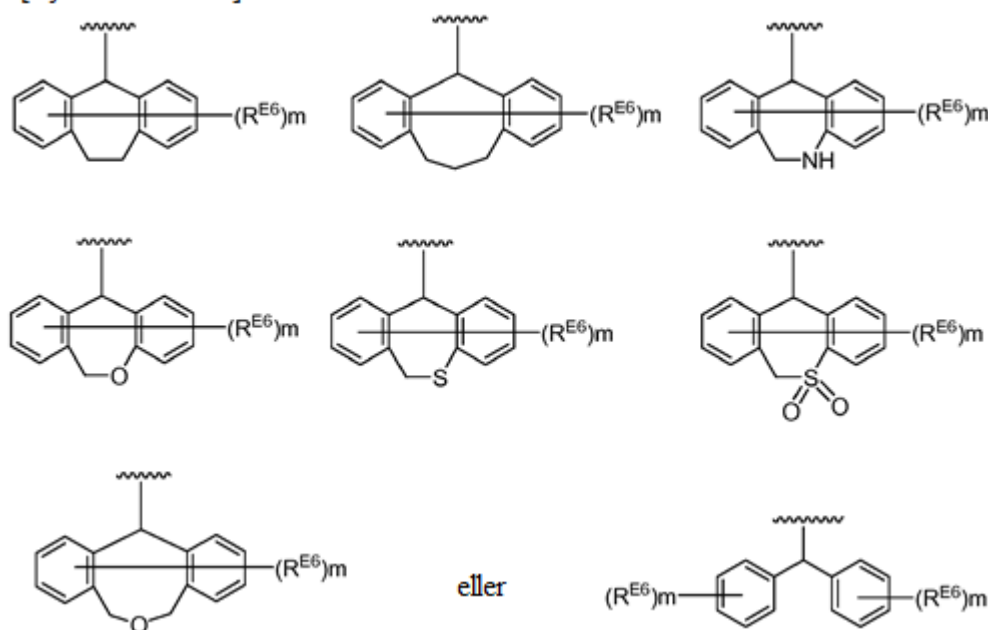
11. Forbindelsen, det farmasøytisk akseptable saltet eller solvatet derav for anvendelse i behandling og/eller forebygging av en influensainfeksjonssykdom ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8, hvori

A^1 er CR^8R^9 , A^2 er $CR^{10}R^{11}$,

R^9 og R^{11} er hydrogen,

i) enten R^8 eller R^{10} er en gruppe vist nedenfor:

[Kjemisk formel 2]



(hvori hver R^{E6} er den samme eller forskjellige grupper valgt fra en substituentgruppe A, m er et heltall på 0 eller mer, og substituentgruppe A har samme betydning som de i krav 1)

og;

ii) den andre av R^8 eller R^{10} er hydrogen eller lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A.

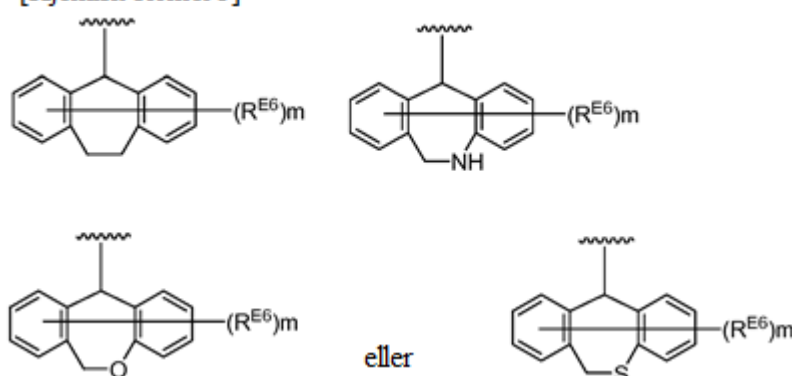
12. Forbindelsen, det farmasøytisk akseptable saltet eller solvatet derav for anvendelse i behandling og/eller forebygging av en influensainfeksjonssykdom ifølge krav 11, hvori

A^1 er CR^8R^9 , A^2 er $CR^{10}R^{11}$,

R^9 og R^{11} er hydrogen,

i) enten R^8 eller R^{10} er en gruppe vist nedenfor:

[Kjemisk formel 3]



(hvor i hver R^{E6} er den samme eller forskjellige grupper valgt fra en substituentgruppe A,

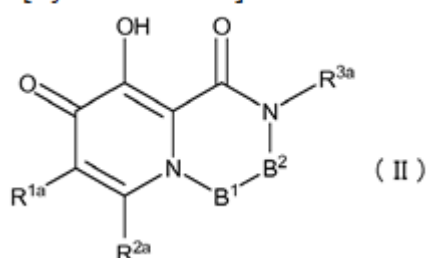
m er et heltall på 0 eller mer, substituentgruppe A har samme betydning som i krav 1)

og;

ii) den andre av R^8 eller R^{10} er hydrogen eller lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe A.

