



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2841437 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 519/00 (2006.01)
A61K 31/433 (2006.01)
A61K 31/4355 (2006.01)
A61K 31/5025 (2006.01)
A61P 7/02 (2006.01)
C07D 487/04 (2006.01)
C07D 513/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2017.12.11
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2017.07.05
(86)	European Application Nr.	13721857.4
(86)	European Filing Date	2013.04.24
(87)	The European Application's Publication Date	2015.03.04
(30)	Priority	2012.04.26, US, 201261638577 P 2013.03.15, US, 201361787680 P
(84)	Designated Contracting States:	AL AT BE BG CH CY CZ DE DK EE ES FI FR GB GR HR HU IE IS IT LI LT LU LV MC MK MT NL NO PL PT RO RS SE SI SK SM TR
(73)	Proprietor	Bristol-Myers Squibb Company, Route 206 and Province Line Road, Princeton, NJ 08543, US-USA Université de Montréal, 2900 Boulevard Edouard-Montpetit, Montreal, QC H3T 1J4, CA-Canada
(72)	Inventor	BANVILLE, Jacques, c/o Université de Montréal2900 Édouard-Montpetit Boulevard, Montréal, Québec H3T 1J4, CA-Canada RÉMILLARD, Roger, 13 Des cèdres Avenue, Napierville, Québec J0J 1L0, CA-Canada RUEDIGER, Edward H., c/o Université de Montréal2900 Édouard-Montpetit Boulevard, Montréal, Québec H3T 1J4, CA-Canada DEON, Daniel H., c/o Université de Montréal2900 Édouard-Montpetit Boulevard, Montréal, Québec H3T 1J4, CA-Canada GAGNON, Marc, c/o Université de Montréal2900 Édouard-Montpetit Boulevard, Montréal, Québec H3T 1J4, CA-Canada DUBÉ, Laurence, c/o Université de Montréal2900 Édouard-Montpetit Boulevard, Montréal, Québec H3T 1J4, CA-Canada GUY, Julia, c/o Université de Montréal2900 Édouard-Montpetit Boulevard, Montréal, Québec H3T 1J4, CA-Canada PRIESTLEY, Eldon Scott, c/o Bristol-Myers Squibb Company311 Pennington-Rocky Hill Road, Pennington, New Jersey 08534, US-USA POSY, Shoshana L., c/o Bristol-Myers Squibb CompanyRoute 206 and Province Line Road, Pennington, New Jersey 08543, US-USA MAXWELL, Brad D., c/o Bristol-Myers Squibb CompanyRoute 206 and Province Line Road, Pennington, New Jersey 08543, US-USA WONG, Pancras C., c/o Bristol-Myers Squibb Company311 Pennington-Rocky Hill Road, Pennington, New Jersey 08534, US-USA LAWRENCE, Michael, R., c/o Bristol-Myers Squibb Company311 Pennington-Rocky Hill Road, Pennington, NJ 08534, US-USA MILLER, Michael, M., c/o Bristol-Myers Squibb CompanyRoute 206 and Province Line Road, Princeton, NJ 08543, US-USA

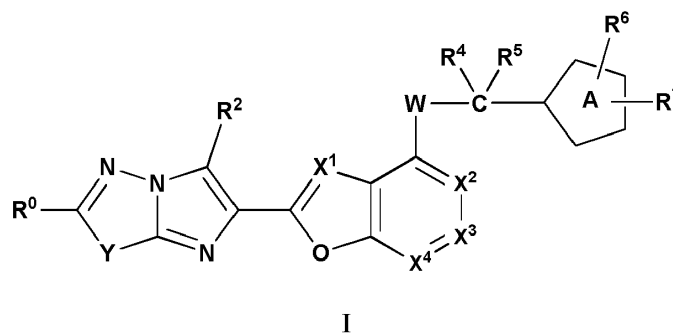
(74) Agent or Attorney Tandberg Innovation AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

-
- (54) Title **IMIDAZOTHIADIAZOLE AND IMIDAZOPYRAZINE DERIVATIVES AS PROTEASE ACTIVATED RECEPTOR 4 (PAR4) INHIBITORS FOR TREATING PLATELET AGGREGATION**
- (56) References
Cited: EP-A1- 0 005 783
EP-A1- 0 185 345
WO-A1-2011/074658

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



eller en stereoisomer, tautomer, farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav, hvor:

10

W er O eller S;

R⁰ er R¹;

Y er S eller -CR⁸=CR⁹-;

R¹ er uavhengig valgt fra gruppen bestående av:

15

H,

halogen,

C₁-C₄ alkyl,

C₂-C₃ alkenyl,

C₂-C₃ alkynyl,

20

C₃-C₄ cykloalkyl,

C₁-C₄ alkoksy,

C₁-C₂ alkoksy-C₁-C₂ alkyl,

tetrahydrofuran-2-yl;

C₁-C₄ alkyltio,

25

C₁-C₄ alkylNH-,

(C₁-C₄ alkyl)₂N-,

halogen-C₁-C₂-alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener, hvor halogen er F eller

Cl,

halogen-C₃-C₄ cykloalkyl,

30

halogen-C₁-C₂ alkoksy, og

halogen-C₁-C₂ alkyltio;

R⁸ og R⁹ er uavhengig valgt fra gruppen bestående av:

H,
halogen,
C₁-C₄ alkyl,
C₁-C₄ alkoksy,
halogen-C₁-C₂ alkyl,
halogen-C₁-C₂ alkoksy,
CN, og
OH;

forutsatt at minst én av R¹, R⁸ og R⁹ er forskjellig fra H;

R² er valgt fra gruppen bestående av:

H,
halogen,
C₁-C₄ alkyl,
C₁-C₄ alkoksy, og
cyano;

X¹ er valgt fra gruppen bestående av CH, N eller CR¹⁰;

X², X³ og X⁴ er uavhengig valgt fra CR³ eller N;

R³ er valgt fra gruppen bestående av H, C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyltio, halogen, OH, CN, OCF₃, OCHF₂, OCH₂F, C₁-C₂-alkoksy-C₁-C₂-alkoksy, halogen-C₁-C₃-alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener, benzyloksy substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, OCHF₂, di-C₁-C₄-alkylamino, og cyano, og -(CH₂)_n¹-fenyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, OCHF₂, di-C₁-C₄-alkylamino, og cyano;

R⁴ og R⁵ er uavhengig valgt fra H og C₁-C₆ alkyl, eller R⁴ og R⁵ kan tas sammen med karbonet som de er bundet til, for å danne en C₃-C₇ cykloalkylring;



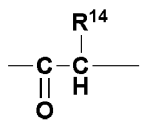
er en 5-leddet heteroarylring som inneholder minst ett O-, N- eller S-atom;

R⁶ er valgt fra gruppen bestående av H, halogen, OCF₃, OCHF₂, OH, CN, NO₂, NR¹¹R¹², COOH, C₁-C₄ alkoksykarbonyl, (C=O)NR¹¹R¹², C₁-C₄ alkylsulfonyl, S(=O)₂NR¹¹R¹², og C₁-C₅alkyl substituert med 0 til 7 grupper uavhengig valgt fra halogen, CF₃, OCF₃, OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkoksy-C₁-C₄ alkoksy, di-C₁-C₄-alkylaminofenyl-C₁-C₄-alkyl, (di-C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl)-C₁-C₄-alkyl, di-C₁-C₄-alkylamino, C₃-C₆-cykloalkyl, og C₁-C₄ alkyltio, eller R⁶ er B-D-, hvor D er en linker, som er valgt fra:

en enkeltbinding,

-O-,

-S-,



C₁-C₄ alkylen substituert med 0 til 4 grupper uavhengig valgt fra halogen eller OH,

C₁-C₄ alkylenoksy,

C₁-C₄ alkylentio,

C₁-C₄ alkylenoksy-C₁-C₄-alkylen,

C₁-C₄-alkylentio-C₁-C₄-alkylen,

-S-C₁-C₄-alkylen,

-O-C₁-C₄-alkylen,

C₂-C₆ alkenylen, og

B er valgt fra gruppen bestående av:

C₆-C₁₀ aryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen

bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, halogen-C₁-C₄alkoksy, C₁-C₄ alkyl,

halogen-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl, cyano, nitro, NR¹¹R¹², OH, C₁-C₄-

alkylkarbonyloksy-C₁-C₄-alkyl, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, cyano-C₁-C₄-alkyl,

COOR¹⁴, SO₂R¹⁴, (C=O)NR¹¹R¹², SO₂NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)NR¹¹R¹²,

N(R¹³)(C=O)OR¹⁴, N(R¹³)(C=O)R¹⁴, NR¹³S(O)R¹⁴, NR¹³SO₂R¹⁴, O(C=O)NR¹¹R¹²,

O(C=O)OR¹⁴, O(C=O)R¹⁴, (C=O)OR¹⁴, og 5-6-leddet heteroaryl,

- 5- til 10-leddet heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, halogen-C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, halogen-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl, cyano, nitro, NR¹¹R¹², OH, C₁-C₄-alkylkarbonyloksy-C₁-C₄-alkyl, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, COOR¹⁴, SO₂R¹⁴,
 5 (C=O)NR¹¹R¹², SO₂NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)OR¹⁴, N(R¹³)(C=O)R¹⁴, NR¹³S(O)R¹⁴, NR¹³SO₂R¹⁴, O(C=O)NR¹¹R¹², O(C=O)OR¹⁴, O(C=O)R¹⁴, (C=O)OR¹⁴, 5-6-leddet heteroaryl, og (CH₂)fenyl,
 4- til 10-leddet heterocyklyl inneholdende karbonatomer og 1 til 2 ytterligere heteroatomer valgt fra N, O, og S, og substituert med 0 til 3 grupper uavhengig
 10 valgt fra gruppen bestående av halogen, okso, -(CHR¹³)_n¹⁻⁵- eller 6-leddet heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, og CF₂CH₃; NR¹³S(O)R¹⁴, NR¹³SO₂R¹⁴, -(CHR¹³)_n¹⁻⁴- til 10-leddet-heterocyklyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av
 15 halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, og CF₂CH₃; OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄ alkoksy, halogen-C₁-C₄ alkoksy, di-C₁-C₄-alkylamino-C₁-C₄-alkyl, NR₁₁R₁₂, cyano, C₁-C₄ alkyl, halogen-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl, C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl-C₁-C₄-alkylkarbonyl, C₆-C₁₀ arylkarbonyl, C₁-C₄-alkylkarbonyloksy-C₁-C₄-alkyl, COOR¹⁴, SO₂R¹⁴,
 20 (C=O)NR¹¹R¹², SO₂NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)OR¹⁴, N(R¹³)(C=O)R¹⁴, O(C=O)NR¹¹R¹², O(C=O)OR¹⁴, O(C=O)R¹⁴, (C=O)OR¹⁴, og C₆-C₁₀ aryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, C₁-C₄-alkoksykarbonyl, (C=O)NR¹¹R¹², CF₃, OCF₃, og CF₂CH₃;
 25 C₃-C₆ cykloalkyl som kan inneholde umettethet, substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, okso, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₆-C₁₀ aryl, COOH, okso, C₁-C₄-alkoksykarbonyl, (C=O)NR¹¹R¹², NR¹¹R¹², og C₁-C₄ alkyl; og C₅-C₁₁ spirocykloalkyl som kan inneholde umettethet og eventuelt inneholdende
 30 1 til 3 heteroatomer valgt fra O, N eller S og substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₆-C₁₀ aryl, og C₁-C₄ alkyl;

R¹¹ og R¹² er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av:

35

H,
 C₁-C₄ alkyl,
 halogen-C₁-C₄-alkyl,

C₂-C₄ alkenyl,

C₂-C₄ alkynyl,

-(CR¹⁴R¹⁴)_n¹-fenyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, OCHF₂, di-C₁-C₄-alkylamino, og cyano,

-(CHR¹³)_n¹-C₃-C₆-cykloalkyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, og C₁-C₄ alkyl,

-(CHR¹³)_n¹-4- til 10-leddet-heterocyklyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, okso, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, og C₁-C₄ alkyl,

-(CHR¹³)_n¹-5- til 10-leddet-heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, og C₁-C₄ alkyl,

di-C₁-C₄-alkylamino-C₁-C₄-alkyl,

C₁-C₄-alkylkarbonylamino-C₁-C₄-alkyl,

di-C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl,

di-C₁-C₄-alkylaminofenyl,

hydroksy-C₁-C₄-alkyl,

cyano-C₁-C₄-alkyl,

C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl,

C₁-C₄-alkoksykarbonyl-C₁-C₄-alkyl,

C₁-C₄-alkoksykarbonyl,

C₁-C₄-alkylkarbonyl,

fenylkarbonyl;

C₁-C₄-alkoksykarbonylamino-C₁-C₄-alkylkarbonyl, di-C₁-C₄-alkylamino-C₁-C₄-alkylkarbonyl,

amino-C₁-C₄-alkylkarbonyl,

4- til 10-leddet-heterocyklyl-karbonyl, og

alternativt, R¹¹ og R¹², når festet til det samme nitrogen, kombineres for å danne en 4- til 8-leddet heterocyklisk ring inneholdende karbonatomer substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, CHF₂, OCF₃, OCHF₂, OCH₂F, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, okso, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄ alkyl og C₁-C₄ alkoksy, og 0 til 2 ytterligere heteroatomer valgt fra N, NR¹³, O og S(O)_p;

R¹³ er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av H, C₁-C₆ alkyl og -(CH₂)fenyl;

R^{14} er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av H, C_1 - C_6 alkyl, halogen- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkoksykarbonylamino, (C_6 - C_{10} arylkarbonylamino), (et 5- til 10-leddet heteroarylkarbonylamino) og $-(CH_2)_n$ fenyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C_1 - C_4 alkoksy, C_1 - C_4 alkyl, cyklopropyl, CF_3 , OCF_3 , 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, $OCHF_2$, di- C_1 - C_4 -alkylamino, og cyano,

R^7 er valgt fra gruppen bestående av H, halogen, hydroksyl, okso, C_1 - C_4 alkyl, hydroksy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkoksy- C_1 - C_4 -alkyl, halogen- C_1 - C_4 -alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener, C_1 - C_4 -alkoksy, og halogen- C_1 - C_4 -alkoksy;

eller R^6 og R^7 kan tas sammen med karbonene som de er festet til, for å danne en C_6 - C_{10} arylring;

R^{10} er valgt fra gruppen bestående av C_1 - C_4 alkyl, halogen, C_1 - C_4 alkoksy, og halogen- C_1 - C_2 -alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener, hvor halogen er F eller Cl; n^1 , ved hver forekomst, er valgt fra 0, 1, 2, 3, 4 eller 5; og

p, ved hver forekomst, er valgt fra 0, 1 og 2.

2. Forbindelsen som definert i krav 1, hvor:

W er O eller S;

R^0 er R^1 ;

Y er S eller $-CR^8=CR^9-$;

R^1 er uavhengig valgt fra gruppen bestående av:

H,

halogen,

C_1 - C_4 alkyl,

C_2 - C_3 alkenyl,

C_2 - C_3 alkynyl,

C_3 - C_4 cykloalkyl,

C_1 - C_4 alkoksy,

C_1 - C_2 alkoksy- C_1 - C_2 alkyl,

tetrahydrofuran-2-yl;

C_1 - C_4 alkyltio,

halogen- C_1 - C_2 -alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener, hvor halogen er F eller Cl,

halogen- C_3 - C_4 cykloalkyl,

halogen- C_1 - C_2 alkoksy, og

halogen- C_1 - C_2 alkyltio;

R⁸ og R⁹ er uavhengig valgt fra gruppen bestående av:

H,
halogen,
C₁-C₄ alkyl,
C₁-C₄ alkoksy,
halogen-C₁-C₂ alkyl,
halogen-C₁-C₂ alkoksy, og
OH;

forutsatt at minst én av R¹, R⁸ og R⁹ er forskjellig fra H;

R² er valgt fra gruppen bestående av:

H,
halogen,
C₁-C₄ alkyl, og
C₁-C₄ alkoksy;

X¹ er valgt fra gruppen bestående av CH, N eller CR¹⁰;

X², X³ og X⁴ er uavhengig valgt fra CR³ eller N;

R³ er valgt fra gruppen bestående av H, C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄ alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyltio, halogen, OH, CN, OCF₃, C₁-C₂-alkoksy-C₁-C₂-alkoksy, halogen-C₁-C₃-alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener, benzyloksy substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, OCHF₂, di-C₁-C₄-alkylamino, og cyano, og -(CH₂)_n¹-fenyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, OCHF₂, di-C₁-C₄-alkylamino, og cyano;

R⁴ og R⁵ er uavhengig valgt fra H og C₁-C₆ alkyl, eller R⁴ og R⁵ kan tas sammen med karbonet som de er bundet til, for å danne en C₃-C₇ cykloalkylring;



er en 5-leddet heteroarylring som inneholder minst ett O-, N- eller S-atom;

R⁶ er valgt fra gruppen bestående av H, halogen, OCF₃, OCHF₂, OH, CN, NO₂, NR¹¹R¹², COOH, C₁-C₄ alkoksykarbonyl, (C=O)NR¹¹R¹², C₁-C₄ alkylsulfonyl, og C₁-

C₅ alkyl substituert med 0 til 7 grupper uavhengig valgt fra halogen, CF₃, OCF₃, OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkoksy-C₁-C₄alkoksy, di-C₁-C₄-alkylaminofenyl-C₁-C₄-alkyl, (di-C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl)-C₁-C₄-alkyl, di-C₁-C₄-alkylamino, C₃-C₆-cykloalkyl, og C₁-C₄ alkyltio, eller

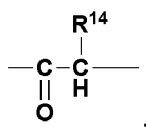
5 R⁶ er B-D-, hvor D er en linker, som er valgt fra:

en enkeltbinding,

-O-,

-S-,

10



15 C₁-C₄ alkylen substituert med 0 til 4 grupper uavhengig valgt fra halogen eller OH,

C₁-C₄ alkylenoksy,

C₁-C₄ alkylentio,

C₁-C₄ alkylenoksy-C₁-C₄-alkylen,

20 C₁-C₄-alkylentio-C₁-C₄-alkylen,

C₂-C₆ alkenylen, og

B er valgt fra gruppen bestående av:

25 C₆-C₁₀ aryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, halogen-C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, halogen-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl, cyano, nitro, NR¹¹R¹², OH, C₁-C₄-alkylkarbonyloksy-C₁-C₄-alkyl, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, COOR¹⁴, SO₂R¹⁴, (C=O)NR¹¹R¹², SO₂NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)OR¹⁴,
30 N(R¹³)(C=O)R¹⁴, NR¹³S(O)R¹⁴, NR¹³SO₂R¹⁴, O(C=O)NR¹¹R¹², O(C=O)OR¹⁴, O(C=O)R¹⁴, (C=O)OR¹⁴, og 5-6-leddet heteroaryl,

5- til 10-leddet heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, halogen-C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, halogen-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl, cyano, nitro, NR¹¹R¹², OH, C₁-C₄-alkylkarbonyloksy-C₁-C₄-alkyl, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, COOR¹⁴, SO₂R¹⁴,

35

- $(C=O)NR^{11}R^{12}$, $SO_2NR^{11}R^{12}$, $N(R^{13})(C=O)NR^{11}R^{12}$, $N(R^{13})(C=O)OR^{14}$,
 $N(R^{13})(C=O)R^{14}$, $NR^{13}S(O)R^{14}$, $NR^{13}SO_2R^{14}$, $O(C=O)NR^{11}R^{12}$, $O(C=O)OR^{14}$,
 $O(C=O)R^{14}$, $(C=O)OR^{14}$, 5-6-leddet heteroaryl, og (CH_2) fenyl,
 4- til 10-leddet heterocyklyl inneholdende karbonatomer og 1 til 2 ytterligere
 5 heteroatomer valgt fra N, O, og S, og substituert med 0 til 3 grupper uavhengig
 valgt fra gruppen bestående av halogen, okso, $-(CHR^{13})_{n^1-5}$ - eller 6-leddet
 heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen
 bestående av halogen, C_1 - C_4 alkoksy, C_1 - C_4 alkyl, syklopropyl, CF_3 , OCF_3 , og
 CF_2CH_3 ; $NR^{13}S(O)R^{14}$, $NR^{13}SO_2R^{14}$, $-(CHR^{13})_{n^1-4}$ - til 10-leddet-heterocyklyl
 10 substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av
 halogen, C_1 - C_4 alkoksy, C_1 - C_4 alkyl, syklopropyl, CF_3 , OCF_3 , og CF_2CH_3 ; OH,
 hydroksy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 alkoksy, halogen- C_1 - C_4 alkoksy, di- C_1 - C_4 -
 alkylamino- C_1 - C_4 -alkyl, $NR^{11}R^{12}$, cyano, C_1 - C_4 alkyl, halogen- C_1 - C_4 alkyl, C_3 -
 C_6 cykloalkyl, C_1 - C_4 -alkoksy- C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_6 cykloalkyl- C_1 - C_4 -alkylkarbonyl,
 15 C_6 - C_{10} arylkarbonyl, C_1 - C_4 -alkylkarbonyloksy- C_1 - C_4 -alkyl, $COOR^{14}$,
 SO_2R^{14} $(C=O)NR^{11}R^{12}$, $SO_2NR^{11}R^{12}$, $N(R^{13})(C=O)NR^{11}R^{12}$, $N(R^{13})(C=O)OR^{14}$,
 $N(R^{13})(C=O)R^{14}$, $O(C=O)NR^{11}R^{12}$, $O(C=O)OR^{14}$, $O(C=O)R^{14}$, $(C=O)OR^{14}$, og C_6 -
 C_{10} aryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående
 av halogen, C_1 - C_4 alkoksy, C_1 - C_4 alkyl, syklopropyl, C_1 - C_4 -alkoksykarbonyl,
 20 $(C=O)NR^{11}R^{12}$ CF_3 , OCF_3 , og CF_2CH_3 ;
 C_3 - C_6 cykloalkyl som kan inneholde umettethet, substituert med 0 til 3 grupper
 uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF_3 , OCF_3 , 5- eller 6-leddet
 heteroaryl, OH, okso, hydroksy- C_1 - C_4 -alkyl, C_6 - C_{10} aryl, $COOH$, okso, C_1 - C_4 -
 alkoksylkarbonyl, $(C=O)NR^{11}R^{12}$, og C_1 - C_4 alkyl; og
 25 C_5 - C_{11} spirocykloalkyl som kan inneholde umettethet og eventuelt inneholdende
 1 til 3 heteroatomer valgt fra O, N eller S og substituert med 0 til 3 grupper
 uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF_3 , OCF_3 , 5- eller 6-leddet
 heteroaryl, OH, hydroksy- C_1 - C_4 -alkyl, C_6 - C_{10} aryl, og C_1 - C_4 alkyl;
 30 R^{11} og R^{12} er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av:

