



(12) Translation of
european patent specification

(11) NO/EP 2726469 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 267/14 (2006.01)
A61K 31/553 (2006.01)
C07D 413/04 (2006.01)
C07D 413/12 (2006.01)
C07D 413/14 (2006.01)
C07D 498/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2015.12.28
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2015.08.12
(86)	European Application Nr.	12735400.9
(86)	European Filing Date	2012.06.29
(87)	The European Application's Publication Date	2014.05.07
(30)	Priority	2011.07.01, US, 201161503980 P
(84)	Designated Contracting States: Designated Extension 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 BA ME
(73)	Proprietor	Gilead Sciences, Inc., 333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US-USA
(72)	Inventor	CORKEY, Britton, Kenneth, c/o Gilead Sciences, Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US-USA ELZEIN, Elfatih, c/o Gilead Sciences, Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US-USA JIANG, Robert, H., c/o Gilead Sciences, Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US- USA KALLA, Rao, V., c/o Gilead Sciences, Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US-USA KOLTUN, Dmitry, c/o Gilead Sciences, Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US- USA LI, Xiaofen, c/o Gilead Sciences, Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US-USA MARTINEZ, Ruben, c/o Gilead Sciences, Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US- USA PARKHILL, Eric, Q., c/o Gilead Sciences, Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US- USA PERRY, Thao, c/o Gilead Sciences, Inc.333 Lakeside Drive, Foster Ciy, CA 94404, US-USA ZABLOCKI, Jeff, c/o Gilead Sciences, Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US-USA VENKATARAMANI, Chandrasekar, c/o Gilead Sciences, Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US-USA GRAUPE, Michael, c/o Gilead Sciences, Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US- USA GUERRERO, Juan, c/o Gilead Sciences, Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US- USA
(74)	Agent or Attorney	Tandbergs Patentkontor AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

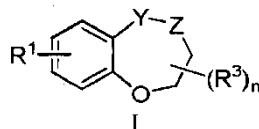
(54) Title **OXAZEPINES AS ION CHANNEL MODULATORS**

(56) References
Cited: US-A1- 2011 076 292
L. I. BARSKY. W. L. BENCZE: "Hypoglycemic Cyclic Amidines", J. MED. CHEM., vol. 14, no. 1,
1971, pages 40-44, XP002682484,

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. En forbindelse med formel I:



5

hvor:

-Y-Z- er $-C(=NR^4)-NR^2-$ eller $-C(NR^5R^6)=N-$;

R^1 er aryl, cykloalkyl, cykloalkenyl, heterocyklyl eller heteroaryl;

10 hvor nevnte aryl, cykloalkyl, cykloalkenyl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-NO_2$, $-CN$, $-SF_5$, $Si(CH_3)_3$, $-O-R^{20}$, $-S-R^{20}$, $-C(O)-R^{20}$, $-C(O)-OR^{20}$, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$, $-N(R^{20})-C(O)-R^{22}$, $-N(R^{20})-C(O)-OR^{22}$, $-N(R^{20})-S(=O)_2-R^{26}$, $-S(=O)_2-R^{20}$, $-O-S(-O)_2-R^{20}$, $-S(=O)_2-N(R^{20})(R^{22})$,
15 C_{1-6} alkyl, C_{2-4} alkenyl, C_{2-4} alkynyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl og heterocyklyl;
og

hvor nevnte C_{1-6} alkyl, C_{2-4} alkenyl, C_{2-4} alkynyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-NO_2$, fenyl, heterocyklyl, heteroaryl,
20 C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-R^{20}$, $-C(O)-OR^{20}$, $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$, $-CN$ og $-O-R^{20}$;

R^2 er hydrogen, alkyl, $-C(O)-R^{20}$, $-C(O)-OR^{26}$, $-C(O)-N(R^{26})(R^{26})$, $-N(R^{20})-S(=O)_2-R^{20}$, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl;

hvor nevnte C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl eventuelt er
25 substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av C_{1-6} alkyl, C_{2-4} alkynyl, halogen, $-NO_2$, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-R^{20}$, $-C(O)-OR^{20}$, $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$, $-CN$, okso og $-O-R^{20}$;

hvor nevnte C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er
30 ytterligere substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-NO_2$, C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-R^{20}$, $-C(O)-OR^{20}$, $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$, $-CN$ og $-O-R^{20}$; og

hvor nevnte C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er
35 ytterligere substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra

gruppen bestående av halogen, $-\text{NO}_2$, $-\text{CF}_3$, $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{CN}$, $-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^{20}$ og $-\text{O}-\text{R}^{20}$;

n er 0, 1, 2, 3 eller 4;

hver R^3 er uavhengig C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl;

5 hvor nevnte C_{1-6} alkyl er eventuelt substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-\text{NO}_2$, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{CN}$ og $-\text{O}-\text{R}^{20}$;

10 hvor nevnte cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-\text{NO}_2$, C_{1-6} alkyl, aralkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{CN}$ og $-\text{O}-\text{R}^{20}$; og

15 hvor nevnte C_{1-6} alkyl, aralkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl, eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-\text{NO}_2$, $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{CN}$ og $-\text{O}-\text{R}^{20}$,

eller to R^3 festet til et felles karbonatom danner en okso;

20 eller to R^3 festet til et felles eller nærliggende karbonatomer, danner en cykloalkyl eller heterocyklyl;

hvor nevnte cykloalkyl eller heterocyklyl eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-\text{NO}_2$, C_{1-6} alkyl, aralkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{CN}$ og $-\text{O}-\text{R}^{20}$;

25 R^4 er C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl;

hvor nevnte C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-\text{NO}_2$, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{CN}$ og $-\text{O}-\text{R}^{20}$;

30 hvor nevnte cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-\text{NO}_2$, C_{1-6} alkyl, aralkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{CN}$ og $-\text{O}-\text{R}^{20}$; og

35 hvor nevnte C_{1-6} alkyl, aralkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halogen, $-\text{NO}_2$, $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{CN}$ og $-\text{O}-\text{R}^{20}$;

eller R^2 og R^4 kan gå sammen med atomet til hvilket de er bundet for å danne en heterocyklyl eller heteroaryl;

hvor nevnte heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, heteroaryl, $-CN$, $-O-R^{20}$, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-R^{20}$, $-N(R^{20})-C(O)-OR^{20}$ og $-C(O)-OR^{20}$; og

hvor nevnte C_{1-6} alkyl eller heteroaryl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-CN$, $-OR^{20}$, C_{1-6} alkyl, aryl og heteroaryl;

R^5 er hydrogen, C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl;

hvor nevnte C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-NO_2$, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-R^{20}$, $-C(O)-OR^{20}$, $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$, $-CN$ og $-O-R^{20}$;

hvor nevnte cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-NO_2$, C_{1-6} alkyl, aralkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-R^{20}$, $-C(O)-OR^{20}$, $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$, $-CN$ og $-O-R^{20}$; og

hvor nevnte C_{1-6} alkyl, aralkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halogen, $-NO_2$, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-R^{20}$, $-C(O)-OR^{20}$;