10 **13.** Forbindelse representert ved formelen (II) eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav eller et solvat derav:

[Kjemisk formel 4]



(hvor i

R^{1a} er hydrogen, halogen, hydroksy, karboksy, cyano, formel, lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkynyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkyloksy eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkenyloksy eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkylkarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkyloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbosykeloksy eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbosykeloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, heterosykeloksy eventuelt

substituert med substituentgruppe C, heterosykeloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C,

-Z-N(R^{A1})(R^{A2}),

-Z-N(R^{A3})-SO₂-(R^{A4}),

5 -Z-N(R^{A7})-C(=O)-R^{A8},

-Z-S-R^{A9},

-Z-SO₂-R^{A10},

-Z-N(R^{A12})-C(=O)-O-R^{A13} eller

-Z-N(R^{A20})-C(=O)-C(=O)-R^{A21}

10 (hvor R^{A1}, R^{A2}, R^{A3}, R^{A7}, R^{A8}, R^{A9}, R^{A12}, R^{A13}, R^{A20} og R^{A21} hver er uavhengig valgt fra en substituentgruppe bestående av hydrogen, lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkynyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C og heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C,

15 R^{A4} og R^{A10} hver er uavhengig valgt fra en substituentgruppe bestående av lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkynyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C og heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C,

20 R^{A1} og R^{A2}, R^{A15} og R^{A16}, og R^{A18} og R^{A19} kan hver tas sammen med et tilstøtende atom for å danne en heterosyklus, og Z er en binding eller rettlinjert eller forgrenet lavalkylen);

R^{2a} er hydrogen, halogen, hydroksy, karboksy, cyano, formyl, lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkynyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkyloksy eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkenyloksy eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkylkarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkyloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbosykelkarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbosykeloksy eventuelt substituert med substituentgruppe C,

25 R^{A1} og R^{A2}, R^{A15} og R^{A16}, og R^{A18} og R^{A19} kan hver tas sammen med et tilstøtende atom for å danne en heterosyklus, og

Z er en binding eller rettlinjert eller forgrenet lavalkylen);

30 R^{2a} er hydrogen, halogen, hydroksy, karboksy, cyano, formyl, lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkynyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkyloksy eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkenyloksy eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkylkarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkyloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbosykelkarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbosykeloksy eventuelt substituert med substituentgruppe C,

35

- C, karbosykeloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, heterosykelkarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, heterosykeloksy eventuelt substituert med substituentgruppe C, heterosykeloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C,
- 5 -Z-N(R^{B1})-SO₂-R^{B2},
 -Z-N(R^{B3})-C(=O)-R^{B4},
 -Z-N(R^{B5})-C(=O)-O-R^{B6},
 10 -Z-C(=O)-N(R^{B7}(R^{B8}),
 -Z-N(R^{B9})(R^{B10}) eller
 -Z-SO₂-R^{B11}
- (hvor R^{B1}, R^{B3}, R^{B4}, R^{B5}, R^{B6}, R^{B7}, R^{B8}, R^{B9} og R^{B10} hver er uavhengig valgt fra en substituentgruppe bestående av hydrogen, lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkynyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C og heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C,
- 15 R^{B2} og R^{B11} hver er uavhengig valgt fra en substituentgruppe bestående av lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkynyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C og heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C,
- 20 R^{B7} og R^{B8}, og R^{B9} og R^{B10} hver kan tas sammen med et tilstøtende atom for å danne en heterosykel, og
- 30 Z er en binding eller rettlinjert eller forgrenet lavalkylen);
- R^{3a} er hydrogen, halogen, hydroksy, karboksy, cyano, formyl, lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkynyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkyloksy eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkenyloksy eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkylkarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkyloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med
- 35