 H,
 C_1 - C_4 alkyl,
 halogen- C_1 - C_4 -alkyl,
 35 C_2 - C_4 alkenyl,
 C_2 - C_4 alkynyl,

- 5 $-(\text{CR}^{14}\text{R}^{14})_{n^1}$ -fenyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen
 bestående av halogen, C_1 - C_4 alkoksy, C_1 - C_4 alkyl, cyklopropyl, CF_3 , OCF_3 , 5-
 eller 6-leddet heteroaryl, OH, OCHF_2 , di- C_1 - C_4 -alkylamino, og cyano,
 10 $-(\text{CHR}^{13})_{n^1}$ - C_3 - C_6 -cykloalkyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra
 gruppen bestående av halogen, CF_3 , OCF_3 , 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH,
 hydroksy- C_1 - C_4 -alkyl, og C_1 - C_4 alkyl,
 15 $-(\text{CHR}^{13})_{n^1}$ -4- til 10-leddet-heterocyklyl substituert med 0 til 3 grupper
 uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF_3 , OCF_3 , 5- eller 6-leddet
 heteroaryl, OH, okso, hydroksy- C_1 - C_4 -alkyl, og C_1 - C_4 alkyl,
 20 $-(\text{CHR}^{13})_{n^1}$ -5- til 10-leddet-heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig
 valgt fra gruppen bestående av halogen, CF_3 , OCF_3 , 5- eller 6-leddet
 heteroaryl, OH, hydroksy- C_1 - C_4 -alkyl, og C_1 - C_4 alkyl,
 di- C_1 - C_4 -alkylamino- C_1 - C_4 -alkyl,
 di- C_1 - C_4 -alkoksy- C_1 - C_4 -alkyl,
 25 hydroksy- C_1 - C_4 -alkyl,
 cyano- C_1 - C_4 -alkyl,
 C_1 - C_4 -alkoksy- C_1 - C_4 -alkyl,
 C_1 - C_4 -alkoksykarbonyl- C_1 - C_4 -alkyl,
 C_1 - C_4 -alkoksykarbonyl,
 30 C_1 - C_4 -alkylkarbonyl,
 fenylkarbonyl;
 C_1 - C_4 -alkoksykarbonylamino- C_1 - C_4 -alkylkarbonyl,
 di- C_1 - C_4 -alkylamino- C_1 - C_4 -alkylkarbonyl,
 amino- C_1 - C_4 -alkylkarbonyl,
 35 4- til 10-leddet-heterocyklyl-karbonyl, og

alternativt, R^{11} og R^{12} , når festet til det samme nitrogen, kombineres for å danne
 en 4- til 8-leddet heterocyklisk ring inneholdende karbonatomer substituert med 0
 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF_3 , CHF_2 , OCF_3 ,
 30 OCHF_2 , OCH_2F , 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, okso, hydroksy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 -
 C_4 alkyl og C_1 - C_4 alkoksy, og 0 til 2 ytterligere heteroatomer valgt fra N, NR^{13} , O og
 $\text{S}(\text{O})_p$;

R^{13} er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av H, C_1 -
 C_6 alkyl og $-(\text{CH}_2)$ fenyl;

35 R^{14} er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av H, C_1 -
 C_6 alkyl, halogen- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkoksykarbonylamino, (C_6 - C_{10} arylkarbonyl-
 amino), (a 5- til 10-leddet heteroarylkarbonylamino) og $-(\text{CH}_2)_{n^1}$ fenyl substituert
 med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C_1 -

C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, OCHF₂, di-C₁-C₄-alkylamino, og cyano,

R⁷ er valgt fra gruppen bestående av H, halogen, hydroksyl, okso, C₁-C₄ alkyl, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl, halogen-C₁-C₄-alkyl, som

inneholder 1 til 5 halogener, C₁-C₄-alkoksy, og halogen-C₁-C₄-alkoksy;

R¹⁰ er valgt fra gruppen bestående av C₁-C₄ alkyl, halogen, C₁-C₄ alkoksy, og halogen-C₁-C₂-alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener, hvor halogen er F eller Cl;

n¹, ved hver forekomst, er valgt fra 0, 1, 2, 3, 4 eller 5; og

p, ved hver forekomst, er valgt fra 0, 1 og 2.

3. Forbindelsen som definert i krav 1, hvor:

W er O eller S;

R⁰ er R¹;

Y er S eller -CR⁸=CR⁹-;

R¹ er uavhengig valgt fra gruppen bestående av:

H,

halogen,

C₁-C₄ alkyl,

C₂-C₃ alkenyl,

C₂-C₃ alkynyl,

C₃-C₄ cykloalkyl,

C₁-C₄ alkoksy,

C₁-C₄ alkyltio,

halogen-C₁-C₂-alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener, hvor halogen er F eller Cl,

halogen-C₃-C₄ cykloalkyl,

halogen-C₁-C₂ alkoksy, og

halogen-C₁-C₂ alkyltio;

R⁸ og R⁹ er uavhengig valgt fra gruppen bestående av:

H,

halogen,

C₁-C₄ alkyl,

C₁-C₄ alkoksy,

halogen-C₁-C₂ alkyl, og

halogen-C₁-C₂ alkoksy;

forutsatt at minst én av R¹, R⁸ og R⁹ er forskjellig fra H;

R² er valgt fra gruppen bestående av:

5

H,

halogen, og

C₁-C₄ alkyl;

10

X¹ er valgt fra gruppen bestående av CH, N eller CR¹⁰;

X², X³ og X⁴ er uavhengig valgt fra CR³ eller N;

R³ er valgt fra gruppen bestående av H, C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₁-

C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyltio, halogen, OH, CN, OCF₃, C₁-C₂-alkoksy-C₁-C₂-alkoksy,

halogen-C₁-C₃-alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener, og -(CH₂)_n¹-fenyl substituert

15

med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-

C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH,

OCHF₂, di-C₁-C₄-alkylamino, og cyano;

R⁴ og R⁵ er uavhengig valgt fra H og C₁-C₆ alkyl, eller R⁴ og R⁵ kan tas sammen

med karbonet som de er bundet til, for å danne en C₃-C₇ cykloalkylring;

20



er en 5-leddet heteroarylring som inneholder minst ett O-, N- eller S-atom;

R⁶ er valgt fra gruppen bestående av H, halogen, OCF₃, OCHF₂, OH, CN, NO₂,

25

NR¹¹R¹², COOH, C₁-C₄ alkoksykarbonyl, (C=O)NR¹¹R¹² og C₁-C₅ alkyl substituert

med 0 til 7 grupper uavhengig valgt fra halogen, CF₃, OCF₃, OH, hydroksy-C₁-C₄-

alkyl, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkoksy-C₁-C₄ alkoksy, di-C₁-C₄-alkylaminofenyl-C₁-C₄-

alkyl, (di-C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl)-C₁-C₄-alkyl, di-C₁-C₄-alkylamino, C₃-C₆-

cykloalkyl, og C₁-C₄ alkyltio, eller

30

R⁶ er B-D-, hvor D er en linker, som er valgt fra:

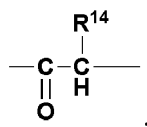
en enkeltbinding,

-O-,

-S-,

35





C₁-C₄ alkylen substituert med 0 til 4 grupper uavhengig valgt fra halogen eller OH,

C₁-C₄ alkylenoksy,

C₁-C₄ alkylentio,

C₂-C₆ alkenylen, og

B er valgt fra gruppen bestående av:

C₆-C₁₀ aryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, halogen-C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, halogen-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl, cyano, nitro, NR¹¹R¹², OH, C₁-C₄-alkylkarbonyloksy-C₁-C₄-alkyl, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, COOR¹⁴,

SO₂R¹⁴ (C=O)NR¹¹R¹², SO₂NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)OR¹⁴, N(R¹³)(C=O)R¹⁴, NR¹³S(O)R¹⁴, NR¹³SO₂R¹⁴, O(C=O)NR¹¹R¹², O(C=O)OR¹⁴, O(C=O)R¹⁴, (C=O)OR¹⁴, og 5-6-leddet heteroaryl,

5- til 10-leddet heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, halogen-C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, halogen-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl, cyano, nitro, NR¹¹R¹², OH, C₁-C₄-alkylkarbonyloksy-C₁-C₄-alkyl, hydroksy-C₁-C₄-alkyl,

COOR¹⁴ SO₂R¹⁴ (C=O)NR¹¹R¹², SO₂NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)OR¹⁴, N(R¹³)(C=O)R¹⁴, NR¹³S(O)R¹⁴, NR¹³SO₂R¹⁴, O(C=O)NR¹¹R¹², O(C=O)OR¹⁴, O(C=O)R¹⁴, (C=O)OR¹⁴, 5-6-leddet heteroaryl, og (CH₂)fenyl,

4- til 10-leddet heterocyklyl inneholdende karbonatomer og 1 til 2 ytterligere heteroatomer valgt fra N, O, og S, og substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, okso, -(CHR¹³)_n¹⁻⁵⁻ eller 6-leddet heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen

bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, og CF₂CH₃; NR¹³S(O)R¹⁴, NR¹³SO₂R¹⁴, -(CHR¹³)_n¹⁻⁴⁻ til 10-leddet-heterocyklyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, og CF₂CH₃; OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄ alkoksy, halogen-C₁-C₄ alkoksy, di-C₁-C₄-alkylamino-C₁-C₄-alkyl, NR¹¹R¹², cyano, C₁-C₄ alkyl, halogen-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl, C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl-C₁-C₄-alkylkarbonyl,

C₆-C₁₀ arylkarbonyl, C₁-C₄-alkylkarbonyloksy-C₁-C₄-alkyl, COOR¹⁴,
 SO₂R¹⁴ (C=O)NR¹¹R¹², SO₂NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)OR¹⁴,
 N(R¹³)(C=O)R¹⁴, O(C=O)NR¹¹R¹², O(C=O)OR¹⁴, O(C=O)R¹⁴, (C=O)OR¹⁴, og C₆-
 C₁₀ aryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående
 5 av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, C₁-C₄-alkoksykarbonyl,
 (C=O)NR¹¹R¹² CF₃, OCF₃, og CF₂CH₃;

C₃-C₆ sykloalkyl som kan inneholde umettethet, substituert med 0 til 3 grupper
 uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet
 heteroaryl, OH, okso, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₆-C₁₀ aryl, COOH, okso, C₁-C₄-
 10 alkoksykarbonyl, (C=O)NR¹¹R¹², og C₁-C₄ alkyl; og

C₅-C₁₁ spirocykloalkyl som kan inneholde umettethet og eventuelt inneholdende
 1 til 3 heteroatomer valgt fra O, N eller S og substituert med 0 til 3 grupper
 uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet
 heteroaryl, OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₆-C₁₀ aryl, og C₁-C₄ alkyl;

R¹¹ og R¹² er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av:

H,

C₁-C₄ alkyl,

20 halogen-C₁-C₄-alkyl,

C₂-C₄ alkenyl,

-(CR¹⁴R¹⁴)_n¹-fenyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen
 bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, 5-
 eller 6-leddet heteroaryl, OH, OCHF₂, di-C₁-C₄-alkylamino, og cyano,

25 -(CHR¹³)_n¹-C₃-C₆-cykloalkyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra
 gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH,
 hydroksy-C₁-C₄-alkyl, og C₁-C₄ alkyl,

30 -(CHR¹³)_n¹-4- til 10-leddet-heterocyklyl substituert med 0 til 3 grupper
 uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet
 heteroaryl, OH, okso, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, og C₁-C₄ alkyl,

-(CHR¹³)_n¹-5- til 10-leddet-heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig
 valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet
 heteroaryl, OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, og C₁-C₄ alkyl,

di-C₁-C₄-alkylamino-C₁-C₄-alkyl,

35 di-C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl,

hydroksy-C₁-C₄-alkyl,

cyano-C₁-C₄-alkyl,

C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl,

C₁-C₄-alkoksykarbonyl-C₁-C₄-alkyl,

C₁-C₄-alkoksykarbonyl,

C₁-C₄-alkylkarbonyl,

fenylkarbonyl;

5 C₁-C₄-alkoksykarbonylamino-C₁-C₄-alkylkarbonyl,

di-C₁-C₄-alkylamino-C₁-C₄-alkylkarbonyl,

amino-C₁-C₄-alkylkarbonyl,

4- til 10-leddet-heterocyklyl-karbonyl, og

10 alternativt, R¹¹ og R¹², når festet til det samme nitrogen, kombineres for å danne en 4- til 8-leddet heterocyklisk ring inneholdende karbonatomer substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, CHF₂, OCF₃, OCHF₂, OCH₂F, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, okso, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄ alkyl og C₁-C₄ alkoksy, og 0 til 2 ytterligere heteroatomer valgt fra N, NR¹³, O og S(O)_p;

15 R¹³ er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av H, C₁-C₆ alkyl og -(CH₂)fenyl;

R¹⁴ er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av H, C₁-C₆ alkyl, halogen-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoksykarbonylamino, (C₆-C₁₀ arylkarbonylamino) og -(CH₂)_n¹fenyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, OCHF₂, di-C₁-C₄-alkylamino, og cyano,

20 R⁷ er valgt fra gruppen bestående av H, halogen, hydroksyl, okso, C₁-C₄ alkyl, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl, halogen-C₁-C₄-alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener, og C₁-C₄-alkoksy;

25 R¹⁰ er valgt fra gruppen bestående av C₁-C₄ alkyl, halogen, og halogen-C₁-C₂-alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener, hvor halogen er F eller Cl;

n¹, ved hver forekomst, er valgt fra 0, 1, 2, 3 eller 4; og

p, ved hver forekomst, er valgt fra 0, 1 og 2.

30

4. Forbindelsen som definert i krav 1 hvor:

W er O;

R⁰ er R¹;

35 Y er S eller -CR⁸=CR⁹-;

R¹ er uavhengig valgt fra gruppen bestående av:

H,

- halogen,
 C₁-C₄ alkyl,
 C₂-C₃ alkenyl,
 C₂-C₃ alkynyl,
 5 C₃-C₄ cykloalkyl,
 C₁-C₄ alkoksy,
 C₁-C₄ alkyltio,
 halogen-C₁-C₂-alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener, hvor halogen er F eller
 Cl, og
 10 halogen-C₃-C₄ cykloalkyl;

R⁸ og R⁹ er uavhengig valgt fra gruppen bestående av:

- 15 H,
 halogen,
 C₁-C₄ alkyl,
 C₁-C₄ alkoksy, og
 halogen-C₁-C₂ alkyl;

- 20 forutsatt at minst én av R¹, R⁸ og R⁹ er forskjellig fra H;
 R² er valgt fra gruppen bestående av:

- 25 H,
 halogen, og
 C₁-C₄ alkyl;

- X¹ er valgt fra gruppen bestående av CH, N eller CR¹⁰;
 X², X³ og X⁴ er uavhengig valgt fra CR³;
 R³ er valgt fra gruppen bestående av H, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyltio,
 30 halogen, OH, CN, OCF₃, C₁-C₂-alkoksy-C₁-C₂-alkoksy, halogen-C₁-C₃-alkyl, som
 inneholder 1 til 5 halogener, og -(CH₂)_n¹-fenyl substituert med 0 til 3 grupper
 uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl,
 cyklopropyl, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, OCHF₂, di-C₁-C₄-
 alkylamino, og cyano;
 35 R⁴ og R⁵ er uavhengig valgt fra H og C₁-C₆ alkyl;



er en 5-leddet heteroarylring som inneholder minst ett O-, N- eller S-atom;

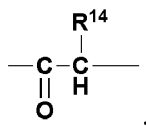
5 R^6 er valgt fra gruppen bestående av H, halogen, OCF_3 , $OCHF_2$, OH, CN, NO_2 , $NR^{11}R^{12}$, C₁-C₄ alkoksykarbonyl, $(C=O)NR^{11}R^{12}$ og C₁-C₅ alkyl substituert med 0 til 7 grupper uavhengig valgt fra halogen, CF_3 , OCF_3 , OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkoksy-C₁-C₄ alkoksy, di-C₁-C₄-alkylaminofenyl-C₁-C₄-alkyl, (di-C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl)-C₁-C₄-alkyl, di-C₁-C₄-alkylamino, C₃-C₆-cykloalkyl, og C₁-C₄ alkyltio, eller

10 R^6 er B-D-, hvor D er en linker, som er valgt fra:

en enkeltbinding,

-O-,

15 -S-,



20

C₁-C₄ alkylen substituert med 0 til 4 grupper uavhengig valgt fra halogen eller OH,

C₁-C₄ alkylenoksy,

C₂-C₆ alkenylen, og

25

B er valgt fra gruppen bestående av:

C₆-C₁₀ aryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, halogen-C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, halogen-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl, cyano, nitro, $NR^{11}R^{12}$, OH, C₁-C₄-alkylkarbonyloksy-C₁-C₄-alkyl, hydroksy-C₁-C₄-alkyl,

30

$COOR^{14}$ SO_2R^{14} $(C=O)NR^{11}R^{12}$, $SO_2NR^{11}R^{12}$, $N(R^{13})(C=O)NR^{11}R^{12}$, $N(R^{13})(C=O)OR^{14}$, $N(R^{13})(C=O)R^{14}$, $NR^{13}S(O)R^{14}$, $NR^{13}SO_2R^{14}$, $O(C=O)NR^{11}R^{12}$, $O(C=O)OR^{14}$, $O(C=O)R^{14}$, $(C=O)OR^{14}$, og 5-6-leddet heteroaryl,

- 5- til 10-leddet heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, halogen-C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, halogen-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl, cyano, nitro, NR¹¹R¹², OH, C₁-C₄-alkylkarbonyloksy-C₁-C₄-alkyl, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, COOR¹⁴,
5 SO₂R¹⁴ (C=O)NR¹¹R¹², SO₂NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)OR¹⁴, N(R¹³)(C=O)R¹⁴, NR¹³S(O)R¹⁴, NR¹³SO₂R¹⁴, O(C=O)NR¹¹R¹², O(C=O)OR¹⁴, O(C=O)R¹⁴, (C=O)OR¹⁴, 5-6-leddet heteroaryl, og (CH₂)fenyl,
4- til 10-leddet heterocyklyl inneholdende karbonatomer og 1 til 2 ytterligere heteroatomer valgt fra N, O, og S, og substituert med 0 til 3 grupper uavhengig
10 valgt fra gruppen bestående av halogen, okso, -(CHR¹³)_n¹⁻⁵- eller 6-leddet heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, og CF₂CH₃; NR¹³S(O)R¹⁴, NR¹³SO₂R¹⁴, -(CHR¹³)_n¹⁻⁴- til 10-leddet-heterocyklyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av
15 halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, og CF₂CH₃; OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄ alkoksy, halogen-C₁-C₄ alkoksy, di-C₁-C₄-alkylamino-C₁-C₄-alkyl, NR₁₁R₁₂, cyano, C₁-C₄ alkyl, halogen-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl, C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl-C₁-C₄-alkylkarbonyl, C₆-C₁₀ arylkarbonyl, C₁-C₄-alkylkarbonyloksy-C₁-C₄-alkyl, COOR¹⁴, SO₂R¹⁴,
20 (C=O)NR¹¹R¹², SO₂NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)OR¹⁴, N(R¹³)(C=O)R¹⁴, O(C=O)NR¹¹R¹², O(C=O)OR¹⁴, O(C=O)R¹⁴, (C=O)OR¹⁴, og C₆-C₁₀ aryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, C₁-C₄-alkoksykarbonyl, (C=O)NR¹¹R¹², CF₃, OCF₃, og CF₂CH₃;
25 C₃-C₆ cykloalkyl som kan inneholde umettethet, substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, okso, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₆-C₁₀ aryl, COOH, okso, C₁-C₄-alkoksykarbonyl, (C=O)NR¹¹R¹², og C₁-C₄ alkyl; og
C₅-C₁₁ spirocykloalkyl som kan inneholde umettethet og eventuelt inneholdende
30 1 til 3 heteroatomer valgt fra O, N eller S og substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₆-C₁₀ aryl, og C₁-C₄ alkyl;

R¹¹ og R¹² er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av:

35

H,
C₁-C₄ alkyl,
halogen-C₁-C₄-alkyl,

C₂-C₄ alkenyl,

-(CR¹⁴R¹⁴)_n¹-fenyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, OCHF₂, di-C₁-C₄-alkylamino, og cyano,

5 -(CHR¹³)_n¹-C₃-C₆-cykloalkyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, og C₁-C₄ alkyl,

10 -(CHR¹³)_n¹-4- til 10-leddet-heterocyklyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, okso, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, og C₁-C₄ alkyl,

-(CHR¹³)_n¹-5- til 10-leddet-heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, og C₁-C₄ alkyl,

di-C₁-C₄-alkylamino-C₁-C₄-alkyl,

15 di-C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl,

hydroksy-C₁-C₄-alkyl,

cyano-C₁-C₄-alkyl,

C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl,

C₁-C₄-alkoksykarbonyl-C₁-C₄-alkyl,

20 C₁-C₄-alkoksykarbonyl,

C₁-C₄-alkylkarbonyl,

fenylkarbonyl;

C₁-C₄-alkoksykarbonylamino-C₁-C₄-alkylkarbonyl, og

di-C₁-C₄-alkylamino-C₁-C₄-alkylkarbonyl,

25 alternativt, R¹¹ og R¹², når festet til det samme nitrogen, kombineres for å danne en 4- til 8-leddet heterocyklisk ring inneholdende karbonatomer substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, CHF₂, OCF₃, OCHF₂, OCH₂F, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, okso, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄ alkyl og C₁-C₄ alkoksy, og 0 til 2 ytterligere heteroatomer valgt fra N, NR¹³, O og S(O)_p;

R¹³ er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av H, C₁-C₆ alkyl og -(CH₂)fenyl;

35 R¹⁴ er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av H, C₁-C₆ alkyl, halogen-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoksykarbonylamino og -(CH₂)_n¹fenyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, OCHF₂, di-C₁-C₄-alkylamino, og cyano,

R^7 er valgt fra gruppen bestående av H, halogen, hydroksyl, okso, C_1 - C_4 alkyl, hydroksy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkoksy- C_1 - C_4 -alkyl og halogen- C_1 - C_4 -alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener;

R^{10} er valgt fra gruppen bestående av C_1 - C_4 alkyl, halogen, og halogen- C_1 - C_2 -alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener, hvor halogen er F eller Cl;

n^1 , ved hver forekomst, er valgt fra 0, 1, 2 eller 3; og

p , ved hver forekomst, er valgt fra 0, 1 og 2.