R^6 er C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl; hvor nevnte

C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-NO_2$, C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-R^{20}$, $-C(O)-OR^{20}$, $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$, $-CN$ og $-O-R^{20}$;

hvor nevnte C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-NO_2$, C_{1-6} alkyl, aralkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-R^{20}$, $-C(O)-OR^{20}$, $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$, $-CN$ og $-O-R^{20}$; og

hvor nevnte C_{1-6} alkyl, aralkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halogen, $-NO_2$, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-R^{20}$, $-C(O)-OR^{20}$;

eller R^5 og R^6 kan gå sammen med atomet til hvilket de er bundet for å danne en heterocyklyl eller heteroaryl;

hvor nevnte heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituenters uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, heterocyklyl, aryl, heteroaryl, okso, $-CN$, $-OR^{20}$, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-N(R^{20})-C(O)-R^{20}$, $-N(R^{20})-C(O)-OR^{20}$ og $-C(O)-OR^{20}$; og

hvor nevnte C_{1-6} alkyl eller heterocyklyl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituenters uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, okso, heteroaryl og $-OR^{20}$;

R^{20} og R^{22} er i hvert tilfelle uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydrogen, C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, heterocyklyl, aryl og heteroaryl; og

hvor C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, heterocyklyl, aryl og heteroaryl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituenters uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halogen, C_{1-4} alkyl, acylamino, okso, $-NO_2$, $-SO_2R^{26}$, $-CN$, C_{1-3} alkoksy, aryloksy, $-CF_3$, $-OCF_3$, $-OCH_2CF_3$, $-C(O)-NH_2$, aryl, cykloalkyl og heteroaryl;

hvor nevnte heteroaryl eventuelt er ytterligere substituert med C_{1-4} alkyl eller cykloalkyl; eller

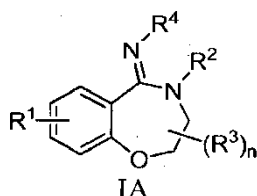
når R^{20} og R^{22} er festet til et felles nitrogenatom, kan R^{20} og R^{22} gå sammen om å danne en heterocyklyl eller heteroaryl, som deretter eventuelt er substituert med en, to eller tre substituenters uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halogen, C_{1-4} alkyl, aralkyl, aryloksy, aralkyloksy, acylamino, $-NO_2$, $-SO_2R^{26}$, $-CN$, C_{1-3} alkoksy, $-CF_3$, $-OCF_3$, aryl, heteroaryl og cykloalkyl; og

hvor R^{26} er uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydrogen, C_{1-4} alkyl, aryl og cykloalkyl;

hvor C_{1-4} alkyl, aryl og cykloalkyl kan være ytterligere substituert med fra 1 til 3 substituenters uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halogen, C_{1-4} alkoksy, $-CF_3$ og $-OCF_3$;

eller et farmasøytisk akseptabelt salt, stereoisomer, blanding av stereoisomerer, eller tautomer derav; forutsatt at når R^2 og R^4 tas sammen med atomet som de er bundet til, danner en eventuelt substituert imidazolyl, det imidazolyl det ikke er direkte substituert med en eventuelt substituert triazolyl, eller R^1 er ikke eventuelt substituert pyrazolyl, 2-pyridinonyl eller 2-fluorpyridinyl.

2. Forbindelse med formel I representert ved formel IA:



hvor:

R^1 er aryl, cykloalkyl, cykloalkenyl, heterocyklyl eller heteroaryl; hvor nevnte aryl, cykloalkyl, cykloalkenyl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-\text{NO}_2$, $-\text{CN}$, $-\text{SF}_5$, $\text{Si}(\text{CH}_3)_3$, $-\text{O}-\text{R}^{20}$, $-\text{S}-\text{R}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$, $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{N}(\text{R}^{20})-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{22}$, $-\text{N}(\text{R}^{20})-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{22}$, $-\text{N}(\text{R}^{20})-\text{S}(=\text{O})_2-\text{R}^{26}$, $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{R}^{20}$, $-\text{O}-\text{S}(=\text{O})_2-\text{R}^{20}$, $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, C_{1-6} alkyl, C_{2-4} alkenyl, C_{2-4} alkynyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl og heterocyklyl;

og

hvor nevnte C_{1-6} alkyl, C_{2-4} alkenyl, C_{2-4} alkynyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-\text{NO}_2$, fenyl, heterocyklyl, heteroaryl, C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{CN}$ og $-\text{O}-\text{R}^{20}$;

R^2 er hydrogen, C_{1-6} alkyl, $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{26}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{26})(\text{R}^{26})$, $-\text{N}(\text{R}^{20})-\text{S}(=\text{O})_2-\text{R}^{20}$, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl; hvor nevnte C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av C_{1-6} alkyl, C_{2-4} alkynyl, halogen, $-\text{NO}_2$, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{CN}$, okso og $-\text{O}-\text{R}^{20}$;

hvor nevnte C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-\text{NO}_2$, C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{CN}$ og $-\text{O}-\text{R}^{20}$; og hvor nevnte C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-\text{NO}_2$, $-\text{CF}_3$, $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{CN}$, $-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^{20}$ og $-\text{O}-\text{R}^{20}$;

og hvor nevnte C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-\text{NO}_2$, $-\text{CF}_3$, $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{CN}$, $-\text{S}(\text{O})_2-\text{R}^{20}$ og $-\text{O}-\text{R}^{20}$;

n er 0, 1, 2, 3 eller 4;

hver R^3 er uavhengig C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl; hvor nevnte C_{1-6} alkyl er eventuelt substituert med en, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-\text{NO}_2$, cykloalkyl, aryl,

heterocyklyl, heteroaryl, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-R^{20}$, $-C(O)-OR^{20}$, $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$, $-CN$ og $-O-R^{20}$;

hvor nevnte cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen

5 bestående av halogen, $-NO_2$, C_{1-6} alkyl, aralkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-R^{20}$, $-C(O)-OR^{20}$, $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$, $-CN$ og $-O-R^{20}$; og

hvor nevnte C_{1-6} alkyl, aralkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl, eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-NO_2$, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-R^{20}$, $-C(O)-OR^{20}$, $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$, $-CN$ og $-O-R^{20}$;

10 eller to R^3 festet til et felles karbonatom danner en okso;

eller to R^3 festet til et felles eller nærliggende karbonatomer, danner en

cykloalkyl eller heterocyklyl;

15 hvor nevnte cykloalkyl eller heterocyklyl eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-NO_2$, C_{1-6} alkyl, aralkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-R^{20}$, $-C(O)-OR^{20}$, $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$, $-CN$ og $-O-R^{20}$;

R^4 er C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl;