substituentgruppe C, karbocykel-lavalkyl eventuelt substituert med
 substituentgruppe C, karbocykeloksy-lavalkyl eventuelt substituert med
 substituentgruppe C, karbocykelkarbonyl eventuelt substituert med
 substituentgruppe C, karbocykeloksy eventuelt substituert med substituentgruppe
 5 C, karbocykeloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en
 heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, heterosykel-
 lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, heterosykeloksy-lavalkyl
 eventuelt substituert med substituentgruppe C, heterosykelkarbonyl eventuelt
 substituert med substituentgruppe C, heterosykeloksy eventuelt substituert med
 10 substituentgruppe C, heterosykeloksykarbonyl eventuelt substituert med
 substituentgruppe C,
 -Z-N(R^{C1})-SO₂-R^{C2},
 -Z-N(R^{C3})-C(=O)-R^{C4},
 -Z-N(R^{C5})-C(=O)-O-R^{C6},
 15 -Z-C(=O)-N(R^{C7})(R^{C8}),
 -Z-N(R^{C9})(R^{C10}),
 -Z-SO₂-R^{C11} eller
 -Z-N(R^{C12})-O-C(=O)-R^{C13}
 (hvor R^{C1}, R^{C3}, R^{C4}, R^{C5}, R^{C6}, R^{C7}, R^{C8}, R^{C9}, R^{C10}, R^{C12} og R^{C13} hver er uavhengig
 20 valgt fra en substituentgruppe bestående av hydrogen, lavalkyl eventuelt
 substituert med substituentgruppe C, lavalkenyl eventuelt substituert med
 substituentgruppe C, lavalkynyl eventuelt substituert med substituentgruppe C,
 en karbocyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, en
 heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbocykel-
 25 lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C og heterosykel-lavalkyl
 eventuelt substituert med substituentgruppe C,
 R^{C2} og R^{C11} hver er uavhengig valgt fra en substituentgruppe bestående av lavalkyl
 eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkenyl eventuelt substituert
 med substituentgruppe C, lavalkynyl eventuelt substituert med substituentgruppe
 30 C, en karbocyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, en
 heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbocykel-
 lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C og heterosykel-lavalkyl
 eventuelt substituert med substituentgruppe C,
 R^{C7} og R^{C8} og R^{C9} og R^{C10} hver kan tas sammen med et tilstøtende atom for å
 35 danne en heterosykel, og
 Z er en binding eller rettlinjert eller forgrenet lavalkylen) og;
 a) enten er B¹ eller B² CR^{5a}R^{6a}, og den andre er NR^{7a},

eller

b) B^1 er $CR^{8a}R^{9a}$, og B^2 er $CR^{10a}R^{11a}$,

R^{5a} , R^{6a} , R^{7a} , R^{8a} , R^{9a} , R^{10a} og R^{11a} er hver uavhengig valgt fra en substituentgruppe bestående av hydrogen, karboksy, cyano, lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkynyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkylkarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkyloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbosykeloksy-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbosykelkarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbosykeloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, heterosykeloksy-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, heterosykelkarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, heterosykeloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C,

$-Y-S-R^{D1}$,

$-Z-S(=O)-R^{D2}$,

$-Z-SO_2-R^{D3}$,

$-C(=O)-C(=O)-R^{D4}$,

$-C(=O)-N(R^{D5})(R^{D6})$,

$-Z-C(R^{D7})(R^{D8})(R^{D9})$,

$-Z-CH_2-R^{D10}$,

$-Z-N(R^{D11})-C(=O)-O-R^{D12}$ eller

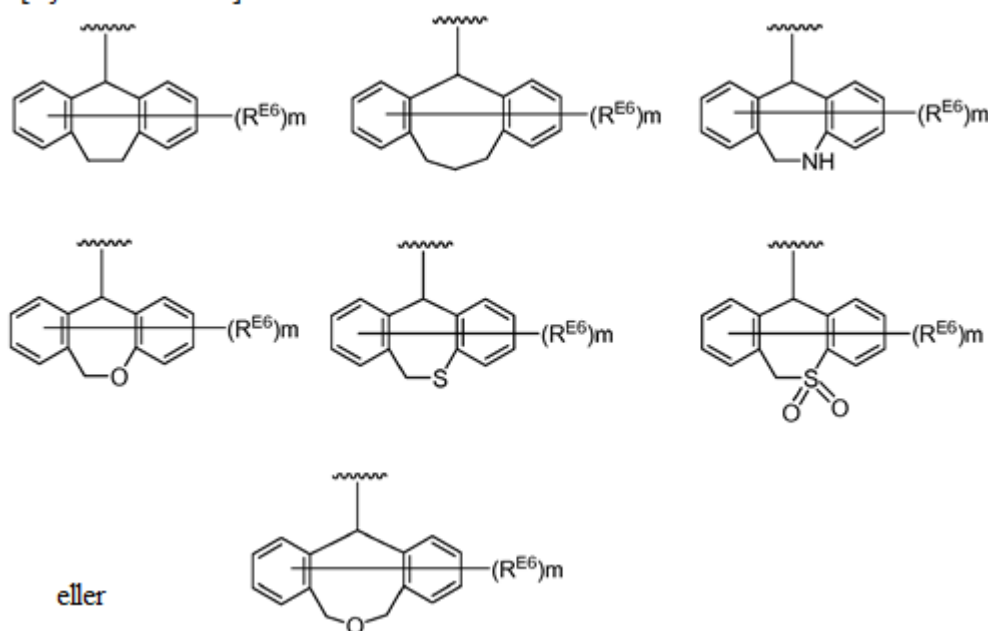
$-Z-N(R^{D13})-C(=O)-R^{D14}$

(hvor R^{D1} , R^{D4} , R^{D5} , R^{D6} , R^{D9} , R^{D11} , R^{D12} , R^{D13} og R^{D14} hver er uavhengig valgt fra en substituentgruppe bestående av hydrogen, lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkynyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C og heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C,