5. Forbindelsen som definert i krav 1, hvor:

W er O;

R^0 er R^1 ;

Y er S eller $-CR^8=CR^9-$;

R^1 er uavhengig valgt fra gruppen bestående av:

H,

halogen,

C_1 - C_4 alkyl,

C_2 - C_3 alkenyl,

C_2 - C_3 alkynyl,

C_3 - C_4 cykloalkyl,

C_1 - C_4 alkoksy,

C_1 - C_4 alkyltio, og

halogen- C_1 - C_2 -alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener, hvor halogen er F eller

Cl;

R^8 og R^9 er uavhengig valgt fra gruppen bestående av:

H,

halogen,

C_1 - C_4 alkyl, og

halogen- C_1 - C_2 alkyl;

forutsatt at minst én av R^1 , R^8 og R^9 er forskjellig fra H;

R^2 er valgt fra gruppen bestående av:

H,

halogen, og

C₁-C₄ alkyl;

X¹ er valgt fra gruppen bestående av CH, N eller CR¹⁰;

X², X³ og X⁴ er uavhengig valgt fra CR³;

- 5 R³ er valgt fra gruppen bestående av H, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyltio, halogen, OH, CN, OCF₃, halogen-C₁-C₃-alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener, og -(CH₂)_n¹-fenyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, OCHF₂, di-C₁-C₄-alkylamino, og cyano;
- 10 R⁴ og R⁵ er uavhengig valgt fra H og C₁-C₆ alkyl;



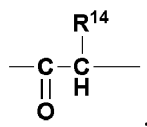
er en 5-leddet heteroarylring som inneholder minst ett O-, N- eller S-atom;

- 15 R⁶ er valgt fra gruppen bestående av H, halogen, OCF₃, OCHF₂, OH, NR¹¹R¹², C₁-C₄ alkoksykarbonyl, (C=O)NR¹¹R¹² og C₁-C₅ alkyl substituert med 0 til 7 grupper uavhengig valgt fra halogen, CF₃, OCF₃, OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkoksy-C₁-C₄ alkoksy, di-C₁-C₄-alkylaminofenyl-C₁-C₄-alkyl, (di-C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl)-C₁-C₄-alkyl, di-C₁-C₄-alkylamino, C₃-C₆-cykloalkyl, og C₁-C₄ alkyltio, eller
- 20 R⁶ er B-D-, hvor D er en linker, som er valgt fra:

en enkeltbinding,

-O-,

- 25 -S-,



30

C₁-C₄ alkylen substituert med 0 til 4 grupper uavhengig valgt fra halogen eller OH,
C₂-C₆ alkenylen, og

B er valgt fra gruppen bestående av:

- 5 C₆-C₁₀ aryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, halogen-C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, halogen-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl, cyano, nitro, NR¹¹R¹², OH, C₁-C₄-alkylkarbonyloksy-C₁-C₄-alkyl, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, COOR¹⁴, SO₂R¹⁴, (C=O)NR¹¹R¹², SO₂NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)OR¹⁴, N(R¹³)(C=O)R¹⁴, NR¹³S(O)R¹⁴, NR¹³SO₂R¹⁴, O(C=O)NR¹¹R¹², O(C=O)OR¹⁴, O(C=O)R¹⁴, (C=O)OR¹⁴, og 5-6-leddet heteroaryl,
- 10 5- til 10-leddet heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, halogen-C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, halogen-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl, cyano, nitro, NR¹¹R¹², OH, C₁-C₄-alkylkarbonyloksy-C₁-C₄-alkyl, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, COOR¹⁴, SO₂R¹⁴, (C=O)NR¹¹R¹², SO₂NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)OR¹⁴, N(R¹³)(C=O)R¹⁴, NR¹³S(O)R¹⁴, NR¹³SO₂R¹⁴, O(C=O)NR¹¹R¹², O(C=O)OR¹⁴, O(C=O)R¹⁴, (C=O)OR¹⁴, 5-6-leddet heteroaryl, og (CH₂)fenyl,
- 15 4- til 10-leddet heterocyklyl inneholdende karbonatomer og 1 til 2 ytterligere heteroatomer valgt fra N, O, og S, og substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, okso, -(CHR¹³)_n¹⁻⁵- eller 6-leddet heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, og CF₂CH₃; NR¹³S(O)R¹⁴, NR¹³SO₂R¹⁴, -(CHR¹³)_n¹⁻⁴- til 10-leddet-heterocyklyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, og CF₂CH₃; OH,
- 20 hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄ alkoksy, halogen-C₁-C₄ alkoksy, di-C₁-C₄-alkylamino-C₁-C₄-alkyl, NR¹¹R¹², cyano, C₁-C₄ alkyl, halogen-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl, C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl-C₁-C₄-alkylkarbonyl, C₆-C₁₀ arylkarbonyl, C₁-C₄-alkylkarbonyloksy-C₁-C₄-alkyl, COOR¹⁴, SO₂R¹⁴, (C=O)NR¹¹R¹², SO₂NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)OR¹⁴, N(R¹³)(C=O)R¹⁴, O(C=O)NR¹¹R¹², O(C=O)OR¹⁴, O(C=O)R¹⁴, (C=O)OR¹⁴, og C₆-C₁₀ aryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, C₁-C₄-alkoksykarbonyl, (C=O)NR¹¹R¹², CF₃, OCF₃, og CF₂CH₃; og
- 25 C₃-C₆ cykloalkyl som kan inneholde umettethet, substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, okso, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₆-C₁₀ aryl, COOH, okso, C₁-C₄-alkoksykarbonyl, (C=O)NR¹¹R¹², og C₁-C₄ alkyl;
- 30
- 35

R^{11} og R^{12} er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av:

- 5 H,
 C₁-C₄ alkyl,
 halogen-C₁-C₄-alkyl,
 C₂-C₄ alkenyl,
 -(CR¹⁴R¹⁴)_n¹-fenyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen
 bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, 5-
 eller 6-leddet heteroaryl, OH, OCHF₂, di-C₁-C₄-alkylamino, og cyano,
 10 -(CHR¹³)_n¹-C₃-C₆-cykloalkyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra
 gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH,
 hydroksy-C₁-C₄-alkyl, og C₁-C₄ alkyl,
 -(CHR¹³)_n¹-4- til 10-leddet-heterocyklyl substituert med 0 til 3 grupper
 uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet
 15 heteroaryl, OH, okso, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, og C₁-C₄ alkyl,
 -(CHR¹³)_n¹-5- til 10-leddet-heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig
 valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet
 heteroaryl, OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, og C₁-C₄ alkyl,
 di-C₁-C₄-alkylamino-C₁-C₄-alkyl,
 20 di-C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl,
 hydroksy-C₁-C₄-alkyl,
 cyano-C₁-C₄-alkyl,
 C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl,
 C₁-C₄-alkoksykarbonyl-C₁-C₄-alkyl,
 25 C₁-C₄-alkoksykarbonyl,
 C₁-C₄-alkylkarbonyl, og
 fenylkarbonyl;

alternativt, R^{11} og R^{12} , når festet til det samme nitrogen, kombineres for å danne
 30 en 4- til 8-leddet heterocyklisk ring inneholdende karbonatomer substituert med 0
 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, CHF₂, OCF₃,
 OCHF₂, OCH₂F, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, okso, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-
 C₄ alkyl og C₁-C₄ alkoksy, og 0 til 2 ytterligere heteroatomer valgt fra N, NR¹³, O og
 S(O)_p;

35 R^{13} er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av H, C₁-
 C₆ alkyl og -(CH₂)_nfenyl;

R^{14} er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av H, C₁-
 C₆ alkyl, halogen-C₁-C₄-alkyl og -(CH₂)_n¹fenyl substituert med 0 til 3 grupper

uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, OCHF₂, di-C₁-C₄-alkylamino, og cyano,

R⁷ er valgt fra gruppen bestående av H, halogen, okso, C₁-C₄alkyl, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl og halogen-C₁-C₄-alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener;

R¹⁰ er valgt fra gruppen bestående av C₁-C₄ alkyl, halogen, og halogen-C₁-C₂-alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener, hvor halogen er F eller Cl;

n¹, ved hver forekomst, er valgt fra 0, 1, 2 eller 3; og

p, ved hver forekomst, er valgt fra 0, 1 og 2.

6. Forbindelsen som definert i krav 1 hvor:

W er O;

R⁰ er R¹;

Y er S eller -CR⁸=CR⁹-;

R¹ er uavhengig valgt fra gruppen bestående av:

H,

halogen,

C₁-C₄ alkyl,

C₂-C₃ alkenyl,

C₁-C₄ alkoksy,

C₁-C₄ alkyltio, og

halogen-C₁-C₂-alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener, hvor halogen er F eller Cl;

R⁸ og R⁹ er uavhengig valgt fra gruppen bestående av:

H,

halogen,

C₁-C₄ alkyl, og

halogen-C₁-C₂ alkyl;

forutsatt at minst én av R¹, R⁸ og R⁹ er forskjellig fra H;

R² er valgt fra gruppen bestående av:

H,

halogen, og
C₁-C₄ alkyl;

X¹ er valgt fra gruppen bestående av CH eller CR¹⁰;

5 X², X³ og X⁴ er uavhengig valgt fra CR³;

R³ er valgt fra gruppen bestående av H, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyltio, halogen, OH, halogen-C₁-C₃-alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener, og -(CH₂)_n¹-fenyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet

10 heteroaryl, OH, OCHF₂, di-C₁-C₄-alkylamino, og cyano;

R⁴ og R⁵ er uavhengig valgt fra H og C₁-C₆ alkyl;



15 er en 5-leddet heteroarylring som inneholder minst ett O-, N- eller S-atom;

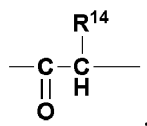
R⁶ er valgt fra gruppen bestående av H, halogen, OH, NR¹¹R¹², C₁-C₄ alkoksykarbonyl, (C=O)NR¹¹R¹² og C₁-C₅ alkyl substituert med 0 til 7 grupper uavhengig valgt fra halogen, CF₃, OCF₃, OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkoksy-C₁-C₄ alkoksy, di-C₁-C₄-alkylaminofenyl-C₁-C₄-alkyl, (di-C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl)-C₁-C₄-alkyl, di-C₁-C₄-alkylamino, C₃-C₆-cykloalkyl, og C₁-C₄ alkyltio, eller

20

R⁶ er B-D-, hvor D er en linker, som er valgt fra:

en enkeltbinding,

25 -O-,



30

C₁-C₄ alkylen substituert med 0 til 4 grupper uavhengig valgt fra halogen eller OH,

C₂-C₆ alkenylen, og

B er valgt fra gruppen bestående av:

- 5 C₆-C₁₀ aryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, halogen-C₁-C₄alkoksy, C₁-C₄ alkyl, halogen-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl, cyano, nitro, NR¹¹R¹², OH, C₁-C₄-alkylkarbonyloksy-C₁-C₄-alkyl, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, COOR¹⁴, SO₂R¹⁴, (C=O)NR¹¹R¹², SO₂NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)OR¹⁴, N(R¹³)(C=O)R¹⁴, NR¹³S(O)R¹⁴, NR¹³SO₂R¹⁴, O(C=O)NR¹¹R¹², O(C=O)OR¹⁴, O(C=O)R¹⁴, (C=O)OR¹⁴, og 5-6-leddet heteroaryl,
- 10 5- til 10-leddet heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄alkoksy, halogen-C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, halogen-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl, cyano, nitro, NR¹¹R¹², OH, C₁-C₄-alkylkarbonyloksy-C₁-C₄-alkyl, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, COOR¹⁴, SO₂R¹⁴, (C=O)NR¹¹R¹², SO₂NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)OR¹⁴, N(R¹³)(C=O)R¹⁴, NR¹³S(O)R¹⁴, NR¹³SO₂R¹⁴, O(C=O)NR¹¹R¹², O(C=O)OR¹⁴, O(C=O)R¹⁴, (C=O)OR¹⁴, 5-6-leddet heteroaryl, og (CH₂)fenyl,
- 15 4- til 10-leddet heterocyklyl inneholdende karbonatomer og 1 til 2 ytterligere heteroatomer valgt fra N, O, og S, og substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, okso, -(CHR¹³)_n¹⁻⁵⁻ eller 6-leddet heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, og CF₂CH₃; NR¹³S(O)R¹⁴, NR¹³SO₂R¹⁴, -(CHR¹³)_n¹⁻⁴⁻ til 10-leddet-heterocyklyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, og CF₂CH₃; OH,
- 20 hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄ alkoksy, halogen-C₁-C₄ alkoksy, di-C₁-C₄-alkylamino-C₁-C₄-alkyl, NR₁₁R₁₂, cyano, C₁-C₄ alkyl, halogen-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl, C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl-C₁-C₄-alkylkarbonyl, C₆-C₁₀arylkarbonyl, C₁-C₄-alkylkarbonyloksy-C₁-C₄-alkyl, COOR¹⁴, SO₂R¹⁴, (C=O)NR¹¹R¹², SO₂NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)OR¹⁴, N(R¹³)(C=O)R¹⁴, O(C=O)NR¹¹R¹², O(C=O)OR¹⁴, O(C=O)R¹⁴, (C=O)OR¹⁴, og C₆-C₁₀ aryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, C₁-C₄-alkoksykarbonyl, (C=O)NR¹¹R¹², CF₃, OCF₃, og CF₂CH₃; og
- 25 C₃-C₆ cykloalkyl som kan inneholde umettethet, substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, okso, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₆-C₁₀ aryl, COOH, okso, C₁-C₄-alkoksykarbonyl, (C=O)NR¹¹R¹², og C₁-C₄ alkyl;
- 30
- 35

R^{11} og R^{12} er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av:

- 5 H,
 C₁-C₄ alkyl,
 halogen-C₁-C₄-alkyl,
 C₂-C₄ alkenyl,
 -(CR¹⁴R¹⁴)_n¹-fenyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen
 bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, 5-
 eller 6-leddet heteroaryl, OH, OCHF₂, di-C₁-C₄-alkylamino, og cyano,
 10 -(CHR¹³)_n¹-C₃-C₆-cykloalkyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra
 gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH,
 hydroksy-C₁-C₄-alkyl, og C₁-C₄ alkyl,
 -(CHR¹³)_n¹-4- til 10-leddet-heterocyklyl substituert med 0 til 3 grupper
 uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet
 15 heteroaryl, OH, okso, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, og C₁-C₄ alkyl,
 -(CHR¹³)_n¹-5- til 10-leddet-heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig
 valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet
 heteroaryl, OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, og C₁-C₄ alkyl,
 di-C₁-C₄-alkylamino-C₁-C₄-alkyl,
 20 di-C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl,
 hydroksy-C₁-C₄-alkyl,
 cyano-C₁-C₄-alkyl,
 C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl,
 C₁-C₄-alkoksykarbonyl-C₁-C₄-alkyl, og
 25 C₁-C₄-alkoksykarbonyl;

alternativt, R^{11} og R^{12} , når festet til det samme nitrogen, kombineres for å danne
 en 4- til 8-leddet heterocyklisk ring inneholdende karbonatomer substituert med 0
 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, CHF₂, OCF₃,
 30 OCHF₂, OCH₂F, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, okso, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-
 C₄ alkyl og C₁-C₄ alkoksy, og 0 til 2 ytterligere heteroatomer valgt fra N, NR¹³, O og
 S(O)_p;

R^{13} er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av H, C₁-
 C₆ alkyl og -(CH₂)_nfenyl;

35 R^{14} er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av H, C₁-
 C₆ alkyl og -(CH₂)_n¹fenyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra
 gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃,
 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, OCHF₂, di-C₁-C₄-alkylamino, og cyano,

R^7 er valgt fra gruppen bestående av H, halogen, C_1 - C_4 alkyl, hydrokso- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkokso- C_1 - C_4 -alkyl og halogen- C_1 - C_4 -alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener; R^{10} er valgt fra gruppen bestående av C_1 - C_4 alkyl, halogen, og halogen- C_1 - C_2 -alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener, hvor halogen er F eller Cl;

5 n^1 , ved hver forekomst, er valgt fra 0, 1, 2 eller 3; og
 p , ved hver forekomst, er valgt fra 0, 1 og 2.

7. Forbindelsen som definert i krav 1 hvor:

10 W er O;
 R^0 er R^1 ;
Y er S eller $-CR^8=CR^9-$;
 R^1 er uavhengig valgt fra gruppen bestående av:

15 H,
halogen,
 C_1 - C_4 alkyl,
 C_1 - C_4 alkokso,
 C_1 - C_4 alkyltio, og
20 halogen- C_1 - C_2 -alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener, hvor halogen er F eller Cl;

R^8 og R^9 er uavhengig valgt fra gruppen bestående av:

25 H,
 C_1 - C_4 alkyl, og
halogen- C_1 - C_2 alkyl;

forutsatt at minst én av R^1 , R^8 og R^9 er forskjellig fra H;

30 R^2 er valgt fra gruppen bestående av:

H, og
halo;

35 X^1 er valgt fra gruppen bestående av CH eller CR^{10} ;
 X^2 , X^3 og X^4 er uavhengig valgt fra CR^3 ;
 R^3 er valgt fra gruppen bestående av H, C_1 - C_4 alkyl, C_1 - C_4 alkokso, C_1 - C_4 alkyltio, halogen, halogen- C_1 - C_3 -alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener, og $-(CH_2)_n^1$ -fenyl

substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, OCHF₂, di-C₁-C₄-alkylamino, og cyano;
R⁴ og R⁵ er uavhengig valgt fra H og C₁-C₆ alkyl;

5



er en 5-leddet heteroarylring som inneholder minst ett O-, N- eller S-atom;
R⁶ er valgt fra gruppen bestående av H, halogen, NR¹¹R¹², C₁-C₄ alkoksylkarbonyl, (C=O)NR¹¹R¹² og C₁-C₅ alkyl substituert med 0 til 7 grupper uavhengig valgt fra halogen, CF₃, OCF₃, OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkoksy-C₁-C₄ alkoksy, di-C₁-C₄-alkylaminofenyl-C₁-C₄-alkyl, (di-C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl)-C₁-C₄-alkyl, di-C₁-C₄-alkylamino, C₃-C₆-cykloalkyl, og C₁-C₄ alkyltio, eller
R⁶ er B-D-, hvor D er en linker, som er valgt fra:

15

en enkeltbinding,
-O-,



20

C₁-C₄ alkylen substituert med 0 til 4 grupper uavhengig valgt fra halogen eller OH,
C₂-C₆ alkenylen, og

25

B er valgt fra gruppen bestående av:

C₆-C₁₀ aryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, halogen-C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, halogen-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl, cyano, nitro, NR¹¹R¹², OH, C₁-C₄-alkylkarbonyloksy-C₁-C₄-alkyl, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, COOR¹⁴, SO₂R¹⁴, (C=O)NR¹¹R¹², SO₂NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)OR¹⁴, N(R¹³)(C=O)R¹⁴, NR¹³S(O)R¹⁴, NR¹³SO₂R¹⁴, O(C=O)NR¹¹R¹², O(C=O)OR¹⁴, O(C=O)R¹⁴, (C=O)OR¹⁴, og 5-6-leddet heteroaryl,

30

5- til 10-leddet heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, halogen-C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, halogen-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆cykloalkyl, cyano, nitro, NR¹¹R¹², OH, C₁-C₄-