20 hvor nevnte C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-NO_2$, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-R^{20}$, $-C(O)-OR^{20}$, $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$, $-CN$ og $-O-R^{20}$;

hvor nevnte cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-NO_2$, C_{1-6} alkyl, aralkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-R^{20}$, $-C(O)-OR^{20}$, $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$, $-CN$ og $-O-R^{20}$; og

30 hvor nevnte C_{1-6} alkyl, aralkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halogen, $-NO_2$, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-R^{20}$, $-C(O)-OR^{20}$, $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$, $-CN$ og $-O-R^{20}$;

eller R^2 og R^4 kan gå sammen med atomet til hvilket de er bundet for å danne en heterocyklyl eller heteroaryl;

35 hvor nevnte heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, heteroaryl, $-CN$, $-O-R^{20}$, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-R^{20}$, $-N(R^{20})-C(O)-OR^{20}$ og $-C(O)-OR^{20}$; og

hvor nevnte C₁₋₆alkyl eller heteroaryl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, -CN, -OR²⁰, C₁₋₆alkyl, aryl og heteroaryl;

R²⁰ og R²² er i hvert tilfelle uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydrogen,

C₁₋₆alkyl, cykloalkyl, heterocyklyl, aryl og heteroaryl; og

hvor C₁₋₆alkyl, cykloalkyl, heterocyklyl, aryl og heteroaryl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halogen, C₁₋₄alkyl, acylamino, okso, -NO₂, -SO₂R²⁶, -CN, C₁₋₃alkoksy, aryloksy, -CF₃, -OCF₃, -OCH₂CF₃, -C(O)-NH₂, aryl,

cykloalkyl og heteroaryl;

hvor nevnte heteroaryl eventuelt er ytterligere substituert med C₁₋₄alkyl eller cykloalkyl; eller

når R²⁰ og R²² er festet til et felles nitrogenatom, kan R²⁰ og R²² gå sammen for å danne en heterocyklyl eller heteroaryl, som deretter eventuelt er substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halogen, C₁₋₄alkyl, aralkyl, aryloksy, aralkyloksy, acylamino, -NO₂, -SO₂R²⁶, -CN, C₁₋₃alkoksy, -CF₃, -OCF₃, aryl, heteroaryl og cykloalkyl; og

hvor R²⁶ er uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydrogen, C₁₋₄alkyl, aryl og cykloalkyl;

hvor C₁₋₄alkyl, aryl og cykloalkyl kan være ytterligere substituert med fra 1 til 3 substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halogen, C₁₋₄alkoksy, -CF₃ og -OCF₃;

eller et farmasøytisk akseptabelt salt, stereoisomer, blanding av stereoisomerer, eller tautomer derav; forutsatt at når R² og R⁴ tas sammen med atomet som de er

bundet til, danner en eventuelt substituert imidazolyl, er imidazolylet det ikke er direkte substituert med en eventuelt substituert triazolyl, eller R¹ er ikke eventuelt substituert pyrazolyl, 2-pyridinonyl eller 2-fluorpyridinyl.

3. Forbindelse ifølge krav 2, hvor:

R¹ er aryl, cykloalkyl, cykloalkenyl, heterocyklyl eller heteroaryl; hvor nevnte aryl, cykloalkyl, cykloalkenyl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, -NO₂, -CN, -SF₅, Si(CH₃)₃, -O-R²⁰, -S-R²⁰, -C(O)-R²⁰, -C(O)-OR²⁰, -N(R²⁰)(R²²), -C(O)-N(R²⁰)(R²²), -N(R²⁰)-C(O)-R²², -N(R²⁰)-C(O)-OR²², -N(R²⁰)-S(=O)₂-R²⁶, -S(=O)₂-R²⁰, -O-S(=O)₂-R²⁰, -S(=O)₂-N(R²⁰)(R²²), C₁₋₆alkyl, C₂₋₄alkenyl, C₂₋₄alkynyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl og heterocyklyl; og

hvor nevnte C₁₋₆alkyl, C₂₋₄alkenyl, C₂₋₄alkenyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, -NO₂, fenyl, heterocyklyl, heteroaryl, C₁₋₆alkyl, cykloalkyl, -N(R²⁰)(R²²), -C(O)-R²⁰, -C(O)-OR²⁰, -C(O)-N(R²⁰)(R²²), -CN og -O-R²⁰;

n er 0; og

R² og R⁴ tas sammen med atomet til hvilket de er bundet for å danne en heterocyklyl eller heteroaryl;

hvor nevnte heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁₋₆alkyl, cykloalkyl, heteroaryl, -CN, -O-R²⁰, -N(R²⁰)(R²²), -C(O)-R²⁰, -N(R²⁰)-C(O)-OR²⁰ og -C(O)-OR²⁰; og

hvor nevnte C₁₋₆alkyl eller heteroaryl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, -CN, -O-R²⁰, C₁₋₆alkyl, aryl og heteroaryl.

4. Forbindelse ifølge krav 2, hvor:

R¹ er aryl;

hvor nevnte aryl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, -NO₂, -CN, -SF₅, Si(CH₃)₃, -O-R²⁰, -S-R²⁰, -C(O)-R²⁰, -C(O)-OR²⁰, -N(R²¹)(R²²), -C(O)-N(R²⁰)(R²²), -N(R²⁰)-C(O)-R²², -N(R²⁰)-C(O)-OR²², -N(R²⁰)-S(=O)₂-R²⁶, -S(=O)₂-R²⁰, -O-S(=O)₂-R²⁰, -S(=O)₂-N(R²⁰)(R²²), C₁₋₆alkyl, C₂₋₄alkenyl, C₂₋₄alkynyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl og heterocyklyl; og

hvor nevnte C₁₋₆alkyl, C₂₋₄alkenyl, C₂₋₄alkynyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, -NO₂, fenyl, heterocyklyl, heteroaryl, C₁₋₆alkyl, cykloalkyl, -N(R²⁰)(R²²), -C(O)-R²⁰, -C(O)-OR²⁰, -C(O)-N(R²⁰)(R²²), -CN og -O-R²⁰;

n er 0; og

R² og R⁴ tas sammen med atomet til hvilket de er bundet for å danne en heterocyklyl eller heteroaryl;

hvor nevnte heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁₋₆alkyl, cykloalkyl, heteroaryl, -CN, -O-R²⁰, -N(R²⁰)(R²²), -C(O)-R²⁰, -N(R²⁰)-C(O)-OR²⁰ og -C(O)-OR²⁰; og

hvor nevnte C₁₋₆alkyl eller heteroaryl eventuelt er substituert med en, to eller tre

substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, -CN, -O-R²⁰, C₁₋₆alkyl, aryl og heteroaryl.