R^{D2} og R^{D3} hver er uavhengig valgt fra en substituentgruppe bestående av lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkenyl eventuelt substituert

- med substituentgruppe C, lavalkynyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C og heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C,
- 5 R^{D7} , R^{D8} og R^{D10} hver er uavhengig valgt fra en substituentgruppe bestående av en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, R^{D5} og R^{D6} kan tas sammen med et tilstøtende atom for å danne en heterosykel, Y er rettlinjert eller forgrenet lavalkylen, og
- 10 Z er en binding eller rettlinjert eller forgrenet lavalkylen); R^{D5} og R^{D6} kan tas sammen med et tilstøtende atom for å danne en karbosykel;
- 1) når B^1 er $CR^{5a}R^{6a}$, og B^2 er NR^{7a} , kan R^{3a} og R^{7a} tas sammen med et tilstøtende atom for å danne en heterosykel eventuelt substituert med substituentgruppe D,
- 15 2) når B^1 er NR^{7a} , og B^2 er $CR^{5a}R^{6a}$, kan R^{3a} og R^{6a} tas sammen med et tilstøtende atom for å danne en heterosykel eventuelt substituert med substituentgruppe D eller
- 3) når B^1 er $CR^{8a}R^{9a}$, og B^2 er $CR^{10a}R^{11a}$,
- 20 (I) tas R^8 og R^{10a} sammen med et tilstøtende atom for å danne en karbosykel eller heterosykel eventuelt substituert med substituentgruppe D,
- (II) tas R^{3a} og R^{11a} sammen med et tilstøtende atom for å danne en heterosykel eventuelt substituert med substituentgruppe D eller
- (III) R^{9a} er hydrogen, R^{11a} er hydrogen, og
- 25 i) enten er 8a eller R^{10a}
- Z-C(R^{E1})(R^{E2})(R^{E3})
- Y-S- R^{E4} ,
- Z-CH₂- R^{E5} eller
- en gruppe vist nedenfor:

[Kjemisk formel 5]



(hvor R^{E1} og R^{E2} hver er uavhengig en karbocykel eventuelt substituert med substituentgruppe C og en heterosykel eventuelt substituert med substituentgruppe C,

5 R^{E3} er valgt fra en substituentgruppe bestående av hydrogen, lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkynyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en karbocyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbocykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C og heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C,

R^{E4} er valgt fra en substituentgruppe bestående av karbocykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C og heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C,

15 R^{E5} er en aromatisk heterosykel eventuelt substituert med substituentgruppe C, hver R^{E6} er den samme eller forskjellige grupper valgt fra en substituentgruppe C, m er et heltall på 0 eller mer, forutsatt at

Y er rettlinjet eller forgrenet lavalkylen, og

20 Z er en binding eller rettlinjet eller forgrenet lavalkylen); og
ii) den andre er

hydrogen, karboksy, cyano, lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkynyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkylkarbonyl eventuelt substituert med

- substituentgruppe C, lavalkyloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbosykeloksy-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbosykelkarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbosykeloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, heterosykeloksy-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, heterosykelkarbonyl, heterosykeloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C,
- Y-S-R^{F1},
 -C(=O)-C(=O)-R^{F2} eller
 -C(=O)-N(R^{F3})(R^{F4})
- (hvor R^{F1}, R^{F2}, R^{F3} og R^{F4} hver uavhengig er hydrogen, lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkynyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C og heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, og Y er rettlinjet eller forgrenet lavalkylen);
- under forutsetning av at følgende c) og d) er utelukket
- c) R^{5a}, R^{6a} og R^{7a} er alle hydrogen
- d) R^{8a}, R^{9a}, R^{10a} og R^{11a} er alle hydrogen;
- substituentgruppe C: halogen, cyano, hydroksy, karboksy, formyl, amino, okso, nitro, lavalkyl, halogenolavalkyl, lavalkyloksy, lavalkyltio, hydroksylavalkyl, en karbosyklisk gruppe, en heterosyklisk gruppe, en heterosyklisk gruppe substituert med okso, karbosykel-lavalkyloksy, karbosykeloksy-lavalkyl, karbosykel-lavalkyloksylavalkyl, heterosykel-lavalkyloksy, heterosykeloksy-lavalkyl, heterosykel-lavalkyloksylavalkyl, halogenolavalkyloksy, lavalkyloksylavalkyl, lavalkyloksylavalkyloksy, lavalkylkarbonyl, lavalkylkarbonyloksy, lavalkyloksykarbonyl, lavalkylamino, lavalkylkarbonylamino, halogenolavalkylkarbonylamino, lavalkylaminokarbonyl, lavalkylsulfonyl, lavalkylsulfinyl og lavalkylsulfonylamino;