35

alkylkarbonyloksy-C₁-C₄-alkyl, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, COOR¹⁴, SO₂R¹⁴,
 (C=O)NR¹¹R¹², SO₂NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)OR¹⁴,
 N(R¹³)(C=O)R¹⁴, NR¹³S(O)R¹⁴, NR¹³SO₂R¹⁴, O(C=O)NR¹¹R¹², O(C=O)OR¹⁴,
 O(C=O)R¹⁴, (C=O)OR¹⁴, 5-6-leddet heteroaryl, og (CH₂)fenyl,
 4- til 10-leddet heterocyklyl inneholdende karbonatomer og 1 til 2 ytterligere
 heteroatomer valgt fra N, O, og S, og substituert med 0 til 3 grupper uavhengig
 valgt fra gruppen bestående av halogen, okso, -(CHR¹³)_n¹-5- eller 6-leddet
 heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen
 bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, og
 CF₂CH₃; NR¹³S(O)R¹⁴, NR¹³SO₂R¹⁴, -(CHR¹³)_n¹-4- til 10-leddet-heterocyklyl
 substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av
 halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, og CF₂CH₃; OH,
 hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄ alkoksy, halogen-C₁-C₄ alkoksy, di-C₁-C₄-
 alkylamino-C₁-C₄-alkyl, NR₁₁R₁₂, cyano, C₁-C₄ alkyl, halogen-C₁-C₄ alkyl, C₃-
 C₆ cykloalkyl, C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl-C₁-C₄-alkylkarbonyl,
 C₆-C₁₀ arylkarbonyl, C₁-C₄-alkylkarbonyloksy-C₁-C₄-alkyl, COOR¹⁴, SO₂R¹⁴,
 (C=O)NR¹¹R¹², SO₂NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)OR¹⁴,
 N(R¹³)(C=O)R¹⁴, O(C=O)NR¹¹R¹², O(C=O)OR¹⁴, O(C=O)R¹⁴, (C=O)OR¹⁴, og C₆-
 C₁₀ aryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående
 av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, C₁-C₄-alkoksykarbonyl,
 (C=O)NR¹¹R¹², CF₃, OCF₃, og CF₂CH₃; og
 C₃-C₆ cykloalkyl som kan inneholde umettethet, substituert med 0 til 3 grupper
 uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet
 heteroaryl, OH, okso, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₆-C₁₀ aryl, COOH, okso, C₁-C₄-
 alkoksykarbonyl, (C=O)NR¹¹R¹², og C₁-C₄ alkyl;

R¹¹ og R¹² er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av:

H,
 C₁-C₄ alkyl,
 halogen-C₁-C₄-alkyl,
 C₂-C₄ alkenyl,
 -(CR¹⁴R¹⁴)_n¹-fenyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen
 bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, 5-
 eller 6-leddet heteroaryl, OH, OCHF₂, di-C₁-C₄-alkylamino, og cyano,
 -(CHR¹³)_n¹-C₃-C₆-cykloalkyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra
 gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH,
 hydroksy-C₁-C₄-alkyl, og C₁-C₄ alkyl,

- 5 $-(\text{CHR}^{13})_{n^1-4}$ - til 10-leddet-heterocyklyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF_3 , OCF_3 , 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, okso, hydroksy- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alkyl, og $\text{C}_1\text{-C}_4$ alkyl,
 10 $-(\text{CHR}^{13})_{n^1-5}$ - til 10-leddet-heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF_3 , OCF_3 , 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, hydroksy- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alkyl, og $\text{C}_1\text{-C}_4$ alkyl,
 di- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alkylamino- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alkyl,
 di- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alkoksy- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alkyl,
 hydroksy- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alkyl,
 10 cyano- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alkyl, og
 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alkoksy
 $-\text{C}_1\text{-C}_4$ -alkyl;

 15 alternativt, R^{11} og R^{12} , når festet til det samme nitrogen, kombineres for å danne en 4- til 8-leddet heterocyklisk ring inneholdende karbonatomer substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF_3 , CHF_2 , OCF_3 , OCHF_2 , OCH_2F , 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, okso, hydroksy- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alkyl, $\text{C}_1\text{-C}_4$ alkyl og $\text{C}_1\text{-C}_4$ alkoksy, og 0 til 2 ytterligere heteroatomer valgt fra N, NR^{13} , O og $\text{S}(\text{O})_p$;
 20 R^{13} er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av H og $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl;
 R^{14} er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av H, $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl og $-(\text{CH}_2)_{n^1}$ fenyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, $\text{C}_1\text{-C}_4$ alkoksy, $\text{C}_1\text{-C}_4$ alkyl, cyklopropyl, CF_3 , OCF_3 ,
 25 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, OCHF_2 , di- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alkylamino, og cyano,
 R^7 er valgt fra gruppen bestående av H, halogen, $\text{C}_1\text{-C}_4$ alkyl, hydroksy- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alkyl og halogen- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener;
 R^{10} er valgt fra gruppen bestående av $\text{C}_1\text{-C}_4$ alkyl, halogen, og halogen- $\text{C}_1\text{-C}_2$ -alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener, hvor halogen er F eller Cl;
 30 n^1 , ved hver forekomst, er valgt fra 0, 1, 2 eller 3; og
 p, ved hver forekomst, er valgt fra 0, 1 og 2.

8. Forbindelsen som definert i krav 1, hvor:

- 35 W er O;
 R^0 er R^1 ;
 Y er S eller $-\text{CR}^8=\text{CR}^9-$;
 R^1 er uavhengig valgt fra gruppen bestående av:

H,
 C₁-C₄ alkyl,
 C₁-C₄ alkoksy,
 5 C₁-C₄ alkyltio, og
 halogen-C₁-C₂-alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener, hvor halogen er F eller
 Cl;

R⁸ og R⁹ er uavhengig valgt fra gruppen bestående av:

10 H,
 C₁-C₄ alkyl, og
 halogen-C₁-C₂ alkyl;

15 forutsatt at minst én av R¹, R⁸ og R⁹ er forskjellig fra H;

R² er H;

X¹ er valgt fra gruppen bestående av CH;

X², X³ og X⁴ er uavhengig valgt fra CR³;

R³ er valgt fra gruppen bestående av H, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ alkoksy, halogen,

20 halogen-C₁-C₃-alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener, og -(CH₂)_n¹-fenyl substituert
 med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-
 C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH,
 OCHF₂, di-C₁-C₄-alkylamino, og cyano;

R⁴ og R⁵ er uavhengig valgt fra H og C₁-C₆ alkyl;



er en 5-leddet heteroarylring som inneholder minst ett O-, N- eller S-atom;

R⁶ er valgt fra gruppen bestående av H, halogen, NR¹¹R¹², C₁-C₄ alkoksykarbonyl,

30 (C=O)NR¹¹R¹² og C₁-C₅ alkyl substituert med 0 til 7 grupper uavhengig valgt fra

halogen, CF₃, OCF₃, OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkoksy-C₁-
 C₄ alkoksy, di-C₁-C₄-alkylaminofenyl-C₁-C₄-alkyl, (di-C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl)-C₁-
 C₄-alkyl, di-C₁-C₄-alkylamino, C₃-C₆-cykloalkyl, og C₁-C₄ alkyltio, eller

R⁶ er B-D-, hvor D er en linker, som er valgt fra:

35 en enkeltbinding,
 -O-,



og

- 5 C₁-C₄ alkylen substituert med 0 til 4 grupper uavhengig valgt fra halogen eller OH;

B er valgt fra gruppen bestående av:

- 10 C₆-C₁₀ aryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, halogen-C₁-C₄alkoksy, C₁-C₄ alkyl, halogen-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl, cyano, nitro, NR¹¹R¹², OH, C₁-C₄-alkylkarbonyloksy-C₁-C₄-alkyl, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, COOR¹⁴, SO₂R¹⁴, (C=O)NR¹¹R¹², SO₂NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)OR¹⁴,
 15 N(R¹³)(C=O)R¹⁴, NR¹³S(O)R¹⁴, NR¹³SO₂R¹⁴, O(C=O)NR¹¹R¹², O(C=O)OR¹⁴, O(C=O)R¹⁴, (C=O)OR¹⁴, og 5-6-leddet heteroaryl,
 5- til 10-leddet heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄alkoksy, halogen-C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, halogen-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆cykloalkyl, cyano, nitro, NR¹¹R¹², OH, C₁-C₄-alkylkarbonyloksy-C₁-C₄-alkyl, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, COOR¹⁴, SO₂R¹⁴, (C=O)NR¹¹R¹², SO₂NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)OR¹⁴, N(R¹³)(C=O)R¹⁴, NR¹³S(O)R¹⁴, NR¹³SO₂R¹⁴, O(C=O)NR¹¹R¹², O(C=O)OR¹⁴, O(C=O)R¹⁴, (C=O)OR¹⁴, 5-6-leddet heteroaryl, og (CH₂)fenyl,
 20 4- til 10-leddet heterocyklyl inneholdende karbonatomer og 1 til 2 ytterligere
 25 heteroatomer valgt fra N, O, og S, og substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, okso, -(CHR¹³)_n¹⁻⁵⁻ eller 6-leddet heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, og CF₂CH₃; NR¹³S(O)R¹⁴, NR¹³SO₂R¹⁴, -(CHR¹³)_n¹⁻⁴⁻ til 10-leddet-heterocyklyl
 30 substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, og CF₂CH₃; OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄ alkoksy, halogen-C₁-C₄ alkoksy, di-C₁-C₄-alkylamino-C₁-C₄-alkyl, NR₁₁R₁₂, cyano, C₁-C₄ alkyl, halogen-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl, C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl-C₁-C₄-alkylkarbonyl,
 35 C₆-C₁₀ arylkarbonyl, C₁-C₄-alkylkarbonyloksy-C₁-C₄-alkyl, COOR¹⁴, SO₂R¹⁴, (C=O)NR¹¹R¹², SO₂NR¹¹R¹², N(R³)(C=O)NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)OR¹⁴, N(R¹³)(C=O)R¹⁴, O(C=O)NR¹¹R¹², O(C=O)OR¹⁴, O(C=O)R¹⁴, (C=O)OR¹⁴, og C₆-

C₁₀ aryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, C₁-C₄-alkoksykarbonyl, (C=O)NR¹¹R¹², CF₃, OCF₃, og CF₂CH₃; og

C₃-C₆ cykloalkyl som kan inneholde umettethet, substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, okso, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₆-C₁₀ aryl, COOH, okso, C₁-C₄-alkoksykarbonyl, (C=O)NR¹¹R¹², og C₁-C₄ alkyl;

R¹¹ og R¹² er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av:

H,

C₁-C₄ alkyl,

halogen-C₁-C₄-alkyl,

C₂-C₄ alkenyl,

-(CR¹⁴R¹⁴)_n¹-fenyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, OCHF₂, di-C₁-C₄-alkylamino, og cyano,

-(CHR¹³)_n¹-C₃-C₆-cykloalkyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH,

hydroksy-C₁-C₄-alkyl, og C₁-C₄ alkyl,

-(CHR¹³)_n¹-4- til 10-leddet-heterocyklyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, okso, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, og C₁-C₄ alkyl,

-(CHR¹³)_n¹-5- til 10-leddet-heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, og C₁-C₄ alkyl,

di-C₁-C₄-alkylamino-C₁-C₄-alkyl,

hydroksy-C₁-C₄-alkyl, og

cyano-C₁-C₄-alkyl;

alternativt, R¹¹ og R¹², når festet til det samme nitrogen, kombineres for å danne en 4- til 8-leddet heterocyklisk ring inneholdende karbonatomer substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, CHF₂, OCF₃, OCHF₂, OCH₂F, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, okso, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄ alkyl og C₁-C₄ alkoksy, og 0 til 2 ytterligere heteroatomer valgt fra N, NR¹³, O og S(O)_p;

R¹³ er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av H og C₁-C₆ alkyl;

R^{14} er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av H, C₁-C₆ alkyl og $-(CH_2)_n$ fenyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, OCHF₂, di-C₁-C₄-alkylamino, og cyano,
 5 R^7 er valgt fra gruppen bestående av H, halogen, C₁-C₄ alkyl, hydroksy-C₁-C₄-alkyl og halogen-C₁-C₄-alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener;
 n^1 , ved hver forekomst, er valgt fra 0, 1, 2 eller 3; og
 p , ved hver forekomst, er valgt fra 0, 1 og 2.

10 **9.** Forbindelsen som definert i krav 1, hvor:

W er O;

R^0 er R^1 ;

Y er S eller $-CR^8=CR^9-$;

15 R^1 er uavhengig valgt fra gruppen bestående av:

H,

C₁-C₄ alkoksy,

C₁-C₄ alkyltio, og

20 halogen-C₁-C₂-alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener, hvor halogen er F eller Cl;

R^8 og R^9 er uavhengig valgt fra gruppen bestående av:

25 H,

C₁-C₄ alkyl, og

halogen-C₁-C₂ alkyl;

forutsatt at minst én av R^1 , R^8 og R^9 er forskjellig fra H;

30 R^2 er H;

X^1 er valgt fra gruppen bestående av CH;

X^2 , X^3 og X^4 er uavhengig valgt fra CR³;

R^3 er valgt fra gruppen bestående av H, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄alkoksy, halogen og halogen-C₁-C₃-alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener;

35 R^4 og R^5 er uavhengig valgt fra H og C₁-C₆ alkyl;



er en 5-leddet heteroarylring som inneholder minst ett O-, N- eller S-atom;

R⁶ er valgt fra gruppen bestående av H, halogen, NR¹¹R¹², C₁-C₄ alkoksykarbonyl og C₁-C₅ alkyl substituert med 0 til 7 grupper uavhengig valgt fra halogen, CF₃, OCF₃, OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkoksy-C₁-C₄ alkoksy, di-C₁-C₄-alkylaminofenyl-C₁-C₄-alkyl, (di-C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl)-C₁-C₄-alkyl, di-C₁-C₄-alkylamino, C₃-C₆-cykloalkyl, og C₁-C₄alkyltio, eller

R⁶ er B-D-, hvor D er en linker, som er valgt fra:

en enkeltbinding,

-O-,



og

C₁-C₄ alkylen substituert med 0 til 4 grupper uavhengig valgt fra halogen eller OH;

B er valgt fra gruppen bestående av:

C₆-C₁₀ aryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, halogen-C₁-C₄alkoksy, C₁-C₄ alkyl, halogen-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl, cyano, nitro, NR¹¹R¹², OH, C₁-C₄-alkylkarbonyloksy-C₁-C₄-alkyl, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, COOR¹⁴, SO₂R¹⁴, (C=O)NR¹¹R¹², SO₂NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)OR¹⁴, N(R¹³)(C=O)R¹⁴, NR¹³S(O)R¹⁴, NR¹³SO₂R¹⁴, O(C=O)NR¹¹R¹², O(C=O)OR¹⁴, O(C=O)R¹⁴, (C=O)OR¹⁴, og 5-6-leddet heteroaryl,

5- til 10-leddet heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, halogen-C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, halogen-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl, cyano, nitro, NR¹¹R¹², OH, C₁-C₄-alkylkarbonyloksy-C₁-C₄-alkyl, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, COOR¹⁴, SO₂R¹⁴, (C=O)NR¹¹R¹², SO₂NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)OR¹⁴, N(R¹³)(C=O)R¹⁴, NR¹³S(O)R¹⁴, NR¹³SO₂R¹⁴, O(C=O)NR¹¹R¹², O(C=O)OR¹⁴, O(C=O)R¹⁴, (C=O)OR¹⁴, 5-6-leddet heteroaryl, og (CH₂)fenyl,

4- til 10-leddet heterocyklyl inneholdende karbonatomer og 1 til 2 ytterligere heteroatomer valgt fra N, O, og S, og substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, okso, $-(CHR^{13})_n^{1-5}$ - eller 6-leddet heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen

5 bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, og CF₂CH₃; NR¹³S(O)R¹⁴, NR¹³SO₂R¹⁴, $-(CHR^{13})_n^{1-4}$ - til 10-leddet-heterocyklyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, og CF₂CH₃; OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄ alkoksy, halogen-C₁-C₄ alkoksy, di-C₁-C₄-

10 alkylamino-C₁-C₄-alkyl, NR₁₁R₁₂, cyano, C₁-C₄ alkyl, halogen-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl, C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl-C₁-C₄-alkylkarbonyl, C₆-C₁₀ arylkarbonyl, C₁-C₄-alkylkarbonyloksy-C₁-C₄-alkyl, COOR¹⁴, SO₂R¹⁴, (C=O)NR¹¹R¹², SO₂NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)OR¹⁴, N(R¹³)(C=O)R¹⁴, O(C=O)NR¹¹R¹², O(C=O)OR¹⁴, O(C=O)R¹⁴, (C=O)OR¹⁴, og C₆-

15 C₁₀ aryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, C₁-C₄-alkoksykarbonyl, (C=O)NR¹¹R¹², CF₃, OCF₃, og CF₂CH₃; og C₃-C₆ cykloalkyl som kan inneholde umettethet, substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, okso, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₆-C₁₀ aryl, COOH, okso, C₁-C₄-alkoksykarbonyl, (C=O)NR¹¹R¹², og C₁-C₄ alkyl;

20

R¹¹ og R¹² er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av:

25 H,
C₁-C₄ alkyl,
halogen-C₁-C₄-alkyl,
 $-(CR^{14}R^{14})_n^{1-}$ -fenyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, OCHF₂, di-C₁-C₄-alkylamino, og cyano,

30 $-(CHR^{13})_n^{1-}$ C₃-C₆-cykloalkyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, og C₁-C₄ alkyl,
 $-(CHR^{13})_n^{1-4}$ - til 10-leddet-heterocyklyl substituert med 0 til 3 grupper

35 uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, okso, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, og C₁-C₄ alkyl,

-(CHR¹³)_n¹-5- til 10-leddet-heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, og C₁-C₄ alkyl, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, og cyano-C₁-C₄-alkyl;

5

alternativt, R¹¹ og R¹², når festet til det samme nitrogen, kombineres for å danne en 4- til 8-leddet heterocyklisk ring inneholdende karbonatomer substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, CHF₂, OCF₃, OCHF₂, OCH₂F, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, okso, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄ alkyl og C₁-C₄ alkoksy;

10

R¹³ er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av H og C₁-C₆ alkyl;

R¹⁴ er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av H, C₁-C₆ alkyl og -(CH₂)_n¹fenyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra

15

gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, OCHF₂, di-C₁-C₄-alkylamino, og cyano,

R⁷ er valgt fra gruppen bestående av H, halogen, C₁-C₄ alkyl og halogen-C₁-C₄-alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener; og

n¹, ved hver forekomst, er valgt fra 0, 1 eller 2.

20

10. Forbindelsen som definert i krav 1 hvor:

W er O eller S;

R⁰ er R¹;

25

Y er S eller -CR⁸=CR⁹-;

R¹ er uavhengig valgt fra gruppen bestående av:

H,

halogen,

30

C₁-C₄ alkyl,

C₂-C₃ alkenyl,

C₂-C₃ alkynyl,

C₃-C₄ cykloalkyl,

C₁-C₄ alkoksy,

35

C₁-C₂ alkoksy-C₁-C₂ alkyl,

tetrahydrofuran-2-yl;

C₁-C₄ alkyltio,

halogen-C₁-C₂-alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener, hvor halogen er F eller Cl,
 halogen-C₃-C₄ cykloalkyl,
 halogen-C₁-C₂ alkoksy, og
 halogen-C₁-C₂ alkyltio;

R⁸ og R⁹ er uavhengig valgt fra gruppen bestående av:

H,
 halogen,
 C₁-C₄ alkyl,
 C₁-C₄ alkoksy,
 halogen-C₁-C₂ alkyl, og
 halogen-C₁-C₂ alkoksy;

forutsatt at minst én av R¹, R⁸ og R⁹ er forskjellig fra H;
 R² er valgt fra gruppen bestående av:

H,
 halogen,
 C₁-C₃ alkyl, og
 C₁-C₂ alkoksy;

X¹ er valgt fra gruppen bestående av CH, N eller CR¹⁰;

X², X³ og X⁴ er uavhengig valgt fra CR³ eller N;

R³ er valgt fra gruppen bestående av H, C₁-C₄ alkyl, C₂-C₄alkenyl, C₂-C₄ alkynyl, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyltio, halogen, OH, CN, OCF₃, C₁-C₂-alkoksy-C₁-C₂-alkoksy, halogen-C₁-C₃-alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener, benzyloksy substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, OCHF₂, di-C₁-C₄-alkylamino, og cyano, og -(CH₂)_n¹-fenyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, OCHF₂, di-C₁-C₄-alkylamino, og cyano;

R⁴ og R⁵ er uavhengig valgt fra H og C₁-C₆ alkyl, eller R⁴ og R⁵ kan tas sammen med karbonet som de er bundet til, for å danne en C₃-C₇ cykloalkylring;



er en 5-leddet heteroarylring som inneholder minst ett O-, N- eller S-atom;

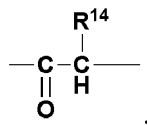
R^6 er valgt fra gruppen bestående av H, halogen, OCF_3 , $OCHF_2$, OH, CN, NO_2 , $NR^{11}R^{12}$, COOH, C_1 - C_4 alkoksykarbonyl, $(C=O)NR^{11}R^{12}$, C_1 - C_4 alkylsulfonyl, og C_1 - C_5 alkyl substituert med 0 til 7 grupper uavhengig valgt fra halogen, CF_3 , OCF_3 , OH, hydroksy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 alkoksy, C_1 - C_4 alkoksy- C_1 - C_4 alkoksy, di- C_1 - C_4 -alkylaminofenyl- C_1 - C_4 -alkyl, (di- C_1 - C_4 -alkoksy- C_1 - C_4 -alkyl)- C_1 - C_4 -alkyl, di- C_1 - C_4 -alkylamino, C_3 - C_6 -cykloalkyl, og C_1 - C_4 alkyltio, eller

R^6 er B-D-, hvor D er en linker, som er valgt fra:

en enkeltbinding,

-O-,

-S-,



C_1 - C_4 alkylen substituert med 0 til 4 grupper uavhengig valgt fra halogen eller OH,