5. Forbindelse ifølge krav 2, hvor:

5

R¹ er aryl eventuelt substituert med -O-R²⁰ eller C₁₋₆alkyl; og hvor nevnte C₁₋₆alkyl er eventuelt substituert med en, to eller tre halogen; n er 0;

10

R² og R⁴ tas sammen med atomet til hvilket de er bundet for å danne en heterocyklyl eller heteroaryl;

hvor nevnte heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁₋₆alkyl, cykloalkyl, heteroaryl, -CN, -O-R²⁰, -N(R²⁰)(R²²), -C(O)-R²⁰, -N(R²⁰)-C(O)-OR²⁰ og -C(O)-OR²⁰; og

15

hvor nevnte C₁₋₆alkyl eller heteroaryl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, -CN, -O-R²⁰, C₁₋₆alkyl, aryl og heteroaryl.

6. Forbindelse ifølge krav 2, karakterisert ved at:

20

R¹ er fenyl substituert med -O-CF₃ eller -CF₃; n er 0; og

R² og R⁴ tas sammen med atomet til hvilket de er bundet for å danne en heterocyklyl eller heteroaryl;

25

hvor nevnte heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁₋₆alkyl, cykloalkyl, heteroaryl, -CN, -C(O)-R²⁰, -N(R²⁰)-C(O)-OR²⁰ og -C(O)-OR²⁰; og hvor nevnte C₁₋₆alkyl eller heteroaryl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, -CN, -O-R²⁰, C₁₋₆alkyl, aryl og heteroaryl.

30

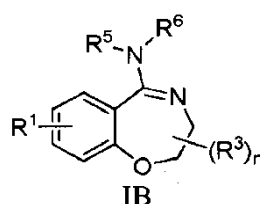
7. Forbindelse valgt fra gruppen bestående av:

I-5	3-cyklopropyl-10-(4-(trifluormetyl)fenyl)-5,6-dihydrobenzo[f][1,2,4]triazolo[4,3-d][1,4]oksazepin
I-6	3-metyl-10-(4-(trifluormetyl)fenyl)-5,6-dihydrobenzo[f]imidazo[1,2-d][1,4]oksazepin

I-7	3-(pyrimidin-2-yl)-10-(4-(trifluormetyl)fenyl)-5,6-dihydrobenzo[f]imidazo[1,2-d][1,4]oksazepin
I-18	3-cyklopropyl-10-(4-(trifluormetoksy)fenyl)-5,6-dihydrobenzo[f]imidazo[1,2-d][1,4]oksazepin

eller et farmasøytisk akseptabelt salt, stereoisomer, blanding av stereoisomerer, eller tautomer derav.

5 **8.** Forbindelse med formel I representert ved formel Ib:



hvor:

- 10 R^1 er aryl, cykloalkyl, cykloalkenyl, heterocyklyl eller heteroaryl; hvor nevnte aryl, cykloalkyl, cykloalkenyl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-\text{NO}_2$, $-\text{CN}$, $-\text{SF}_5$, $\text{Si}(\text{CH}_3)_3$, $-\text{O}-\text{R}^{20}$, $-\text{S}-\text{R}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$, $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{N}(\text{R}^{20})-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{22}$, $-\text{N}(\text{R}^{20})-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{22}$, $-\text{N}(\text{R}^{20})-\text{S}(=\text{O})_2-\text{R}^{26}$, $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{R}^{20}$, $-\text{O}-\text{S}(=\text{O})_2-\text{R}^{20}$, $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, C_{1-6} alkyl, C_{2-4} alkenyl, C_{2-4} alkynyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl og heterocyklyl; og
- 15 hvor nevnte C_{1-6} alkyl, C_{2-4} alkenyl, C_{2-4} alkynyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-\text{NO}_2$, fenyl, heterocyklyl, heteroaryl, C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{CN}$ og $-\text{O}-\text{R}^{20}$;
- 20 n er 0, 1, 2, 3 eller 4;
- hvor R^3 er uavhengig C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl; hvor nevnte C_{1-6} alkyl er eventuelt substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-\text{NO}_2$, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{CN}$ og $-\text{O}-\text{R}^{20}$;
- 25 hvor nevnte cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen

bestående av halogen, $-\text{NO}_2$, C_{1-6} alkyl, aralkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{CN}$ og $-\text{O}-\text{R}^{20}$; og

hvor nevnte C_{1-6} alkyl, aralkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl, eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-\text{NO}_2$, $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{CN}$ og $-\text{O}-\text{R}^{20}$;

eller to R^3 festet til et felles karbonatom danner en okso;

eller to R^3 festet til et felles eller nærliggende karbonatomer, danner en

cykloalkyl eller heterocyklyl;

hvor nevnte cykloalkyl eller heterocyklyl som eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-\text{NO}_2$, C_{1-6} alkyl, aralkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{CN}$ og $-\text{O}-\text{R}^{20}$;

R^5 er hydrogen, C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl;

hvor nevnte C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-\text{NO}_2$, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{CN}$ og $-\text{O}-\text{R}^{20}$;

hvor nevnte cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-\text{NO}_2$, C_{1-6} alkyl, aralkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{CN}$ og $-\text{O}-\text{R}^{20}$; og

hvor nevnte C_{1-6} alkyl, aralkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halogen, $-\text{NO}_2$, $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$;

R^6 er C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl;

hvor nevnte C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-\text{NO}_2$, C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{CN}$ og $-\text{O}-\text{R}^{20}$;

hvor nevnte C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-\text{NO}_2$, C_{1-6} alkyl, aralkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{CN}$ og $-\text{O}-\text{R}^{20}$; og

hvor nevnte C₁₋₆alkyl, aralkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halogen, -NO₂, -N(R²⁰)(R²²), -C(O)-R²⁰, -C(O)-OR²⁰;

5 eller R⁵ og R⁶ kan gå sammen med atomet til hvilket de er bundet for å danne en heterocyklyl eller heteroaryl;

hvor nevnte heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁₋₆alkyl, cykloalkyl, heterocyklyl, aryl, heteroaryl, okso, -CN, -O-R²⁰, -N(R²⁰)(R²²),
10 -N(R²⁰)-C(O)-R²⁰, -N(R²⁰)-C(O)-OR²⁰ og -C(O)-OR²⁰;

og

hvor nevnte C₁₋₆alkyl eller heterocyklyl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, okso, heteroaryl og -O-R²⁰;

15 R²⁰ og R²² er i hvert tilfelle uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydrogen, C₁₋₆alkyl, cykloalkyl, heterocyklyl, aryl og heteroaryl; og

hvor C₁₋₆alkyl, cykloalkyl, heterocyklyl, aryl og heteroaryl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halogen, C₁₋₄alkyl, acylamino, okso, -NO₂, -SO₂R²⁶,
20 -CN, C₁₋₃alkoksy, aryloksy, -CF₃, -OCF₃, -OCH₂CF₃, -C(O)-NH₂, aryl, cykloalkyl og heteroaryl;

hvor nevnte heteroaryl eventuelt er ytterligere substituert med C₁₋₄alkyl eller cykloalkyl; eller

når R²⁰ og R²² er festet til et felles nitrogenatom, kan R²⁰ og R²² gå sammen for å
25 danne en heterocyklyl eller heteroaryl, som deretter eventuelt substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halogen, C₁₋₄alkyl, aralkyl, aryloksy, aralkyloksy, acylamino, -NO₂, -SO₂R²⁶, -CN, C₁₋₃alkoksy, -CF₃, -OCF₃, aryl, heteroaryl og cykloalkyl; og

hver R²⁶ er uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydrogen, C₁₋₄alkyl, aryl og
30 cykloalkyl;

hvor C₁₋₄alkyl, aryl og cykloalkyl kan være ytterligere substituert med fra 1 til 3 substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halogen, C₁₋₄alkoksy, -CF₃ og -OCF₃;

eller et farmasøytisk akseptabelt salt, stereoisomer, blanding av stereoisomerer,
35 eller tautomer derav.