substituentgruppe D: halogen, cyano, hydroksy, karboksy, formyl, amino, okso, nitro, lavalkyl, halogenolavalkyl, lavalkyloksy, karbosykel-lavalkyloksy, heterosykel-lavalkyloksy, halogenolavalkyloksy, lavalkyloksylavalkyl, lavalkyloksylavalkyloksy, lavalkylkarbonyl, lavalkyloksykarbonyl, lavalkylamino, lavalkylkarbonylamino, lavalkylaminokarbonyl, lavalkylsulfonyl, lavalkylsulfonylamino, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C og heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C); og

hvor i lavalkyl betyr rettlinjet eller forgrenet alkyl med et karbontall på 1 til 6; lavalkenyl betyr rettlinjet eller forgrenet alkenyl med et karbontall på 2 til 6; lavalkynyl betyr rettlinjet eller forgrenet alkynyl med et karbontall på 2 til 8; lavalkylen betyr divalent rettlinjet eller forgrenet alkyl med et karbontall på 1 til 6;

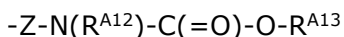
en lavalkyldel av "lavalkyloksy", "lavalkylkarbonyl", "lavalkyloksykarbonyl", "karbosykel-lavalkyl", "heterosykel-lavalkyl", "karbosykeloksy-lavalkyl", "heterosykeloksy-lavalkyl", "halogenolavalkyl", "karbosykel-lavalkyloksy", "heterosykel-lavalkyloksy", "halogenolavalkyloksy", "lavalkyloksylavalkyl", "lavalkyloksylavalkyloksy", "lavalkylkarbonyl", "lavalkyloksykarbonyl", "lavalkylamino", "lavalkylkarbonylamino", "lavalkylaminokarbonyl", "lavalkylsulfonyl", "lavalkylsulfonylamino", "lavalkyltio", "hydroksylavalkyl", "karbosykel-lavalkyloksylavalkyl", "heterosykel-lavalkyloksylavalkyl", "lavalkylkarbonyloksy", "halogenolavalkylkarbonylamino" og "lavalkylsulfinyll" er det samme som "lavalkyl"; og

en lavalkenyldel av "lavalkenyloksy" er det samme som "lavalkenyl".

14. Forbindelsen ifølge krav 13 eller det farmasøytisk akseptable saltet derav eller solvatet derav,

hvor i R^{1a} er hydrogen, halogen, hydroksy, karboksy, lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkyloksy eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkylkarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkyloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C,

-Z-N(R^{A1})(R^{A2}),
 -Z-N(R^{A7})-C(=O)- R^{A8} eller



(substituentgruppe C, R^{A1} , R^{A2} , R^{A7} , R^{A8} , R^{A12} , R^{A13} og Z er de samme som de ifølge krav 13).

- 5 **15.** Forbindelsen ifølge krav 13 eller det farmasøytisk akseptable saltet derav eller solvatet derav,
 hvori R^{1a} er hydrogen, halogen, hydroksy, karboksy, lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkyloksy eventuelt substituert med substituentgruppe C,
 10 lavalkyloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C eller
 $-Z-N(R^{A1})(R^{A2})$
 (substituentgruppe C, R^{A1} , R^{A2} og Z er de samme som de i krav 13).
- 15 **16.** Forbindelsen ifølge krav 13 eller det farmasøytisk akseptable saltet derav eller solvatet derav,
 hvori R^{1a} er hydrogen eller karboksy.
- 20 **17.** Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 13 til 16 eller det farmasøytisk akseptable saltet derav eller solvatet derav,
 hvori R^{2a} er hydrogen, lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C eller
 $-Z-N(R^{B9})(R^{B10})$
 25 (substituentgruppe C, R^{B9} , R^{B10} og Z er de samme som de i krav 13).
- 30 **18.** Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 13 til 16 eller det farmasøytisk akseptable saltet derav eller solvatet derav, hvori R^{2a} er hydrogen eller lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C
 (substituentgruppe C er den samme som i krav 13).
- 35 **19.** Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 13 til 18 eller det farmasøytisk akseptable saltet derav eller solvatet derav,
 hvori R^{3a} er hydrogen, lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkynyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbosykel-lavalkyl eventuelt substituert med

substituentgruppe C, karbocykeloksyfavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, heterocykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C,