C_1 - C_4 alkylenoksy,

C_1 - C_4 alkylentio,

C_1 - C_4 alkylenoksy- C_1 - C_4 -alkylen,

C_1 - C_4 -alkylentio- C_1 - C_4 -alkylen,

C_2 - C_6 alkenylen, og

B er valgt fra gruppen bestående av:

C_6 - C_{10} aryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C_1 - C_4 alkoksy, halogen- C_1 - C_4 alkoksy, C_1 - C_4 alkyl, halogen- C_1 - C_4 alkyl, C_3 - C_6 cykloalkyl, cyano, nitro, $NR^{11}R^{12}$, OH, C_1 - C_4 -alkylkarbonyloksy- C_1 - C_4 -alkyl, hydroksy- C_1 - C_4 -alkyl, $COOR^{14}$, SO_2R^{14} ,

$(C=O)NR^{11}R^{12}$, $SO_2NR^{11}R^{12}$, $N(R^{13})(C=O)NR^{11}R^{12}$, $N(R^{13})(C=O)OR^{14}$,
 $N(R^{13})(C=O)R^{14}$, $NR^{13}S(O)R^{14}$, $NR^{13}SO_2R^{14}$, $O(C=O)NR^{11}R^{12}$, $O(C=O)OR^{14}$,
 $O(C=O)R^{14}$, $(C=O)OR^{14}$, og 5-6-leddet heteroaryl,
5- til 10-leddet heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra
5 gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, halogen-C₁-C₄ alkoksy, C₁-
C₄ alkyl, halogen-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆cykloalkyl, cyano, nitro, $NR^{11}R^{12}$, OH, C₁-C₄-
alkylkarbonyloksy-C₁-C₄-alkyl, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, $COOR^{14}$, SO_2R^{14} ,
 $(C=O)NR^{11}R^{12}$, $SO_2NR^{11}R^{12}$, $N(R^{13})(C=O)NR^{11}R^{12}$, $N(R^{13})(C=O)OR^{14}$,
 $N(R^{13})(C=O)R^{14}$, $NR^{13}S(O)R^{14}$, $NR^{13}SO_2R^{14}$, $O(C=O)NR^{11}R^{12}$, $O(C=O)OR^{14}$,
10 $O(C=O)R^{14}$, $(C=O)OR^{14}$, 5-6-leddet heteroaryl, og (CH₂)fenyl,
4- til 10-leddet heterocyklil inneholdende karbonatomer og 1 til 2 ytterligere
heteroatomer valgt fra N, O, og S, og substituert med 0 til 3 grupper uavhengig
valgt fra gruppen bestående av halogen, okso, $-(CHR^{13})_{n^{1-5}}$ - eller 6-leddet
heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen
15 bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, og
CF₂CH₃; $NR^{13}S(O)R^{14}$, $NR^{13}SO_2R^{14}$, $-(CHR^{13})_{n^{1-4}}$ - til 10-leddet-heterocyklil
substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av
halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, og CF₂CH₃; OH,
hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄ alkoksy, halogen-C₁-C₄ alkoksy, di-C₁-C₄-
20 alkylamino-C₁-C₄-alkyl, $NR^{11}R^{12}$, cyano, C₁-C₄ alkyl, halogen-C₁-C₄ alkyl, C₃-
C₆ cykloalkyl, C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl-C₁-C₄-alkylkarbonyl,
C₆-C₁₀arylkarbonyl, C₁-C₄-alkylkarbonyloksy-C₁-C₄-alkyl, $COOR^{14}$,
 SO_2R^{14} , $(C=O)NR^{11}R^{12}$, $SO_2NR^{11}R^{12}$, $N(R^{13})(C=O)NR^{11}R^{12}$, $N(R^{13})(C=O)OR^{14}$,
 $N(R^{13})(C=O)R^{14}$, $O(C=O)NR^{11}R^{12}$, $O(C=O)OR^{14}$, $O(C=O)R^{14}$, $(C=O)OR^{14}$, og C₆-
25 C₁₀ aryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående
av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, C₁-C₄-alkoksykarbonyl,
 $(C=O)NR^{11}R^{12}$, CF₃, OCF₃, og CF₂CH₃;
C₃-C₆ cykloalkyl som kan inneholde umettethet, substituert med 0 til 3 grupper
uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet
30 heteroaryl, OH, okso, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₆-C₁₀ aryl, COOH, okso, C₁-C₄-
alkoksykarbonyl, $(C=O)NR^{11}R^{12}$, og C₁-C₄ alkyl; og
C₅-C₁₁ spirocykloalkyl som kan inneholde umettethet og eventuelt inneholdende
1 til 3 heteroatomer valgt fra O, N eller S og substituert med 0 til 3 grupper
uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet
35 heteroaryl, OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₆-C₁₀ aryl, og C₁-C₄ alkyl;

R¹¹ og R¹² er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av:

- H,
 C₁-C₄ alkyl,
 halogen-C₁-C₄-alkyl,
 C₂-C₄ alkenyl,
 5 C₂-C₄ alkynyl,
 -(CR¹⁴R¹⁴)_n¹-fenyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen
 bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, 5-
 eller 6-leddet heteroaryl, OH, OCHF₂, di-C₁-C₄-alkylamino, og cyano,
 -(CHR¹³)_n¹-C₃-C₆-cykloalkyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra
 10 gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH,
 hydroksy-C₁-C₄-alkyl, og C₁-C₄ alkyl,
 -(CHR¹³)_n¹-4- til 10-leddet-heterocyklyl substituert med 0 til 3 grupper
 uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet
 heteroaryl, OH, okso, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, og C₁-C₄ alkyl,
 15 -(CHR¹³)_n¹-5- til 10-leddet-heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig
 valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet
 heteroaryl, OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, og C₁-C₄ alkyl,
 di-C₁-C₄-alkylamino-C₁-C₄-alkyl,
 di-C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl,
 20 hydroksy-C₁-C₄-alkyl,
 cyano-C₁-C₄-alkyl,
 C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl,
 C₁-C₄-alkoksykarbonyl-C₁-C₄-alkyl,
 C₁-C₄-alkoksykarbonyl,
 25 C₁-C₄-alkylkarbonyl,
 fenylkarbonyl;
 C₁-C₄-alkoksykarbonylamino-C₁-C₄-alkylkarbonyl,
 di-C₁-C₄-alkylamino-C₁-C₄-alkylkarbonyl,
 amino-C₁-C₄-alkylkarbonyl,
 30 4- til 10-leddet-heterocyklyl-karbonyl, og

alternativt, R¹¹ og R¹², når festet til det samme nitrogen, kombineres for å danne
 en 4- til 8-leddet heterocyklisk ring inneholdende karbonatomer substituert med 0
 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, CHF₂, OCF₃,
 35 OCHF₂, OCH₂F, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, okso, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-
 C₄ alkyl og C₁-C₄ alkoksy, og 0 til 2 ytterligere heteroatomer valgt fra N, NR¹³, O og
 S(O)_p;

R^{13} er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av H, C_1 - C_6 alkyl og $-(CH_2)fenyl$;

R^{14} er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av H, C_1 - C_6 alkyl, halogen- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkoksykarbonylamino, (C_6 - C_{10} arylkarbonylamino), (a 5- til 10-leddet heteroarylkarbonylamino) og $-(CH_2)_{n^1}fenyl$ substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C_1 - C_4 alkoksy, C_1 - C_4 alkyl, cyklopropyl, CF_3 , OCF_3 , 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, $OCHF_2$, di- C_1 - C_4 -alkylamino, og cyano,

R^7 er valgt fra gruppen bestående av H, halogen, hydroksyl, okso, C_1 - C_4 alkyl, hydroksy- C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkoksy- C_1 - C_4 -alkyl, halogen- C_1 - C_4 -alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener, C_1 - C_4 -alkoksy, og halogen- C_1 - C_4 -alkoksy;

R^{10} er valgt fra gruppen bestående av C_1 - C_4 alkyl, halogen, C_1 - C_4 alkoksy, og halogen- C_1 - C_2 -alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener, hvor halogen er F eller Cl; n^1 , ved hver forekomst, er valgt fra 0, 1, 2, 3, 4 eller 5; og

p, ved hver forekomst, er valgt fra 0, 1 og 2.

11. Forbindelsen som definert i krav 1, hvor:

W er O eller S;

R^0 er R^1 ;

Y er S eller $-CR^8=CR^9-$;

R^1 er uavhengig valgt fra gruppen bestående av:

H,

halogen,

C_1 - C_4 alkyl,

C_2 - C_3 alkenyl,

C_2 - C_3 alkynyl,

C_3 - C_4 cykloalkyl,

C_1 - C_4 alkoksy,

C_1 - C_4 alkyltio,

halogen- C_1 - C_2 -alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener, hvor halogen er F eller Cl,

halogen- C_3 - C_4 cykloalkyl,

halogen- C_1 - C_2 alkoksy, og

halogen- C_1 - C_2 alkyltio;

R^8 og R^9 er uavhengig valgt fra gruppen bestående av:

H,
 halogen,
 C₁-C₄ alkyl,
 C₁-C₄ alkoksy,
 halogen-C₁-C₂ alkyl, og
 halogen-C₁-C₂ alkoksy;

forutsatt at minst én av R¹, R⁸ og R⁹ er forskjellig fra H;
 R² er valgt fra gruppen bestående av:

H,
 fluor,
 klor, og
 CH₃;

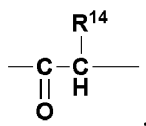
X¹ er valgt fra gruppen bestående av CH, N eller CR¹⁰;
 X², X³ og X⁴ er uavhengig valgt fra CR³ eller N;
 R³ er valgt fra gruppen bestående av H, C₁-C₃ alkyl, C₂-C₃alkenyl, C₂-C₃ alkynyl, C₁-C₃ alkoksy, C₁-C₃ alkyltio, halogen, OH, CN, OCF₃, og halogen-C₁-C₃-alkyl, som inneholder 1 til 5 halogener;
 R⁴ og R⁵ er uavhengig valgt fra H og C₁-C₃ alkyl, eller R⁴ og R⁵ kan tas sammen med karbonet som de er bundet til, for å danne en cyklopropylring;



er en 5-leddet heteroarylring som inneholder minst ett O-, N- eller S-atom;
 R⁶ er valgt fra gruppen bestående av H, halogen, OCF₃, OCHF₂, OH, CN, NO₂, NR¹¹R¹², COOH, C₁-C₄ alkoksykarbonyl, (C=O)NR¹¹R¹² og C₁-C₅ alkyl substituert med 0 til 7 grupper uavhengig valgt fra halogen, CF₃, OCF₃, OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkoksy-C₁-C₄ alkoksy, di-C₁-C₄-alkylaminofenyl-C₁-C₄-alkyl, (di-C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl)-C₁-C₄-alkyl, di-C₁-C₄-alkylamino, C₃-C₆-cykloalkyl, og C₁-C₄alkyltio, eller
 R⁶ er B-D-, hvor D er en linker, som er valgt fra:

en enkeltbinding,
 -O-,

-S-,



5

C₁-C₄ alkylen substituert med 0 til 4 grupper uavhengig valgt fra halogen eller OH,

C₁-C₄ alkylenoksy,

10

C₁-C₄ alkylentio,

C₂-C₆ alkenylen, og

B er valgt fra gruppen bestående av:

15

C₆-C₁₀ aryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, halogen-C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, halogen-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl, cyano, nitro, NR¹¹R¹², OH, C₁-C₄-alkylkarbonyloksy-C₁-C₄-alkyl, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, COOR¹⁴, SO₂R¹⁴, (C=O)NR¹¹R¹², SO₂NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)OR¹⁴, N(R¹³)(C=O)R¹⁴, NR¹³S(O)R¹⁴, NR¹³SO₂R¹⁴, O(C=O)NR¹¹R¹², O(C=O)OR¹⁴, O(C=O)R¹⁴, (C=O)OR¹⁴, og 5-6-leddet heteroaryl,

20

5- til 10-leddet heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄alkoksy, halogen-C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, halogen-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl, cyano, nitro, NR¹¹R¹², OH, C₁-C₄-alkylkarbonyloksy-C₁-C₄-alkyl, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, COOR¹⁴, SO₂R¹⁴, (C=O)NR¹¹R¹², SO₂NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)OR¹⁴, N(R¹³)(C=O)R¹⁴, NR¹³S(O)R¹⁴, NR¹³SO₂R¹⁴, O(C=O)NR¹¹R¹², O(C=O)OR¹⁴, O(C=O)R¹⁴, (C=O)OR¹⁴, 5-6-leddet heteroaryl, og (CH₂)fenyl,

25

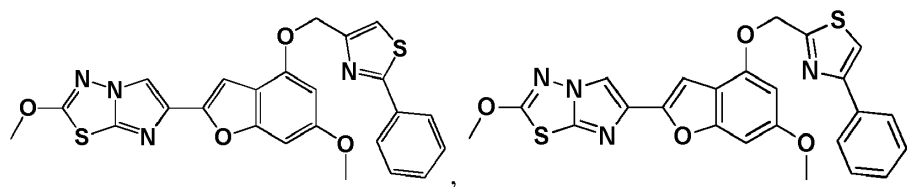
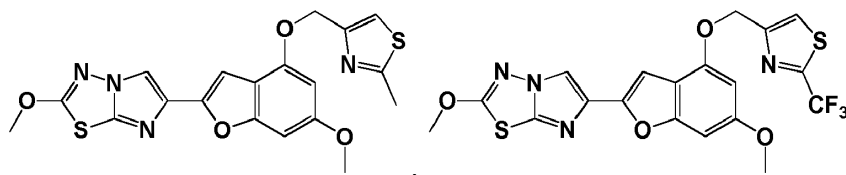
4- til 10-leddet heterocyklyl inneholdende karbonatomer og 1 til 2 ytterligere heteroatomer valgt fra N, O, og S, og substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, okso, -(CHR¹³)_n¹⁻⁵⁻ eller 6-leddet heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, og CF₂CH₃; NR¹³S(O)R¹⁴, NR¹³SO₂R¹⁴, -(CHR¹³)_n¹⁻⁴⁻ til 10-leddet-heterocyklyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av

30

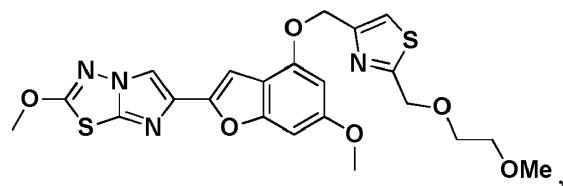
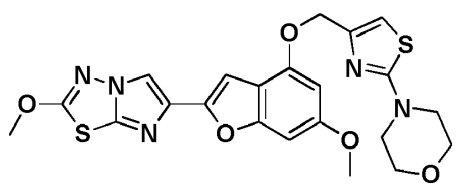
35

- halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, og CF₂CH₃; OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄ alkoksy, halogen-C₁-C₄ alkoksy, di-C₁-C₄-alkylamino-C₁-C₄-alkyl, NR₁₁R₁₂, cyano, C₁-C₄ alkyl, halogen-C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl, C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆ cykloalkyl-C₁-C₄-alkylkarbonyl, C₆-C₁₀ arylkarbonyl, C₁-C₄-alkylkarbonyloksy-C₁-C₄-alkyl, COOR¹⁴, SO₂R¹⁴, (C=O)NR¹¹R¹², SO₂NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)NR¹¹R¹², N(R¹³)(C=O)OR¹⁴, N(R¹³)(C=O)R¹⁴, O(C=O)NR¹¹R¹², O(C=O)OR¹⁴, O(C=O)R¹⁴, (C=O)OR¹⁴, og C₆-C₁₀ aryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄ alkyl, cyklopropyl, C₁-C₄-alkoksykarbonyl, (C=O)NR¹¹R¹², CF₃, OCF₃, og CF₂CH₃;
- C₃-C₆ cykloalkyl som kan inneholde umettethet, substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, okso, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₆-C₁₀ aryl, COOH, okso, C₁-C₄-alkoksykarbonyl, (C=O)NR¹¹R¹², og C₁-C₄ alkyl; og
- C₅-C₁₁ spirocykloalkyl som kan inneholde umettethet og eventuelt inneholdende 1 til 3 heteroatomer valgt fra O, N eller S og substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₆-C₁₀ aryl, og C₁-C₄ alkyl;
- R¹¹ og R¹² er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av:
- H,
- C₁-C₄ alkyl,
- halogen-C₁-C₄-alkyl,
- C₂-C₄ alkenyl,
- (CR¹⁴R¹⁴)_n¹-fenyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, OCHF₂, di-C₁-C₄-alkylamino, og cyano,
- (CHR¹³)_n¹-C₃-C₆-cykloalkyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, og C₁-C₄ alkyl,
- (CHR¹³)_n¹-4- til 10-leddet-heterocyklyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, okso, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, og C₁-C₄ alkyl,
- (CHR¹³)_n¹-5- til 10-leddet-heteroaryl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, og C₁-C₄ alkyl,
- di-C₁-C₄-alkylamino-C₁-C₄-alkyl,

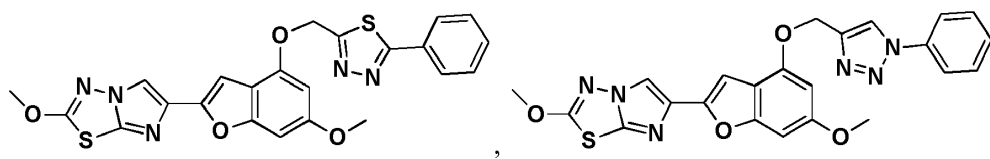
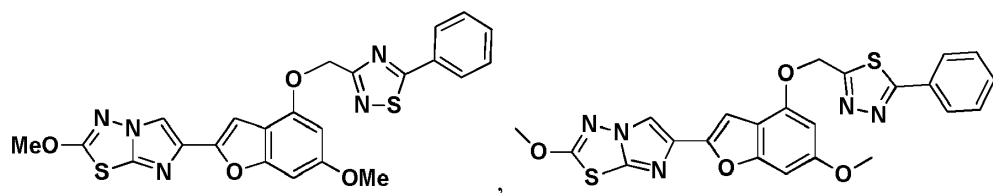
- di-C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl,
 hydroksy-C₁-C₄-alkyl,
 cyano-C₁-C₄-alkyl,
 C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl,
 5 C₁-C₄-alkoksykarbonyl-C₁-C₄-alkyl,
 C₁-C₄-alkoksykarbonyl,
 C₁-C₄-alkylkarbonyl,
 fenylkarbonyl;
 C₁-C₄-alkoksykarbonylamino-C₁-C₄-alkylkarbonyl,
 10 di-C₁-C₄-alkylamino-C₁-C₄-alkylkarbonyl,
 amino-C₁-C₄-alkylkarbonyl,
 4- til 10-leddet-heterocyklyl-karbonyl, og
- alternativt, R¹¹ og R¹², når festet til det samme nitrogen, kombineres for å danne
 15 en 4- til 8-leddet heterocyklisk ring inneholdende karbonatomer substituert med 0
 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CF₃, CHF₂, OCF₃,
 OCHF₂, OCH₂F, 5- eller 6-leddet heteroaryl, OH, okso, hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-
 C₄ alkyl og C₁-C₄ alkoksy, og 0 til 2 ytterligere heteroatomer valgt fra N, NR¹³, O og
 S(O)_p;
- 20 R¹³ er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av H, C₁-
 C₆ alkyl og -(CH₂)fenyl;
 R¹⁴ er uavhengig, ved hver forekomst, valgt fra gruppen bestående av H, C₁-
 C₆ alkyl, halogen-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoksykarbonylamino, (C₆-C₁₀ arylkarbonyl-
 amino) og -(CH₂)_n¹fenyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen
 25 bestående av halogen, C₁-C₄ alkoksy, C₁-C₄alkyl, cyklopropyl, CF₃, OCF₃, 5- eller 6-
 leddet heteroaryl, OH, OCHF₂, di-C₁-C₄-alkylamino, og cyano,
 R⁷ er valgt fra gruppen bestående av H, halogen, hydroksyl, okso, C₁-C₄ alkyl,
 hydroksy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoksy-C₁-C₄-alkyl, halogen-C₁-C₄-alkyl, som
 inneholder 1 til 5 halogener, og C₁-C₄-alkoksy;
- 30 R¹⁰ er valgt fra gruppen bestående av C₁-C₄ alkyl, halogen, og halogen-C₁-C₂-alkyl,
 som inneholder 1 til 5 halogener, hvor halogen er F eller Cl;
 n¹, ved hver forekomst, er valgt fra 0, 1, 2, 3 eller 4; og
 p, ved hver forekomst, er valgt fra 0, 1 og 2.
- 35 **12.** Forbindelsen som definert i hvilke som helst av kravene 1 til 11, hvor forbindelsen er
 valgt fra de følgende:



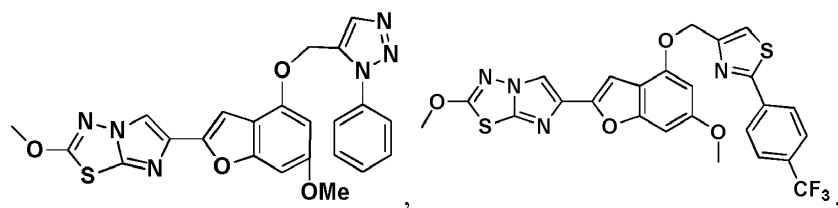
5

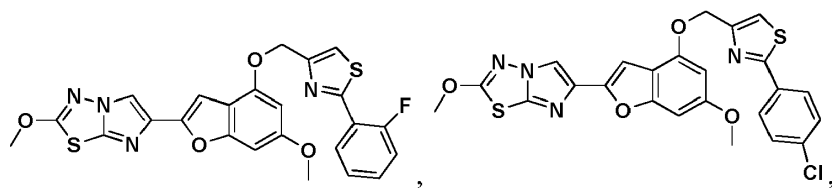


10

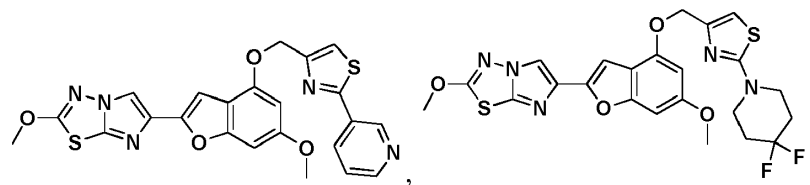
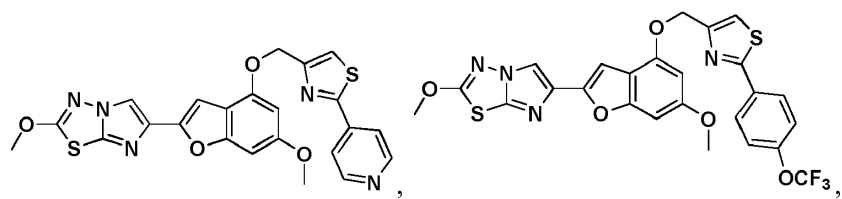


15

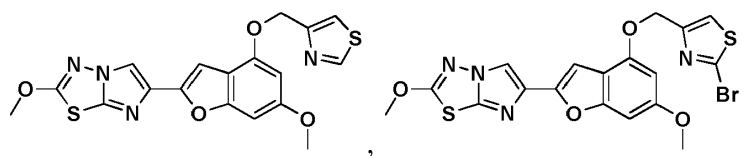
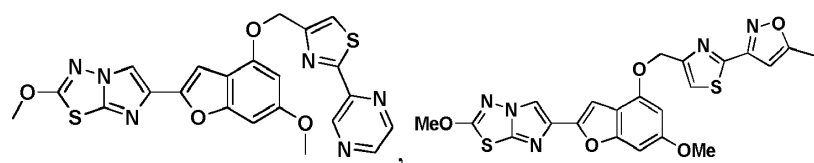




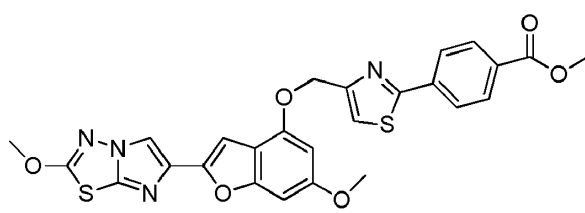
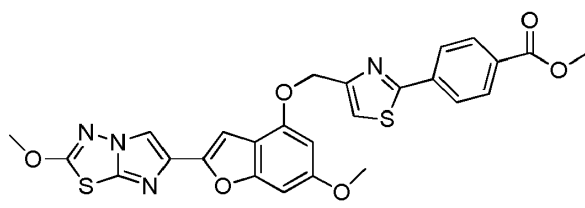
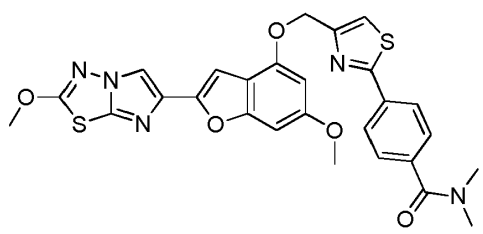
15



5

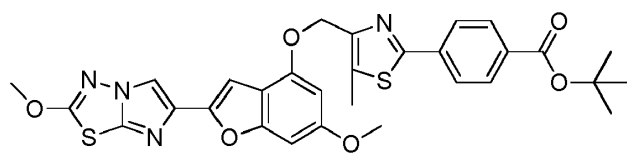
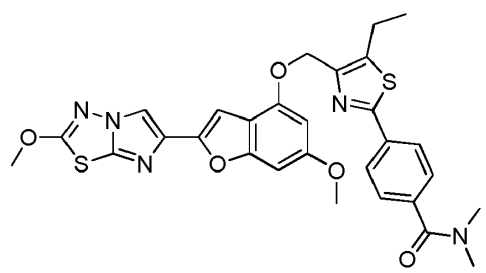
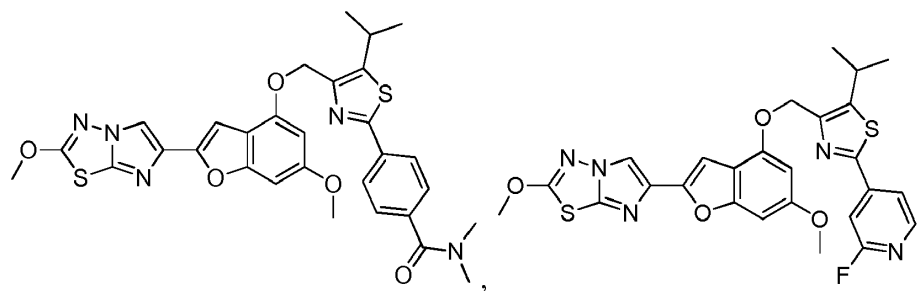
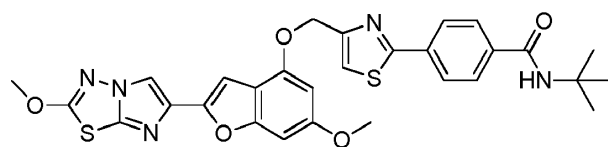
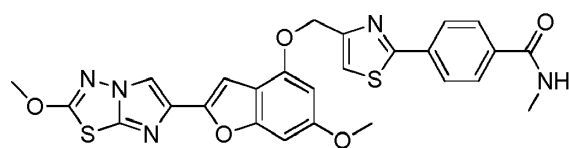
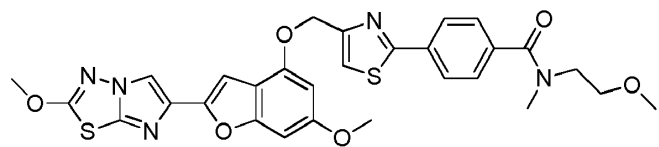
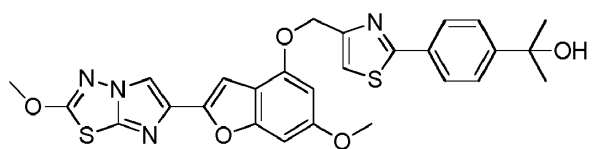


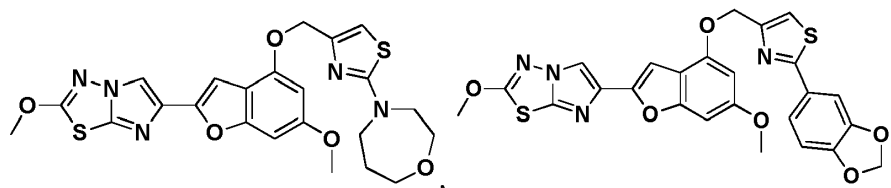
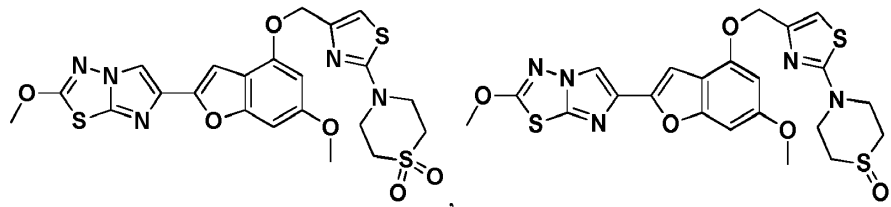
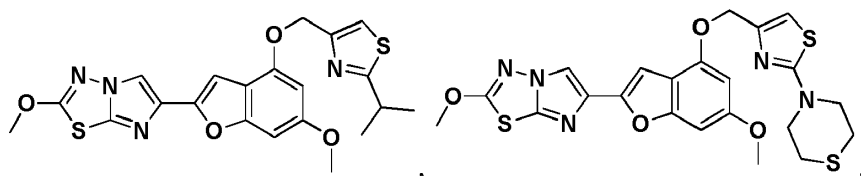
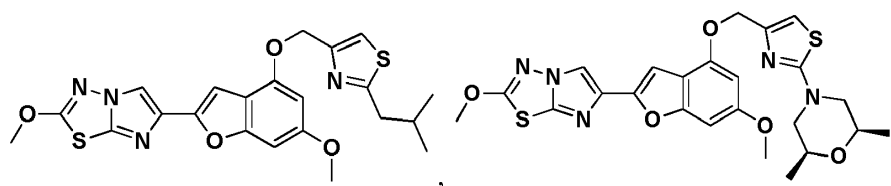
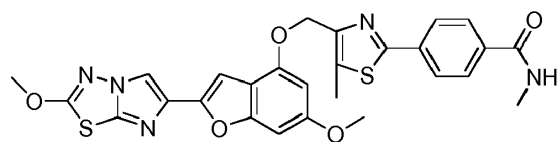
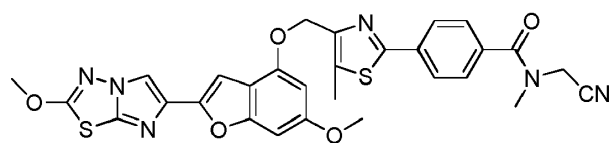
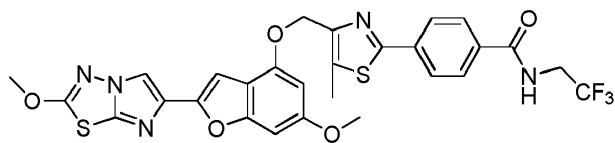
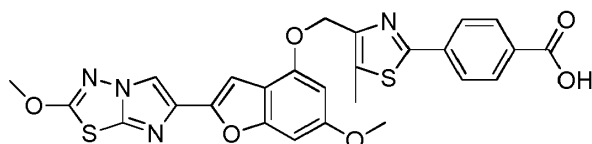
10

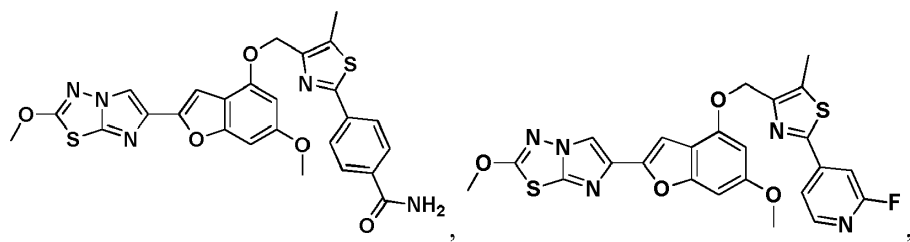
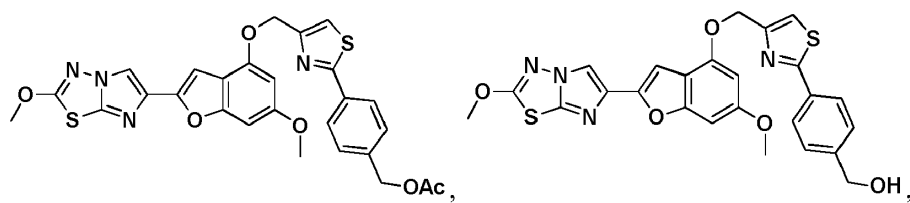
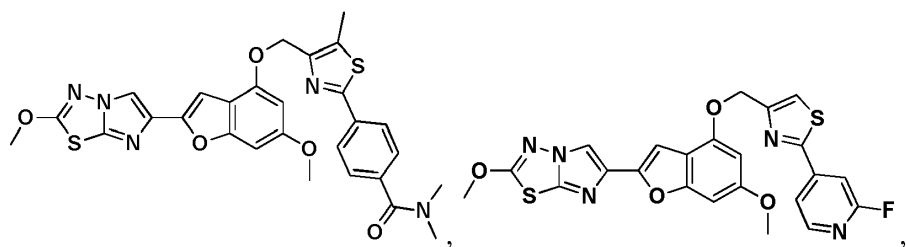
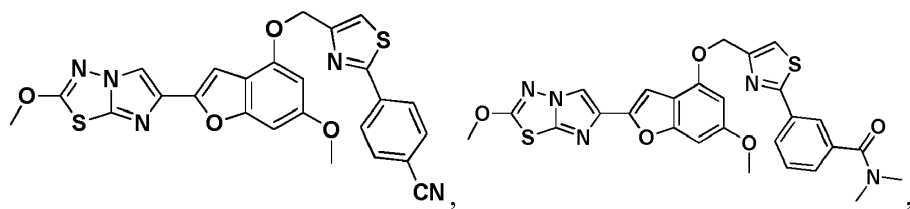
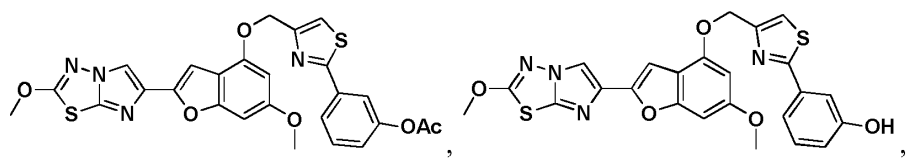
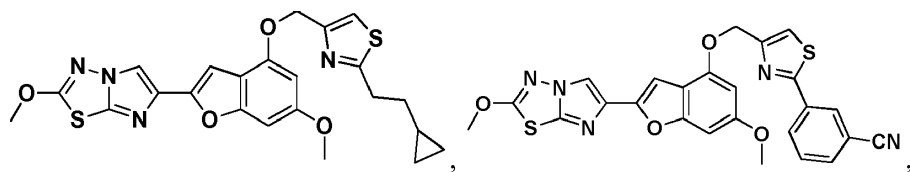
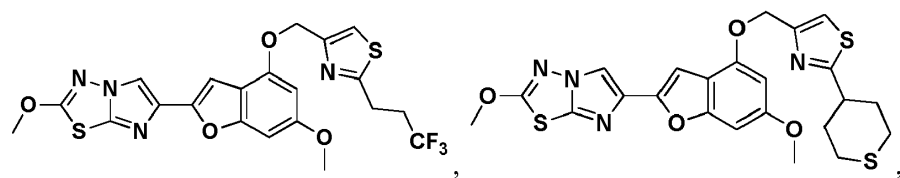


15

51

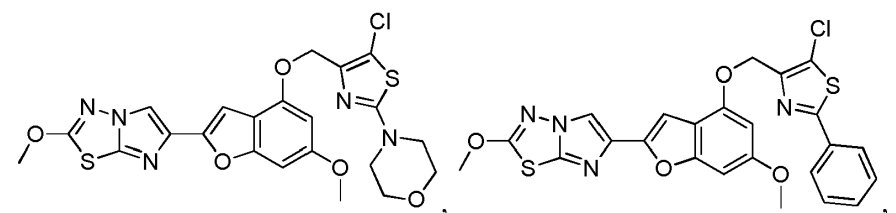




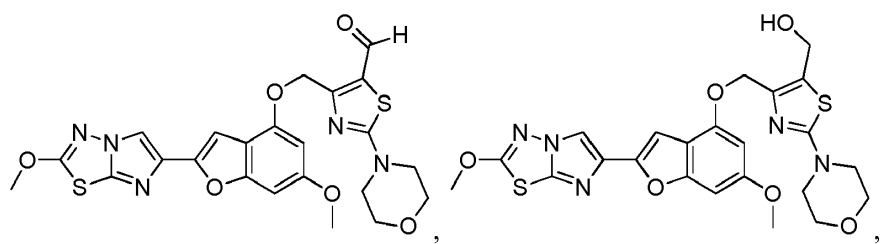
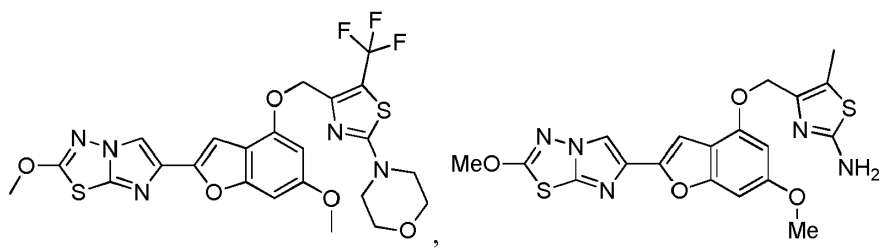


5

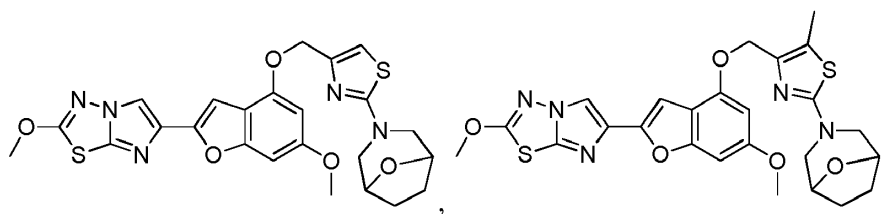
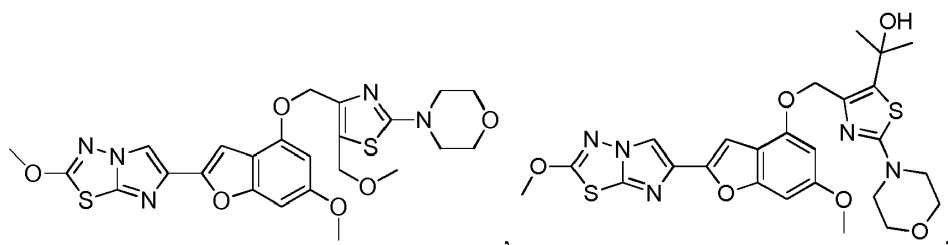
10



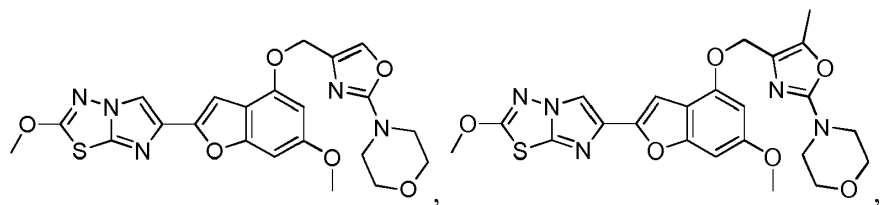
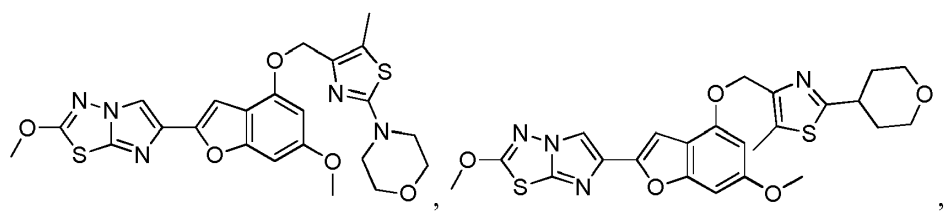
10

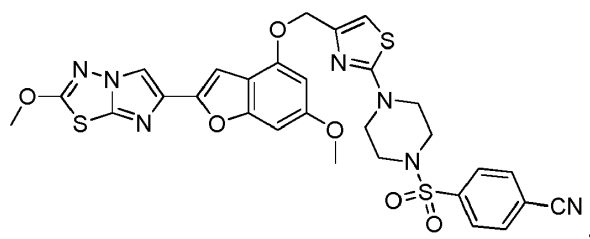
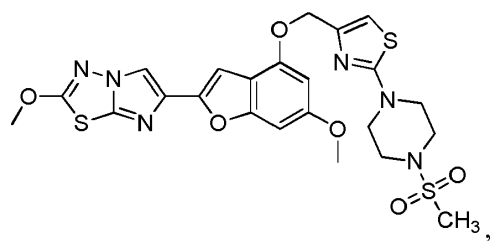
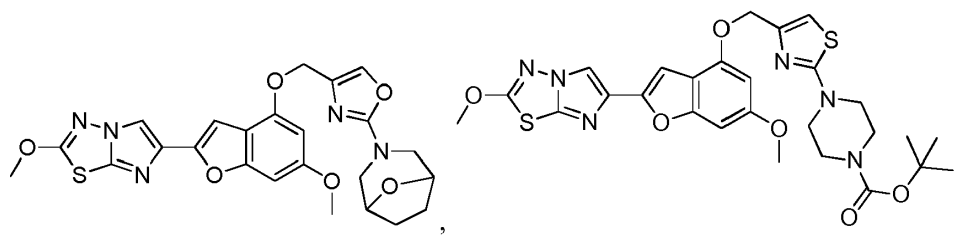


5

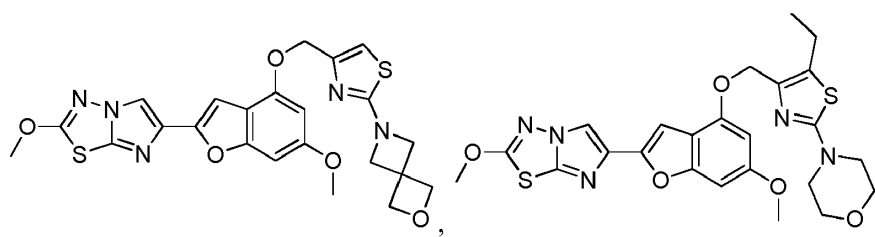
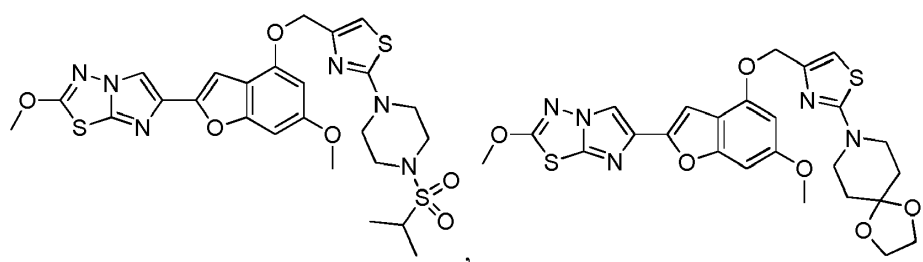