9. Forbindelse ifølge krav 8, hvor:

R^1 er aryl, cykloalkyl, cykloalkenyl, heterocyklyl eller heteroaryl;
 hvor nevnte aryl, cykloalkyl, cykloalkenyl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt
 er substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen
 bestående av halogen, $-NO_2$, $-CN$, $-SF_5$, $Si(CH_3)_3$, $-O-R^{20}$, $-S-R^{20}$, $-C(O)-R^{20}$,
 5 $-C(O)-OR^{20}$, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$, $-N(R^{20})-C(O)-R^{22}$, $-N(R^{20})-C(O)-$
 OR^{22} , $-N(R^{20})-S(=O)_2-R^{26}$, $-S(=O)_2-R^{20}$, $-O-S(=O)_2-R^{20}$, $-S(=O)_2-N(R^{20})(R^{22})$,
 C_{1-6} alkyl, C_{2-4} alkenyl, C_{2-4} alkynyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl og heterocyklyl;
 og
 hvor nevnte C_{1-6} alkyl, C_{2-4} alkenyl, C_{2-4} alkynyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller
 10 heterocyklyl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig
 valgt fra gruppen bestående av halogen, $-NO_2$, fenyl, heterocyklyl, heteroaryl,
 C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-R^{20}$, $-C(O)-OR^{20}$, $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$,
 $-CN$ og $-O-R^{20}$;
 n er 0;
 15 R^5 er hydrogen eller C_{1-6} alkyl; og
 R^6 er C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl;
 hvor nevnte C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl eventuelt er
 substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen
 bestående av halogen, $-NO_2$, C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl,
 20 $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-R^{20}$, $-C(O)-OR^{20}$, $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$, $-CN$ og $-O-R^{20}$;
 hvor nevnte C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er
 ytterligere substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra
 gruppen bestående av halogen, $-NO_2$, C_{1-6} alkyl, aralkyl, cykloalkyl, aryl,
 heterocyklyl, heteroaryl, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-R^{20}$, $-C(O)-OR^{20}$, $-C(O)-$
 25 $N(R^{20})(R^{22})$, $-CN$ og $-O-R^{20}$; og
 hvor nevnte C_{1-6} alkyl, aralkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl
 eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig
 valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halogen, $-NO_2$, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-$
 R^{20} , $-C(O)-OR^{20}$;
 30 eller R^5 og R^6 kan gå sammen med atomet til hvilket de er bundet for å danne en
 heterocyklyl eller heteroaryl;
 hvor nevnte heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er substituert med en, to eller
 tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C_{1-6} alkyl,
 cykloalkyl, heterocyklyl, aryl, heteroaryl, okso, $-CN$, $-O-R^{20}$, $-N(R^{20})(R^{22})$,
 35 $-N(R^{20})-C(O)-R^{20}$, $-N(R^{20})-C(O)-OR^{20}$ og $-C(O)-OR^{20}$;
 og
 hvor nevnte C_{1-6} alkyl eller heterocyklyl eventuelt er substituert med en, to eller

tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, okso, heteroaryl og $-O-R^{20}$.

10. Forbindelse ifølge krav 8, karakterisert ved at:

5

R^1 er aryl;

hvor nevnte aryl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-NO_2$, $-CN$, $-SF_5$, $Si(CH_3)_3$, $-O-R^{20}$, $-S-R^{20}$, $-C(O)-R^{21}$, $-C(O)-OR^{20}$, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$,
 10 $-N(R^{20})-C(O)-R^{22}$, $-N(R^{20})-C(O)-OR^{22}$, $-N(R^{20})-S(=O)_2-R^{26}$, $-S(=O)_2-R^{20}$, $-O-S(=O)_2-R^{20}$, $-S(=O)_2-N(R^{20})(R^{22})$, C_{1-6} alkyl, C_{2-4} alkenyl, C_{2-4} alkynyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl og heterocyklyl; og

hvor nevnte C_{1-6} alkyl, C_{2-4} alkenyl, C_{2-4} alkynyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig
 15 valgt fra gruppen bestående av halogen, $-NO_2$, fenyl, heterocyklyl, heteroaryl, C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-R^{20}$, $-C(O)-OR^{20}$, $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$, $-CN$ og $-O-R^{20}$;

n er 0;

R^5 er hydrogen eller C_{1-6} alkyl; og

20

R^6 er C_{1-15} alkyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl;

hvor nevnte C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen
 bestående av halogen, $-NO_2$, C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-R^{20}$, $-C(O)-OR^{20}$, $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$, $-CN$ og $-O-R^{20}$;

25

hvor nevnte C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra
 gruppen bestående av halogen, $-NO_2$, C_{1-6} alkyl, aralkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-R^{20}$, $-C(O)-OR^{20}$, $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$, $-CN$ og $-O-R^{20}$; og

30

hvor nevnte C_{1-6} alkyl, aralkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig
 valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halogen, $-NO_2$, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-R^{20}$, $-C(O)-OR^{20}$;

eller R^5 og R^6 kan gå sammen med atomet til hvilket de er bundet for å danne en
 35 heterocyklyl eller heteroaryl;

hvor nevnte heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, heterocyklyl, aryl, heteroaryl, okso, $-CN$, $-OR^{20}$, $-N(R^{21})(R^{22})$,

$-N(R^{20})-C(O)-R^{20}$, $-N(R^{20})-C(O)-OR^{20}$ og $-C(O)-OR^{20}$; og
 hvor nevnte C_{1-6} alkyl eller heterocyklyl eventuelt er substituert med en, to eller
 tre substituerter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, okso,
 heteroaryl og $-O-R^{20}$.