-Z-N(R^{C1})-SO₂-R^{C2},

5 -Z-N (R^{C3})-C(=O)-R^{C4},

-Z-N(R^{C5})-C(=O)-O-R^{C6},

-Z-C(=O)-N(R^{C7}(R^{C8}) eller

-Z-N(R^{C9})(R^{C10})

10 (substituentgruppe C, R^{C1}, R^{C2}, R^{C3}, R^{C4}, R^{C5}, R^{C6}, R^{C7}, R^{C8}, R^{C9}, R^{C10} og Z er de samme som de i krav 13).

20. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 13 til 18 eller det farmasøytisk akseptable saltet derav eller solvatet derav,

15 hvori R^{3a} er hydrogen, lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en karbocyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, en heterocyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbocykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, (substituentgruppe C er den samme som i krav 13).

20 **21.** Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 13 til 20 eller det farmasøytisk akseptable saltet derav eller solvatet derav, hvori B¹ er NR^{7a}, og B² er CR^{5a}R^{6a}, og

R^{5a}, R^{6a} og R^{7a} hver uavhengig er hydrogen, karboksy, cyano, lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkenyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkynyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkylkarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, lavalkyloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en karbocyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbocykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbocykeloksyfavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbocykelkarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbocykeloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en heterocyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, heterocykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, heterocykeloksyfavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, heterocykelkarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, heterocykeloksykarbonyl eventuelt substituert med substituentgruppe C,

25

30

35

$-Y-S-R^{D1}$,
 $-Z-S(=O)-R^{D2}$,
 $-Z-SO_2-R^{D3}$,
 $-C(=O)-C(=O)-R^{D4}$,
 $-C(=O)-N(R^{D5})(R^{D6})$,
 $-Z-C(R^{D7})(R^{D8})(R^{D9})$
 $-Z-N(R^{D11})-C(=O)-O-R^{D12}$ eller
 $-Z-N(R^{D13})-C(=O)-R^{D14}$
 (substituentgruppe C, R^{D1} , R^{D2} , R^{D3} , R^{D4} , R^{D5} , R^{D6} , R^{D7} , R^{D8} , R^{D9} , R^{D11} , R^{D12} , R^{D13} ,
 R^{D14} , Y og Z er de samme som de i krav 13).

22. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 13 til 20 eller det farmasøytisk akseptable saltet derav eller solvatet derav,

hvor B^1 er NR^{7a} , og B^2 er $CR^{5a}R^{6a}$,

R^{5a} er hydrogen,

R^{6a} er hydrogen eller lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, og
 R^{7a} er lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en karbocyklisk
 gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbocykeloksyllavalkyl
 eventuelt substituert med substituentgruppe C, en heterocyklisk gruppe eventuelt
 substituert med substituentgruppe C, karbocykel-lavalkyl eventuelt substituert
 med substituentgruppe C, heterocykel-lavalkyl eventuelt substituert med
 substituentgruppe C eller

$-Z-C(R^{D7})(R^{D8})(R^{D9})$

(substituentgruppe C, R^{D7} , R^{D8} , R^{D9} og Z er de samme som i krav 13).

23. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 13 til 20 eller det farmasøytisk akseptable saltet derav eller solvatet derav,

hvor B^1 er $CR^{5a}R^{6a}$, og B^2 er NR^{7a} ,

R^{5a} er hydrogen,

R^{6a} er hydrogen eller lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, og
 R^{7a} er lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en karbocyklisk
 gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbocykeloksyllavalkyl
 eventuelt substituert med substituentgruppe C, en heterocyklisk gruppe eventuelt
 substituert med substituentgruppe C, karbocykel-lavalkyl eventuelt substituert
 med substituentgruppe C, heterocykel-lavalkyl eventuelt substituert med
 substituentgruppe C eller