10

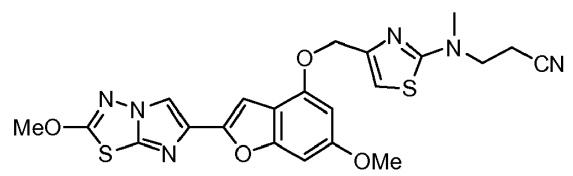


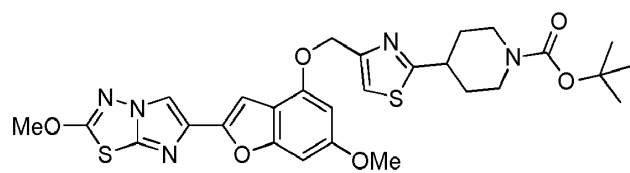
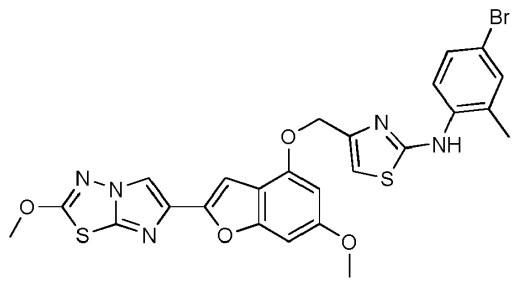
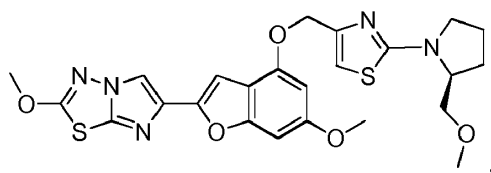


5

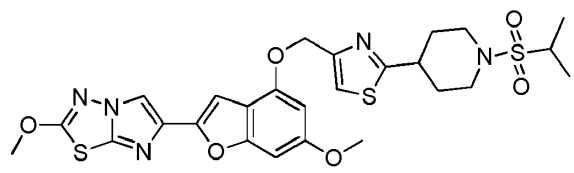
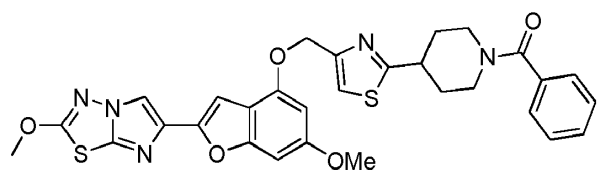


10

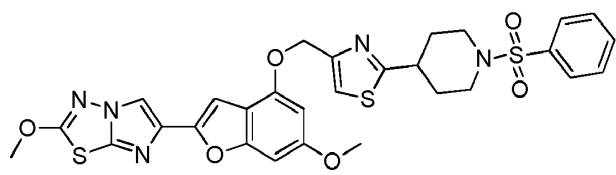
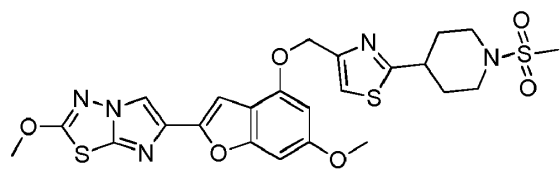


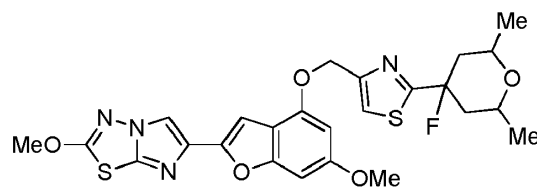
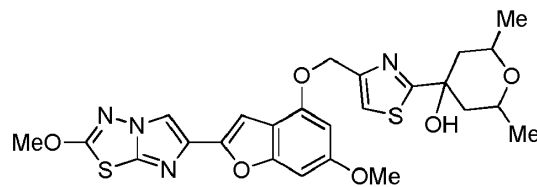
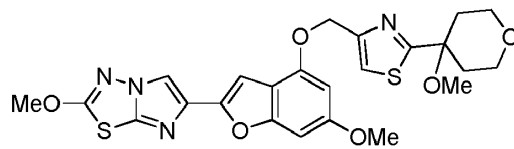
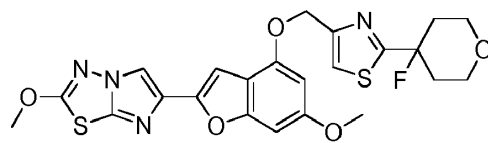
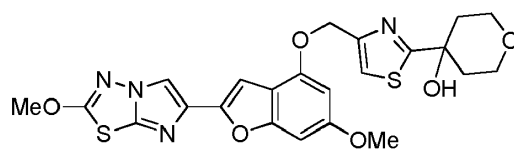
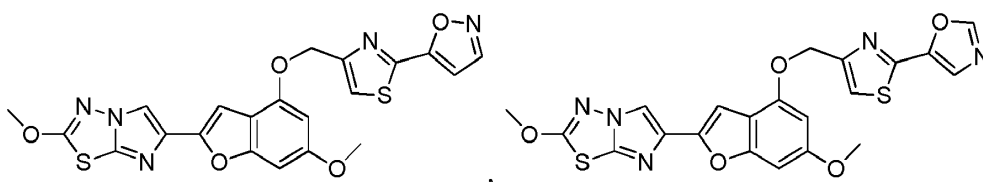
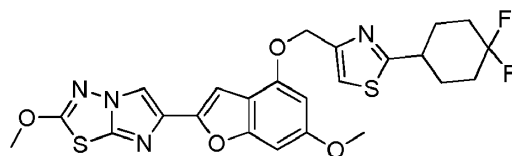
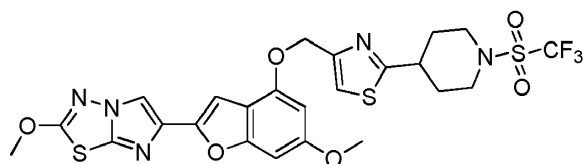


5



10







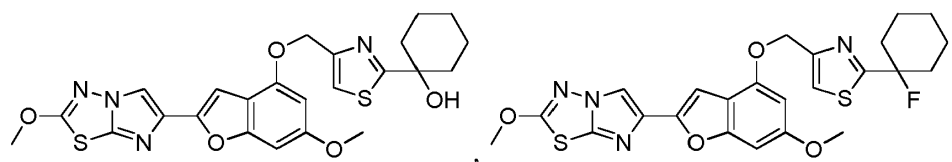
,



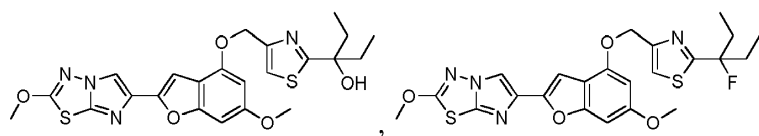
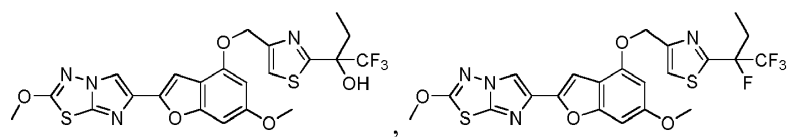
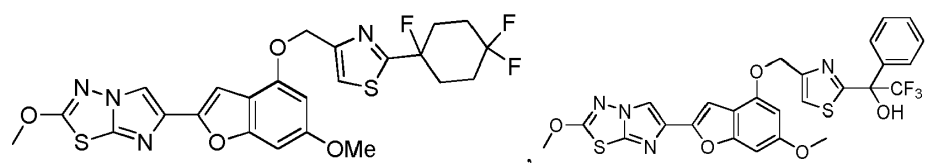
,



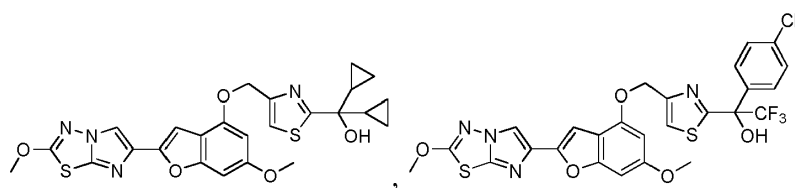
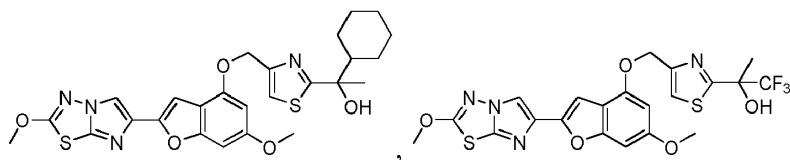
15



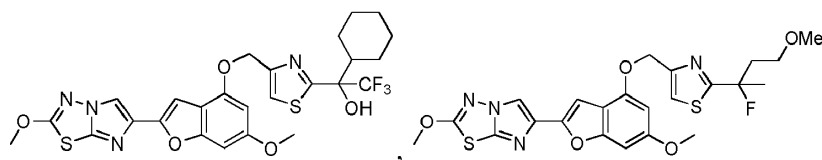
5

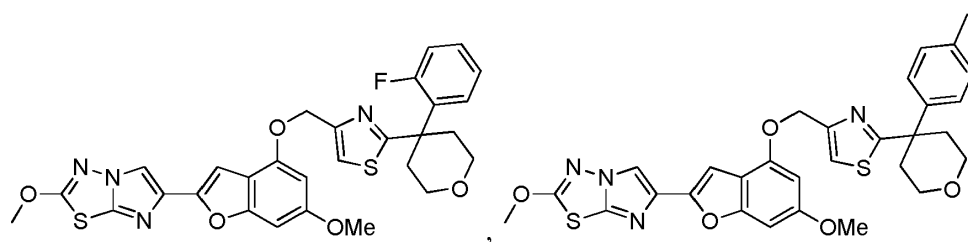
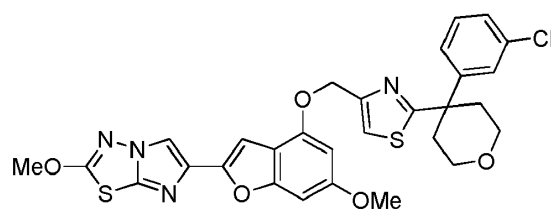
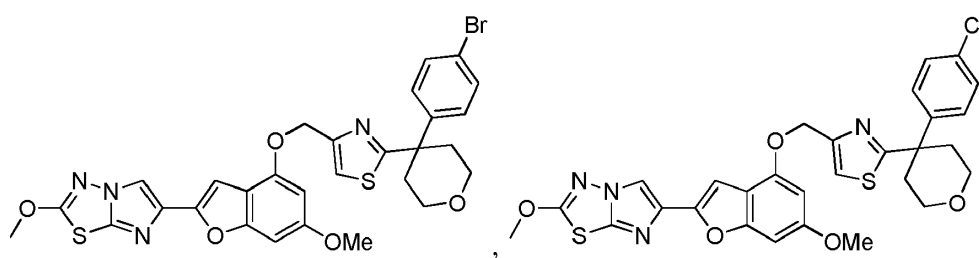
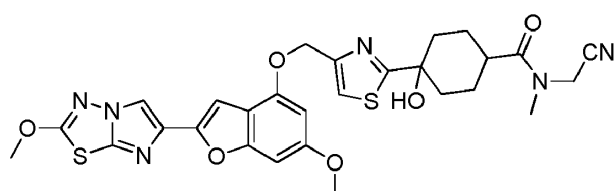
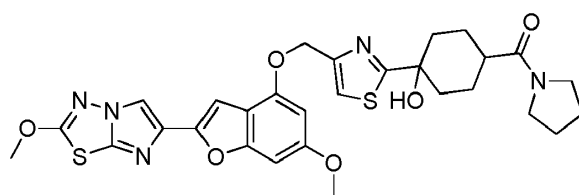
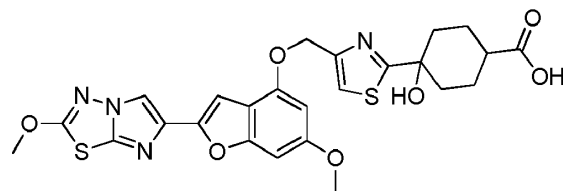
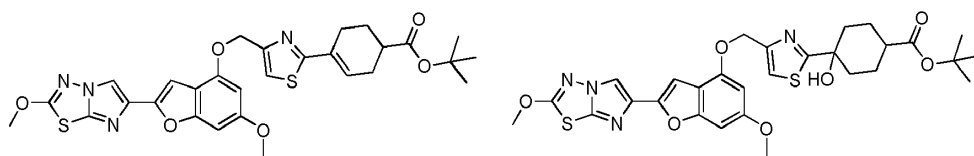


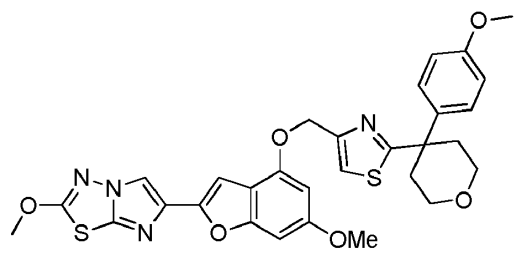
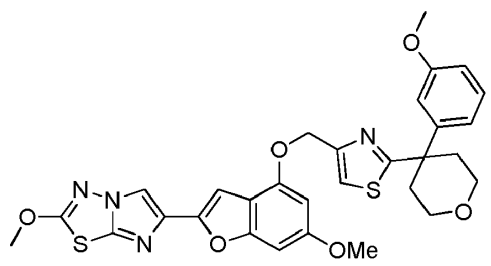
10



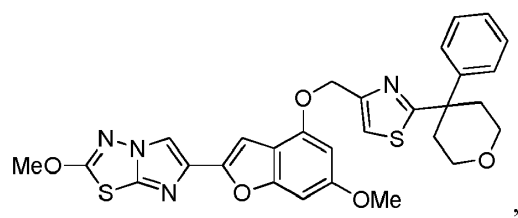
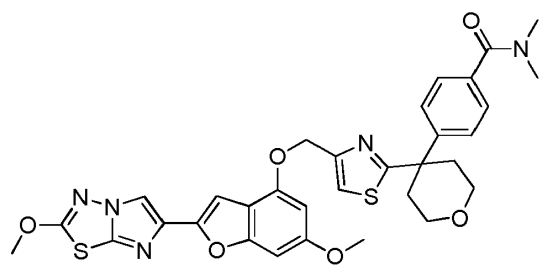
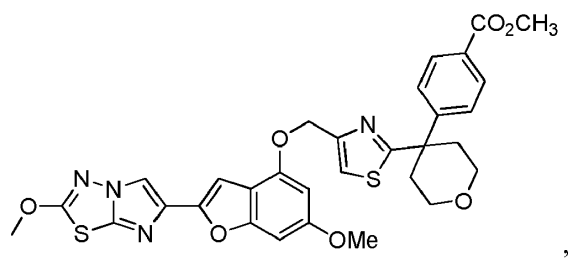
15



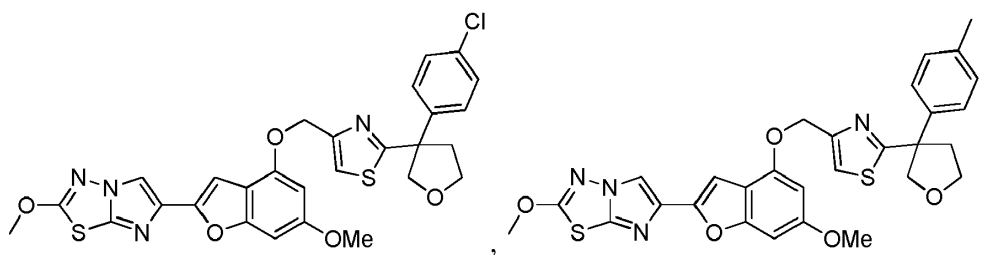


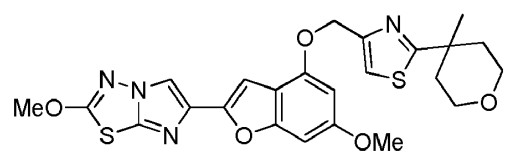
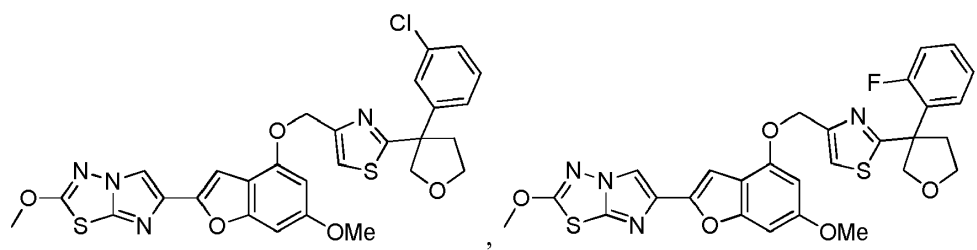


5

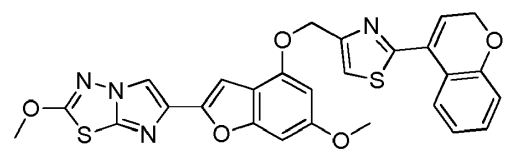
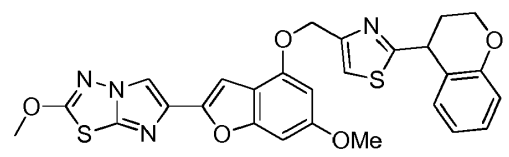


10

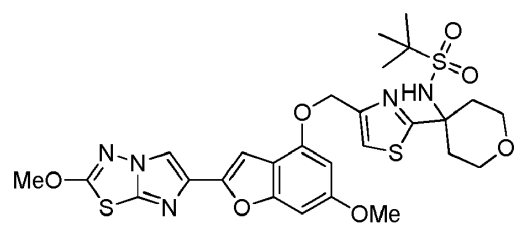
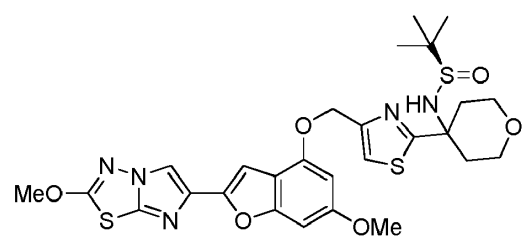


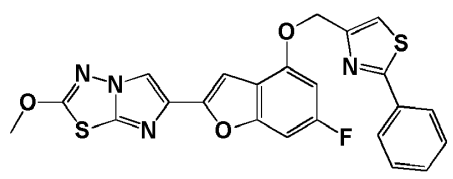
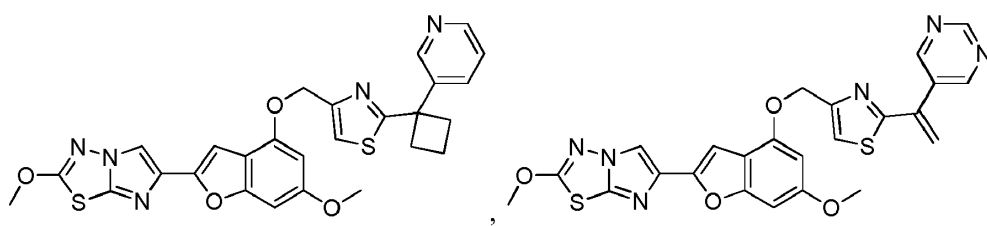
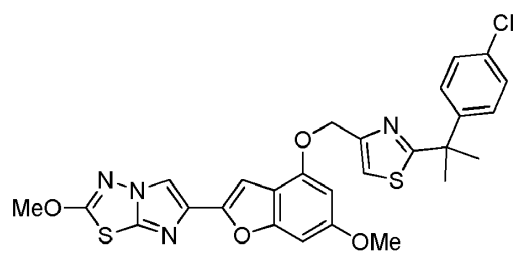
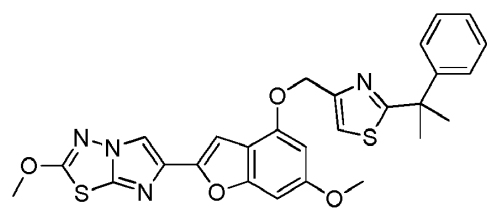
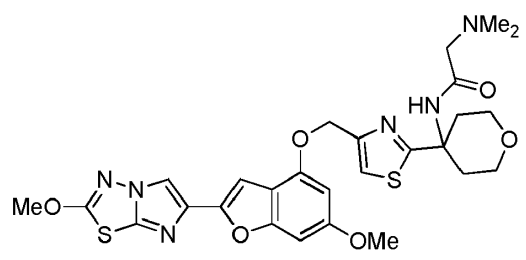
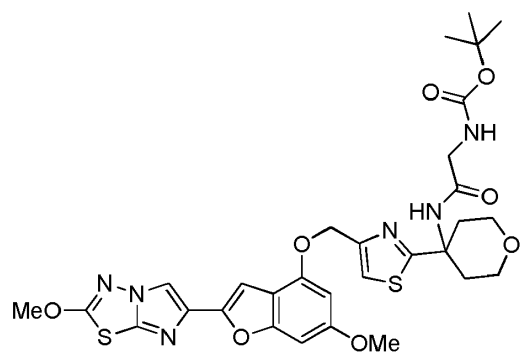