5

11. Forbindelse ifølge krav 8, hvor:

R^1 aryl er eventuelt substituert med $-O-R^{20}$ eller C_{1-6} alkyl; og
 hvor nevnte C_{1-6} alkyl er eventuelt substituert med en, to eller tre halogen;
 10 n er 0;
 R^5 er hydrogen eller C_{1-6} alkyl; og
 R^6 er C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl;
 hvor nevnte C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl eventuelt er
 substituert med en, to eller tre substituerter uavhengig valgt fra gruppen
 15 bestående av halogen, $-NO_2$, C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl,
 $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-R^{20}$, $-C(O)-OR^{20}$, $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$, $-CN$ og $-O-R^{20}$;
 hvor nevnte C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er
 ytterligere substituert med en, to eller tre substituerter uavhengig valgt fra
 gruppen bestående av halogen, $-NO_2$, C_{1-6} alkyl, aralkyl, cykloalkyl, aryl,
 20 heterocyklyl, heteroaryl, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-R^{20}$, $-C(O)-OR^{20}$, $-C(O)-$
 $N(R^{20})(R^{22})$, $-CN$ og $-O-R^{20}$; og
 hvor nevnte C_{1-6} alkyl, aralkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl
 eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituerter uavhengig
 valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halogen, $-NO_2$, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-$
 25 R^{20} , $-C(O)-OR^{20}$;
 eller R^5 og R^6 kan gå sammen med atomet til hvilket de er bundet for å danne en
 heterocyklyl eller heteroaryl;
 hvor nevnte heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er substituert med en, to eller
 tre substituerter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C_{1-6} alkyl,
 30 cykloalkyl, heterocyklyl, aryl, heteroaryl, okso, $-CN$, $-O-R^{20}$, $-N(R^{20})(R^{22})$,
 $-N(R^{20})-C(O)-R^{20}$, $-N(R^{20})-C(O)-OR^{20}$ og $-C(O)-OR^{20}$; og
 hvor nevnte C_{1-6} alkyl eller heterocyklyl eventuelt er substituert med en, to eller
 tre substituerter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, okso,
 heteroaryl og $-O-R^{20}$.

35

12. Forbindelse ifølge krav 8, hvor:

R^1 er fenyl substituert med $-O-CF_3$ eller $-CF_3$;

n er 0;

R^5 er hydrogen eller C_{1-6} alkyl; og

R^6 er C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl;

hvor nevnte C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-NO_2$, C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-R^{20}$, $-C(O)-OR^{20}$, $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$, $-CN$ og $-O-R^{20}$;

hvor nevnte C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-NO_2$, C_{1-6} alkyl, aralkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-R^{20}$, $-C(O)-OR^{20}$, $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$, $-CN$ og $-O-R^{20}$; og

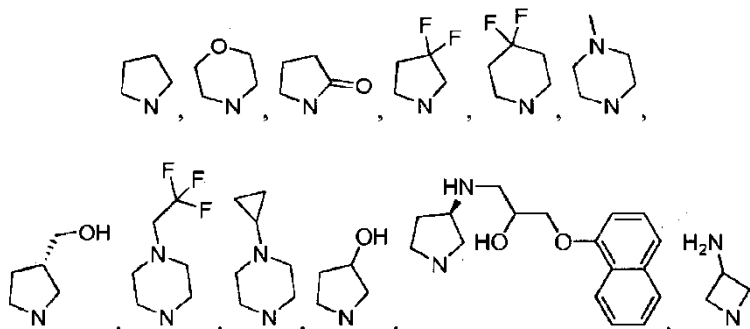
hvor nevnte C_{1-6} alkyl, aralkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halogen, $-NO_2$, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-C(O)-R^{20}$, $-C(O)-OR^{20}$;

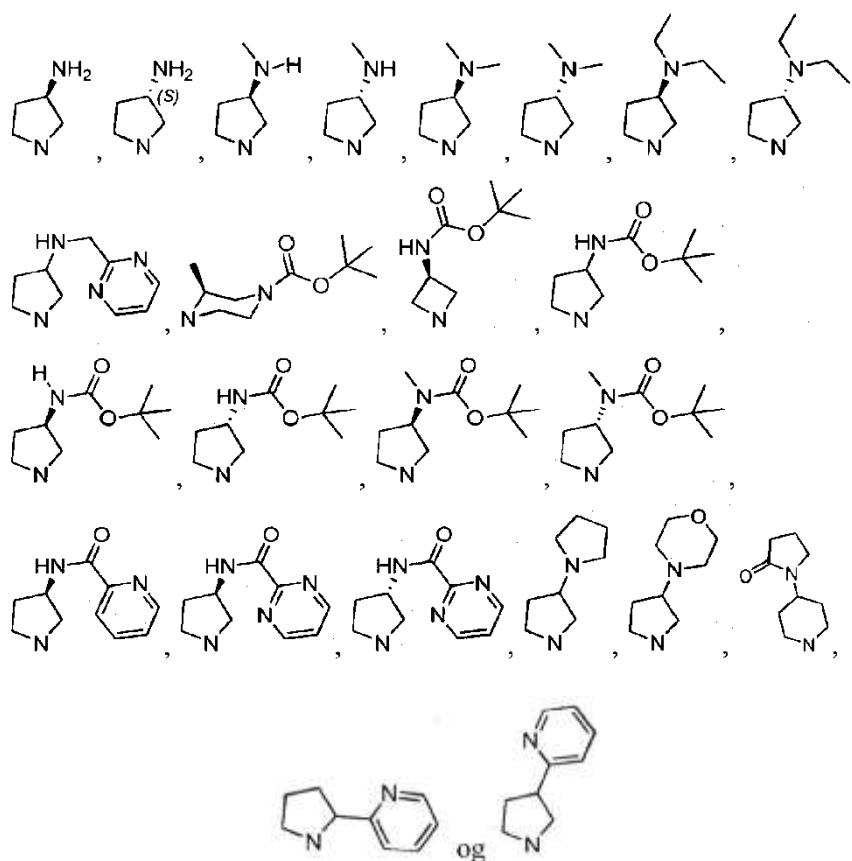
eller R^5 og R^6 kan gå sammen med atomet til hvilket de er bundet for å danne en heterocyklyl eller heteroaryl;

hvor nevnte heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, heterocyklyl, aryl, heteroaryl, okso, $-CN$, $-O-R^{20}$, $-N(R^{20})(R^{22})$, $-N(R^{20})-C(O)-R^{20}$, $-N(R^{20})-C(O)-OR^{20}$ og $-C(O)-OR^{20}$; og

hvor nevnte C_{1-6} alkyl eller heterocyklyl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, okso, heteroaryl og $-O-R^{20}$.