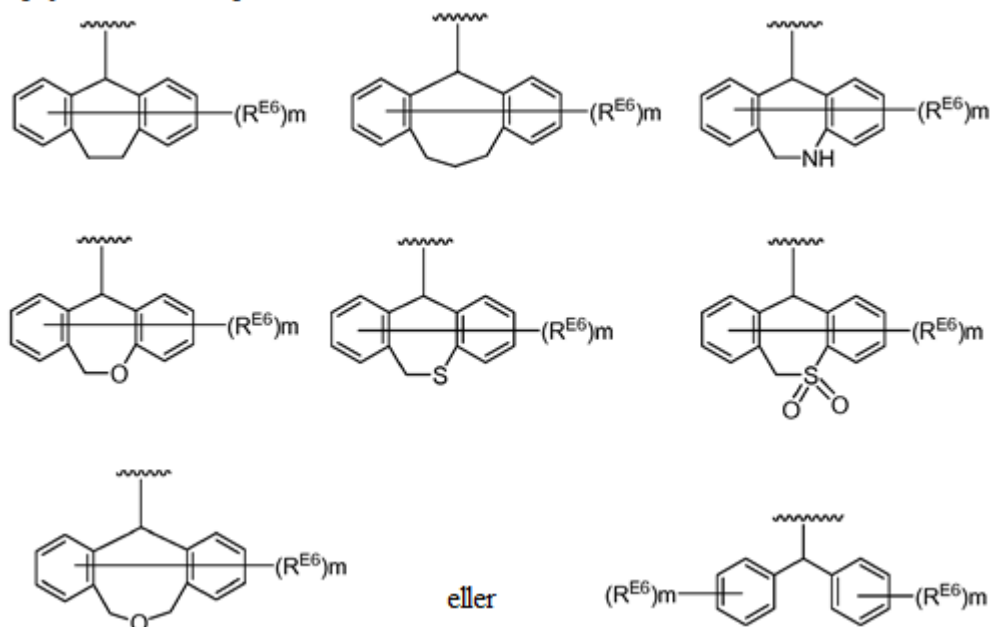
$-Z-C(R^{D7})(R^{D8})(R^{D9})$

(substituentgruppe C, R^{D7} , R^{D8} , R^{D9} og Z er de samme som i krav 13).

24. Forbindelsen ifølge krav 22 eller 23 eller det farmasøytisk akseptable saltet derav eller solvatet derav,

5 hvori R^{7a} er en gruppe vist nedenfor:

[Kjemisk formel 6]



(hvori R^{E6} og m er de samme som de ifølge krav 13).

25. Forbindelsen ifølge krav 13 eller 20 eller det farmasøytisk akseptable saltet derav eller solvatet derav, hvori

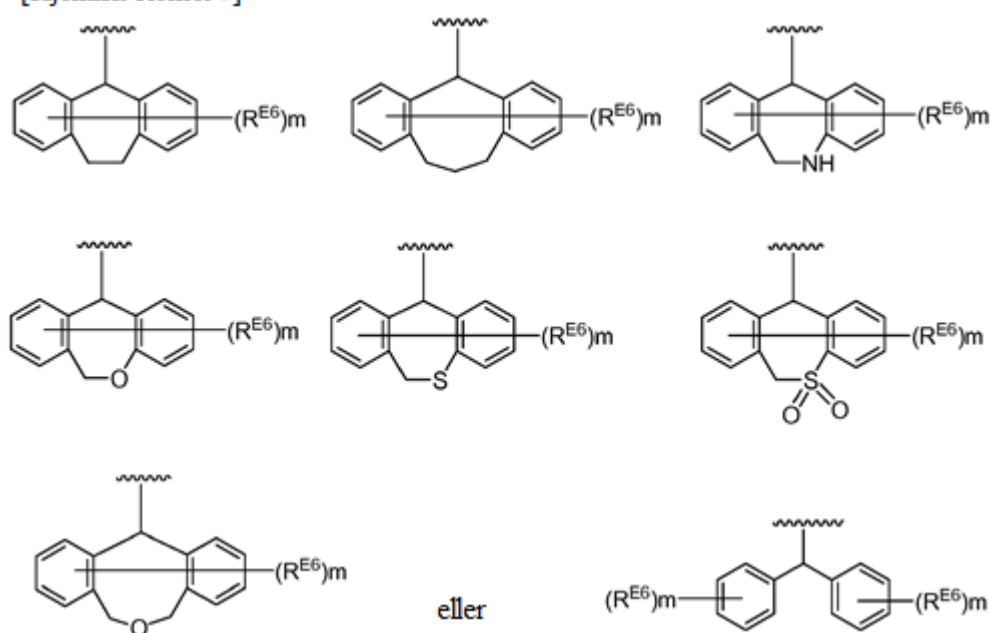
10

B^1 er $CR^{8a}R^{9a}$, og B^2 er $CR^{10a}R^{11a}$,

R^{9a} er hydrogen, og R^{11a} er hydrogen, og

i) enten R^{8a} eller R^{10a} er en gruppe vist nedenfor:

[Kjemisk formel 7]



(hvori R^{E6} og m er de samme som de i krav 13); og

ii) den andre av R^{8a} eller R^{10a} er

hydrogen eller lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C,

(substituentgruppe C er den samme som de i krav 13).

26. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 13 til 18 eller det farmasøytisk akseptable saltet derav eller solvatet derav,

hvori B^1 er $CR^{5a}R^{6a}$, og B^2 er NR^{7a} ,

R^{6a} er hydrogen,

R^{3a} og R^{7a} kan tas sammen med et tilstøtende atom for å danne en heterosykel eventuelt substituert med substituentgruppe D, og

R^{5a} er hydrogen, lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en karbosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbosykel-

lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbosykeloksyllavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C,

en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C,

heterosykeloksyllavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C,

$-Y-S-R^{D1}$,

$-C(=O)-C(=O)-R^{D2}$ eller

$-C(=O)-N(R^{D3})(R^{D4})$

(hvori R^{D1} , R^{D2} , R^{D3} , R^{D4} , Y, substituentgruppe C og substituentgruppe D er de samme som i krav 13).

27. Forbindelsen ifølge krav 26 eller det farmasøytisk akseptable saltet derav eller solvatet derav,

hvor R^{5a} er hydrogen, en karbocyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbocykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C eller heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C

(hvor substituentgruppe C er den samme som i krav 13).

28. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 13 til 18 eller det farmasøytisk akseptable saltet derav eller solvatet derav,

hvor B^1 er $CR^{8a}R^{9a}$, og B^2 er $CR^{10a}R^{11a}$,

R^{9a} er hydrogen, og R^{10a} er hydrogen,

R^{3a} og R^{11a} er tatt sammen med et tilstøtende atom for å danne en heterosykel eventuelt substituert med substituentgruppe D, og

R^{8a} er hydrogen, lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en karbocyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbocykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbocykeloksy-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, heterosykeloksy-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C,

$-Y-S-R^{D1}$,

$-C(=O)-C(=O)-R^{D2}$ eller

$-C(=O)-N(R^{D3}(R^{D4}))$

(hvor R^{D1} , R^{D2} , R^{D3} , R^{D4} , Y, substituentgruppe C og substituentgruppe D er de samme som i krav 13).

29. Forbindelsen ifølge krav 28 eller det farmasøytisk akseptable saltet derav eller solvatet derav,

hvor R^{8a} er hydrogen, en karbocyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbocykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C eller heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C

(hvor substituentgruppe C er den samme som den i krav 13).

30. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 26 til 29 eller det farmasøytisk akseptable saltet derav eller solvatet derav,

hvor substituentgruppe D er en karboksylgruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, en heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med substituentgruppe C, karbocykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C eller heterosykel-lavalkyl eventuelt substituert med substituentgruppe C (hvor substituentgruppe C er den samme som i krav 13).

31. Forbindelsen ifølge krav 13 eller det farmasøytisk akseptable saltet derav eller solvatet derav,

hvor

R^{1a} er hydrogen eller karboksy;

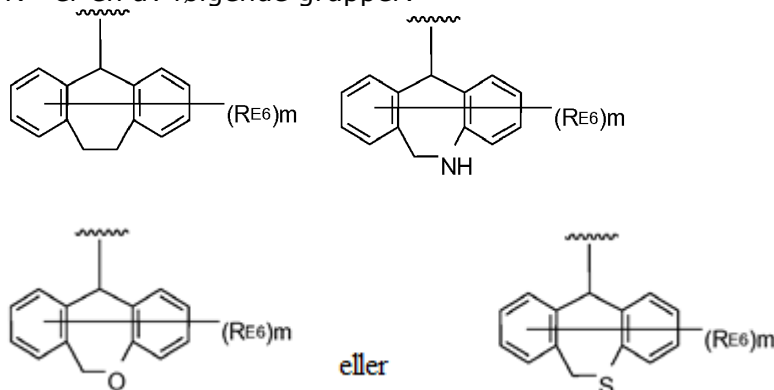
R^{2a} er hydrogen;

B^1 er NR^{7a} , og B^2 er $CR^{5a}R^{6a}$;

R^{3a} og R^{6a} er tatt sammen med et tilstøtende atom for å danne en heterosykel eventuelt substituert med substituentgruppe D (hvor substituentgruppe D er den samme som i krav 13);

R^{5a} er hydrogen; og

R^{7a} er én av følgende grupper:



(hvor hver R^{E6} er den samme eller forskjellige grupper bestående av halogen, cyano, hydrokso, karboksy, formyl, amino, okso, nitro, lavalkyl, halogenolavalkyl, lavalkyloksy og halogenolavalkyloksy, og m er et heltall på 0 til 2).

32. Farmasøytisk sammensetning inneholdende en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 13 til 31 farmasøytisk akseptabelt salt derav eller et solvat derav.

33. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 13 til 31 eller det farmasøytisk akseptable saltet derav eller solvatet derav for anvendelse i behandling og/eller forebygging av en influensainfeksjonssykdom.