13. Forbindelse ifølge krav 8, karakterisert ved at gruppene R^5 og R^6 kombineres med det nitrogenatom til hvilket de er bundet for å danne en heterocyklylgruppe valgt fra gruppen bestående av

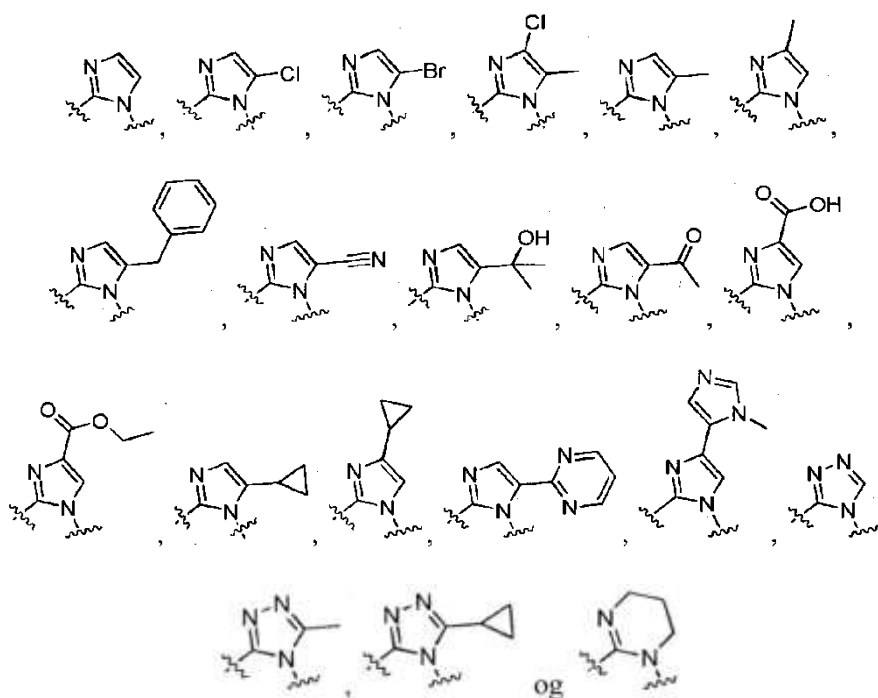




5 hvor festepunktet til oksazepinringen er ved det bivalente nitrogenatomet som tegnet.

14. Forbindelse ifølge krav 1, hvor R^2 og R^4 tas sammen med atomet til hvilket de er bundet for å danne en heterocyklyl eller heteroaryl valgt fra gruppen bestående av

10



15

hvor de stiplede linjer angir festepunktene til oksazepinringen for å danne en tricyklisk gruppe.

15. Forbindelse valgt fra gruppen bestående av:

5

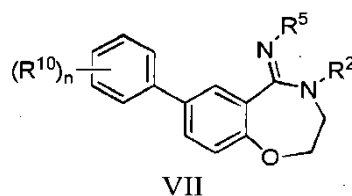
II-1	5-morfolino-7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin
II-2	N-benzyl-7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin
II-3	5-(pyrrolidin-1-yl)-7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin
II-4	N-cyklopropyl-7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin
II-5	N-benzyl-N-metyl-7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin
II-9	N-((3-fluorpyridin-2-yl)metyl)-7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin
II-10	N-(pyridin-2-ylmetyl)-7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin
II-11	N-(cyklopropylmetyl)-7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin
II-13	tert-butyl-1-(7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-yl)pyrrolidin-3-ylkarbamat
II-14	N-(2-(1 H-imidazol-1-yl)etyl)-7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin
II-15	(S)-N,N-dimetyl-1-(7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-yl)pyrrolidin-3-amin
II-19	N-(pyridin-2-yl)-7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin
II-20	N-(2-(pyridin-2-yloksy)etyl)-7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin
II-22	N-(2-fenoksyetyl)-7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin
II-24	N-(2-(2-klorfenoksy)etyl)-7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin

II-25	7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-N-((6-(trifluormetyl)pyridin-2-yl)metyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin
II-31	5-(4-cyklopropylpiperazin-1-yl)-7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin
II-32	N-fenyl-7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin
II-33	N-((1-metyl-1H-benzo[d]imidazol-2-yl)metyl)-7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin
II-37	N-(pyrimidin-2-ylmetyl)-1-(7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-yl)pyrrolidin-3-amin
II-38	(R)-tert-butyl-metyl(1-(7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-yl)pyrrolidin-3-yl)karbamat
II-39	(R)-N-metyl-1-(7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-yl)pyrrolidin-3-amin
II-40	(S)-tert-butyl-metyl-(1-(7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-yl)pyrrolidin-3-yl)karbamat
II-43	(S)-tert-butyl 3-(7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-ylamino)pyrrolidin-1-karboksylat
II-47	(R)-N-(1-(7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-yl)pyrrolidin-3-yl)pikolinamid
II-48	(S)-N,N-dietyl-1-(7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-yl)pyrrolidin-3-amin
II-50	(R)-tert-butyl-1-(7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-yl)pyrrolidin-3-ylkarbamat
II-51	(R)-N,N-dimetyl-1-(7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-yl)pyrrolidin-3-amin
II-54	N-fenyl-7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin
II-55	5-(3-morfolinopyrrolidin-1-yl)-7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin
II-56	1-(7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-yl)pyrrolidin-3-amin
II-57	tert-butyl-1-(7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-yl)pyrrolidin-3-ylkarbamat

II-58	5-(2-(pyridin-2-yl)pyrrolidin-1-yl)-7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin
II-60	5-(3-(pyridin-2-yl)pyrrolidin-1-yl)-7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin
II-61	1-(naftalen-1-yloksy)-3-((R)-1-(7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-yl)pyrrolidin-3-ylamino)propan-2-ol
II-62	tert-butyl-3-(7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-ylamino)pyrrolidin-1-karboksylat
II-63	(R)-tert-butyl-3-(7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-ylamino)pyrrolidin-1-karboksylat

eller et farmasøytisk akseptabelt salt, stereoisomer, blanding av stereoisomerer, eller tautomer derav.

5 **16.** Forbindelse med formel VII:



hvor:

n er 0, 1, 2 eller 3:

- 10 hver R^{10} er uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-\text{NO}_2$, $-\text{CN}$, $-\text{SF}_5$, $\text{Si}(\text{CH}_3)_3$, $-\text{O}-R^{20}$, $-\text{S}-R^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-R^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$, $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{N}(\text{R}^{20})-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{22}$, $-\text{N}(\text{R}^{20})-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{22}$, $-\text{N}(\text{R}^{20})-\text{S}(=\text{O})_2-\text{R}^{26}$, $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{R}^{20}$, $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, C_{1-6} alkyl, C_{2-4} alkenyl, C_{2-4} alkynyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl og heterocyklyl; og
- 15 hvor nevnte C_{1-6} alkyl, C_{2-4} alkenyl, C_{2-4} alkynyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $-\text{NO}_2$, fenyl, heterocyklyl, heteroaryl, C_{1-6} alkyl, cykloalkyl, $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$, $-\text{CN}$ og $-\text{O}-\text{R}^{20}$;
- 20 R^2 er hydrogen, C_{1-15} alkyl, $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{26}$, $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{26})(\text{R}^{28})$, $-\text{N}(\text{R}^{20})-\text{S}(=\text{O})_2-\text{R}^{20}$, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl; hvor nevnte C_{1-15} alkyl, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl eventuelt er

- substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av C₁₋₆alkyl, C₂₋₄alkynyl, halogen, -NO₂, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, -N(R²⁰)(R²²), -C(O)-R²⁰, -C(O)-OR²⁰, -C(O)-N(R²⁰)(R²²), -CN, okso og -O-R²⁰;
- 5 hvor nevnte C₁₋₆alkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, -NO₂, C₁₋₆alkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, -N(R²⁰)(R²²), -C(O)-R²⁰, -C(O)-OR²⁰, -C(O)-N(R²⁰)(R²²), -CN og -O-R²⁰; og
- 10 hvor nevnte C₁₋₆alkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, -NO₂, -CF₃, -N(R²⁰)(R²²), -C(O)-R²⁰, -C(O)-OR²⁰, -C(O)-N(R²⁰)(R²²), -CN, -S(O)₂-R²⁰ og -O-R²⁰;
- 15 R⁵ er hydrogen, C₁₋₁₅alkyl, C₁₋₄alkoksy, -C(O)-O-R²⁶, -C(O)-N(R²⁶)(R²⁸), -N(R²⁰)-S(=O)₂-R²⁰, cykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterocyklyl; hvor nevnte C₁₋₁₅alkyl er eventuelt substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, -NO₂, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, -N(R²⁰)(R²²), -C(O)-R²⁰, -C(O)-OR²⁰, -C(O)-N(R²⁰)(R²²),
- 20 -CN og -O-R²⁰;
- hvor nevnte cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, -NO₂, C₁₋₆alkyl, aralkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl, heteroaryl, -N(R²⁰)(R²²), -C(O)-R²⁰, -C(O)-OR²⁰, -C(O)-N(R²⁰)(R²²), -CN og -O-R²⁰; og
- 25 hvor nevnte C₁₋₆alkyl, aralkyl, cykloalkyl, aryl, heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er ytterligere substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halogen, -NO₂, -N(R²⁰)(R²²), -C(O)-R²⁰, -C(O)-OR²⁰, -C(O)-N(R²⁰)(R²²), -CN og -O-R²⁰;
- eller R² og R⁵ kan gå sammen med det atom til hvilket de er bundet for å danne en
- 30 heterocyklyl eller heteroaryl;
- hvor nevnte heterocyklyl eller heteroaryl eventuelt er substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av C₁₋₁₅alkyl, cykloalkyl, heteroaryl, -O-R²⁰, -N(R²⁰)(R²²), -N(R²⁰)-C(O)-OR²⁰ og -C(O)-OR²⁰; og
- hvor nevnte C₁₋₁₅alkyl er eventuelt substituert med en, to eller tre substituenten
- 35 uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen og heteroaryl;
- R²⁰ og R²² er i hvert tilfelle uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydrogen, C₁₋₁₅alkyl, C₂₋₁₅alkenyl, C₂₋₁₅alkynyl, cykloalkyl, heterocyklyl, aryl og heteroaryl; og

hvor C₁₋₁₅alkyl, C₂₋₁₅alkenyl, C₂₋₁₅alkynyl, er cykloalkyl, heterocyklyl, aryl og heteroaryl eventuelt substituert med en, to eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halogen, C₁₋₄alkyl, acylamino, -NO₂, -SO₂R²⁶, -CN, C₁₋₃alkoksy, -CF₃, -OCF₃, -OCH₂CF₃, -C(O)-NH₂, aryl, cykloalkyl og heteroaryl;

hvor nevnte heteroaryl eventuelt er ytterligere substituert med C₁₋₄alkyl eller cykloalkyl; eller

når R²⁰ og R²² er festet til et felles nitrogenatom kan R²⁰ og R²² sammen danne en heterocyklisk eller heteroarylring som deretter eventuelt er substituert med en, to

eller tre substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halogen, C₁₋₄alkyl, aralkyl, aryl, arylloksy, aralkylloksy, acylamino, -NO₂, -SO₂R²⁶, -CN, C₁₋₃alkoksy, -CF₃, -OCF₃, aryl, heteroaryl og cykloalkyl;

R²⁵ er i hvert tilfelle uavhengig en kovalent binding eller C₁₋₃alkylen eventuelt substituert med en eller to C₁₋₃alkylgrupper; og

R²⁶ og R²⁸ er i hvert tilfelle uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydrogen, C₁₋₄alkyl, aryl og cykloalkyl; og

hvor C₁₋₄alkyl, aryl og cykloalkyl kan være ytterligere substituert med fra 1 til 3 substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halogen, C₁₋₄alkoksy, -CF₃ og -OCF₃;

eller et farmasøytisk akseptabelt salt, ester, hydrat, solvat, stereoisomer, blanding av stereoisomerer, tautomer, polymorf og/eller prodrug deriv.

17. Forbindelse ifølge krav 16, hvor, når R² og R⁵ tas sammen med atomet som de er bundet til for å danne et eventuelt substituert imidazolyl, imidazolyl ikke er direkte substituert med et eventuelt substituert triazolyl, eller R¹ ikke er eventuelt substituert pyrazolyl, 2-pyridinonyl eller 2-fluorpyridinyl.

18. Forbindelse N-(cyklopropylmetyl)-7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin eller et farmasøytisk akseptabelt salt deriv.

19. Forbindelse (R)-tert-butyl 3-(7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-ylamino)pyrrolidin-1-karboksylat eller et farmasøytisk akseptabelt salt deriv.

20. Farmasøytisk sammensetning omfattende en farmasøytisk akseptabel eksipiens og en terapeutisk effektiv mengde av forbindelsen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 19, eller et farmasøytisk akseptabelt salt deriv.

21. Forbindelse ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 19, for anvendelse i terapi, fortrinnsvis for anvendelse ved behandling av en sykdomstilstand i et pattedyr som kan lindres ved behandling med et middel som er i stand til å redusere sen natriumstrøm.

- 5 **22.** Forbindelse ifølge krav 21, for anvendelse i behandling av kardiovaskulær sykdom valgt fra en eller flere av atrie- og ventrikulær arytmi, hjertesvikt (inkludert kongestiv hjertesvikt, diastolisk hjertesvikt, systolisk hjertesvikt, akutt hjertesvikt), Prinzmetals (variant) angina, stabil og ustabil angina, bevegelsesindusert angina, kongestiv
10 hjertesykdom, iskemi, tilbakevendende iskemi, reperfusjonsskade, myokardisk infarkt, akutt koronart syndrom, perifer arteriell sykdom, pulmonal hypertensjon og claudicatio intermittens; eller hvor sykdomstilstanden er diabetes eller diabetisk perifer neuropati; eller hvor sykdomstilstanden resulterer i en eller flere av nevropatisk smerte, epilepsi, kramper, hodepine eller lammelse.