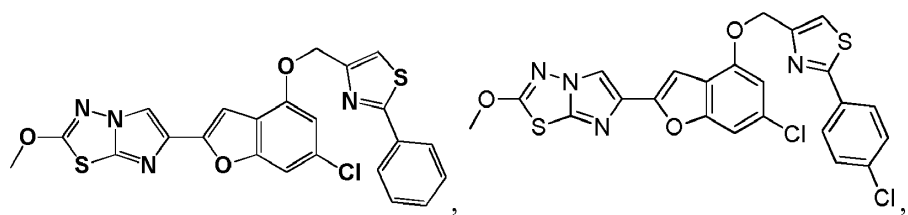
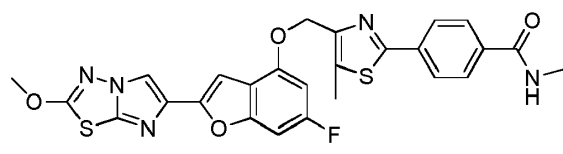
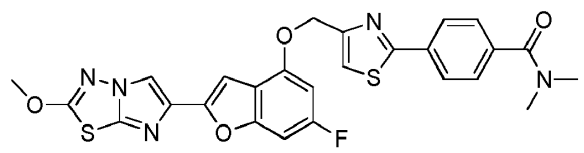
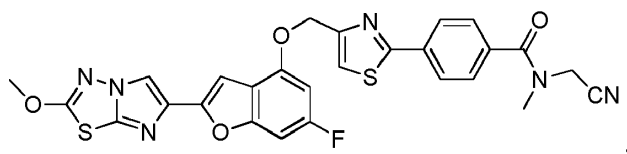
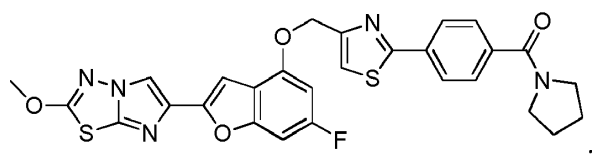
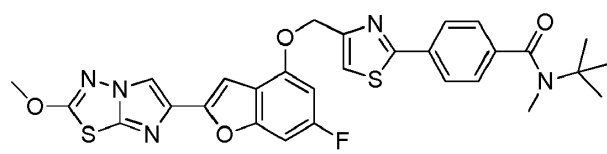
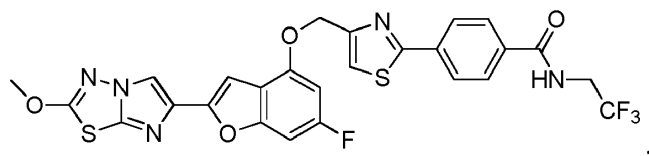
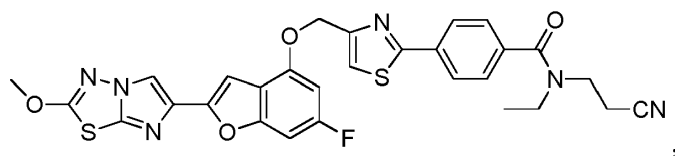
5

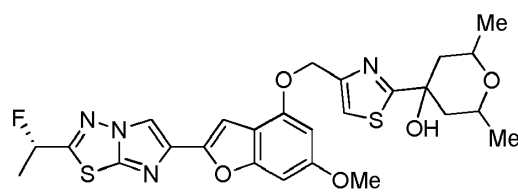
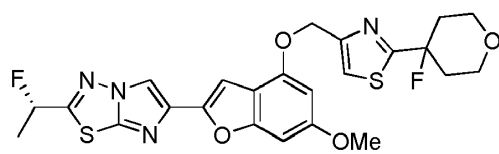
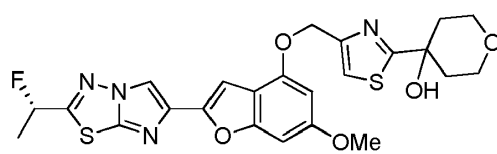
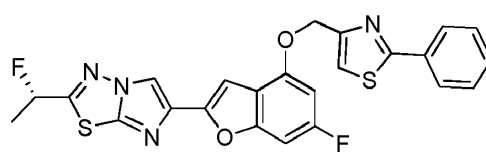
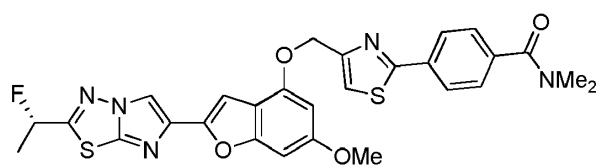
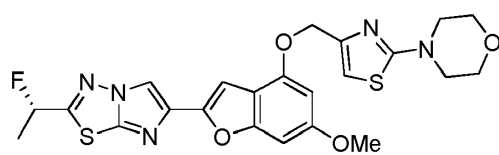
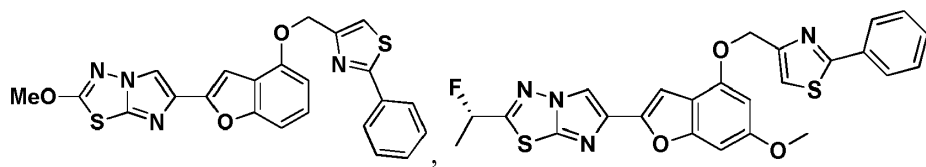
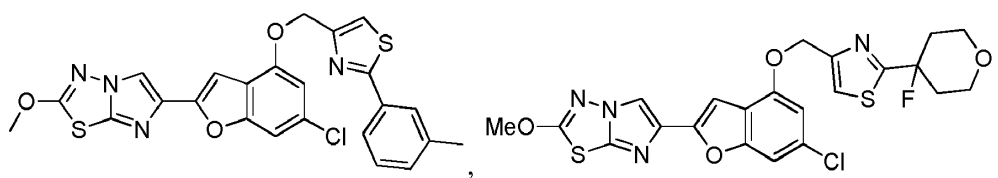


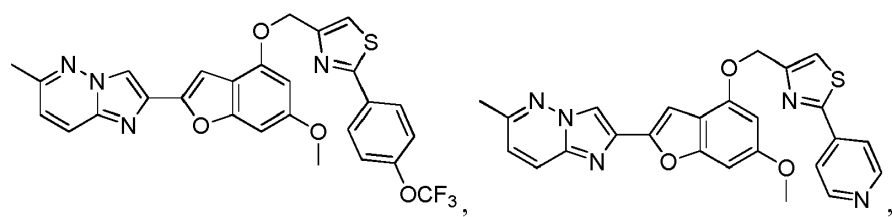
10

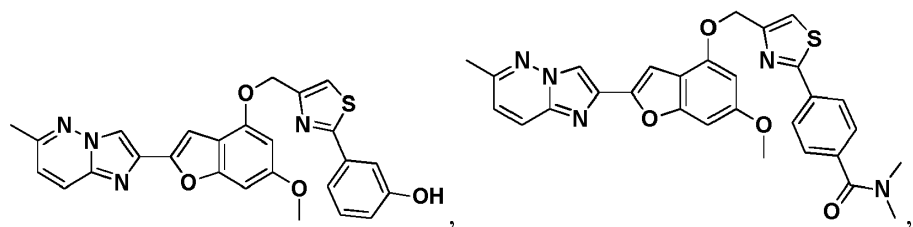
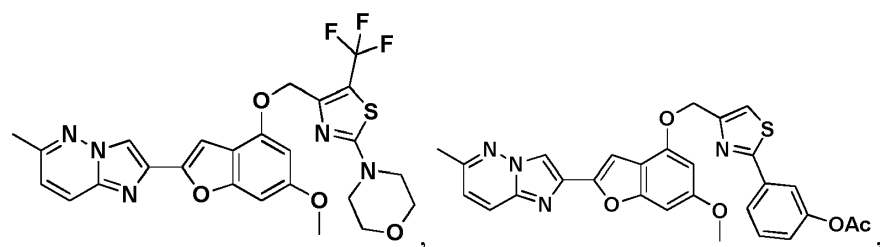
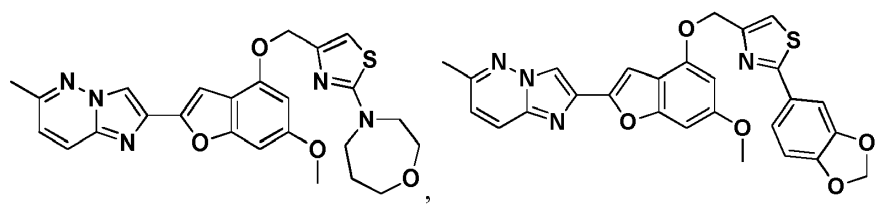


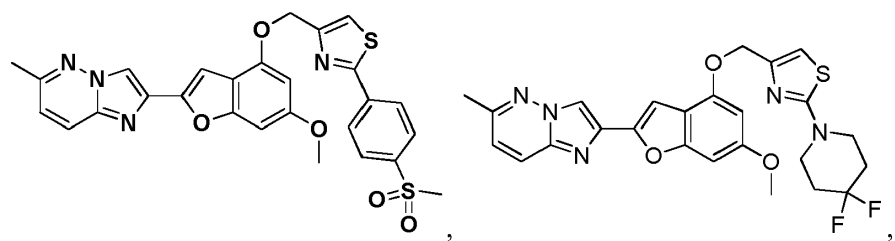
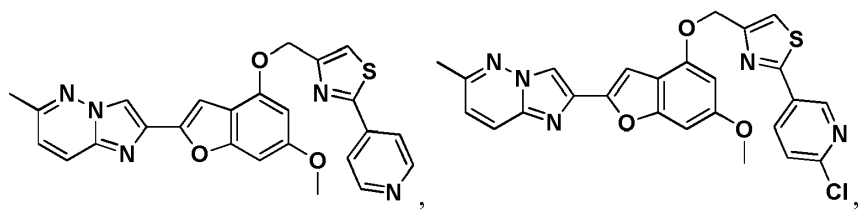
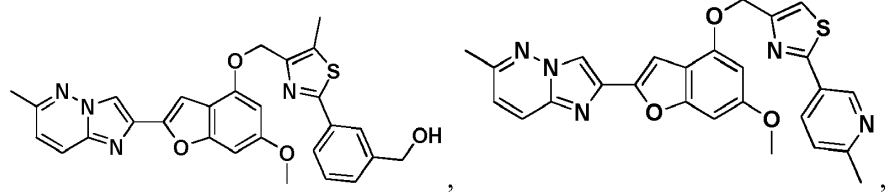
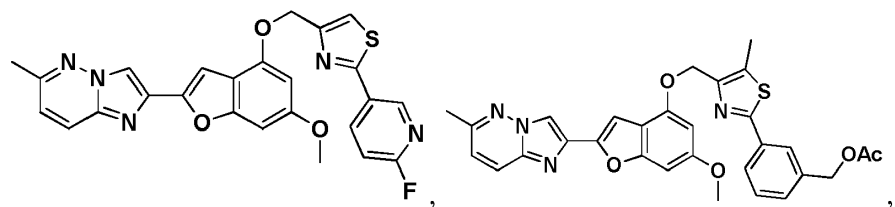
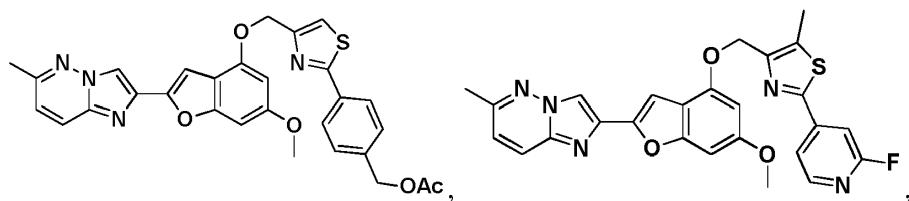
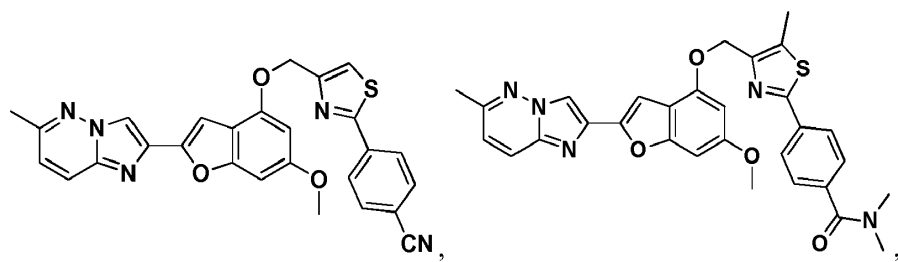






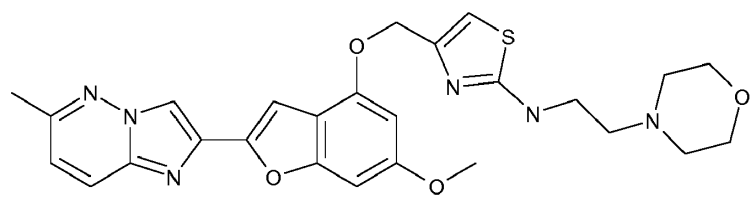
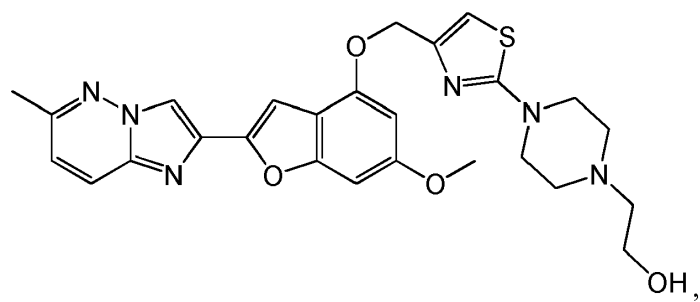
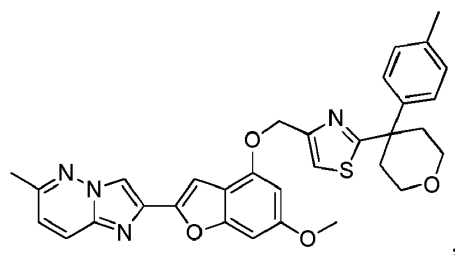
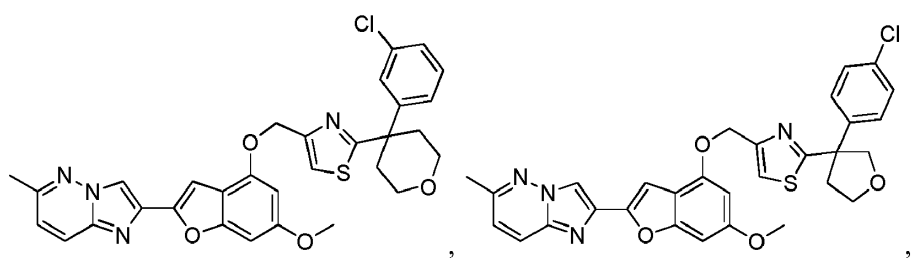
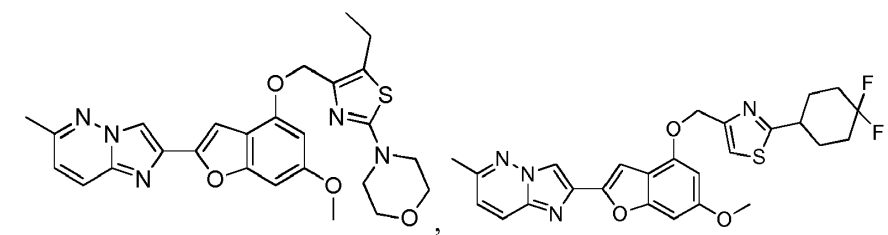
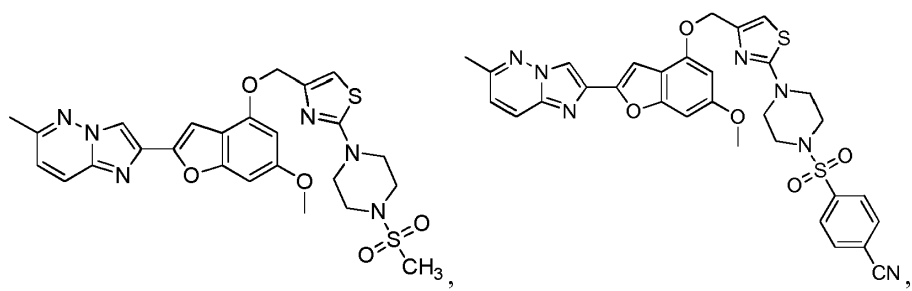




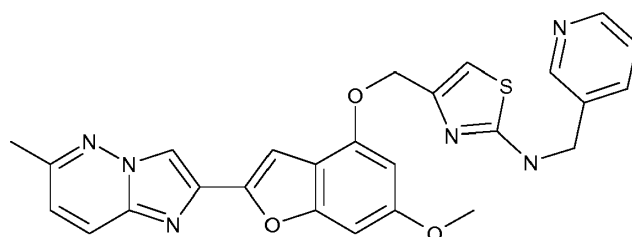


5

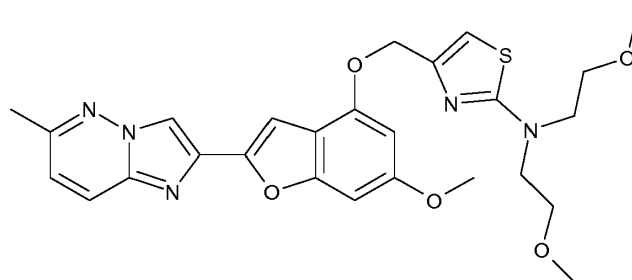
10



71

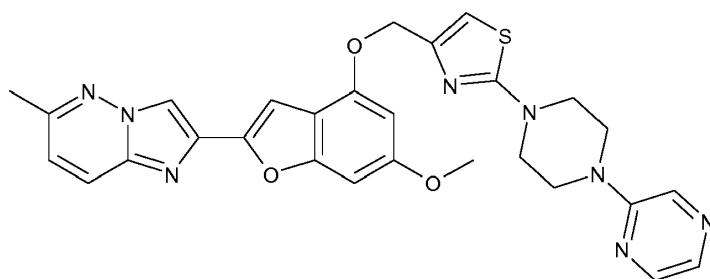


,

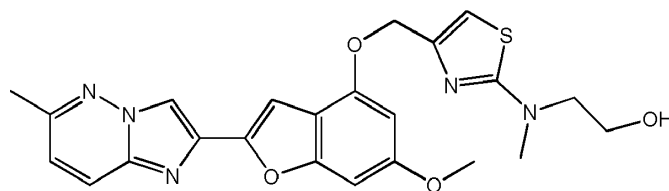


,

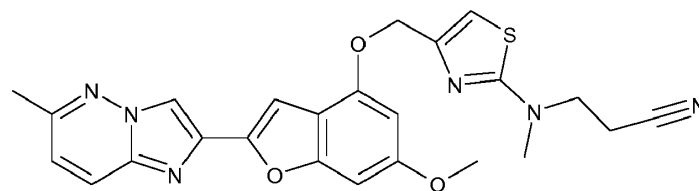
5



,,

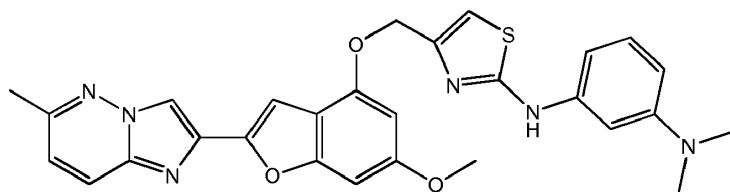


,



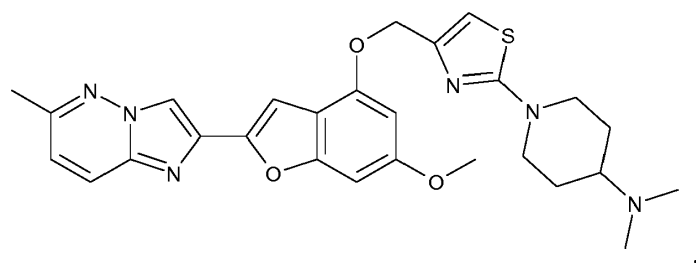
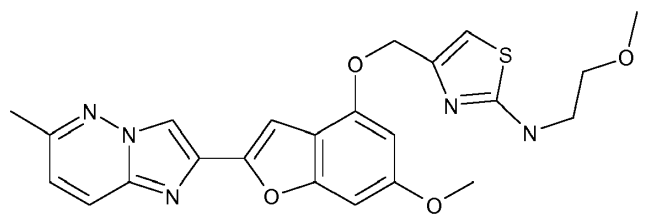
,

10

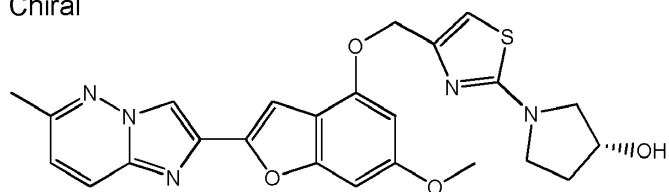


,

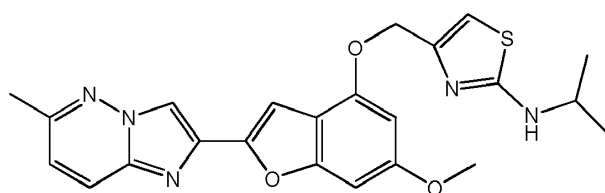
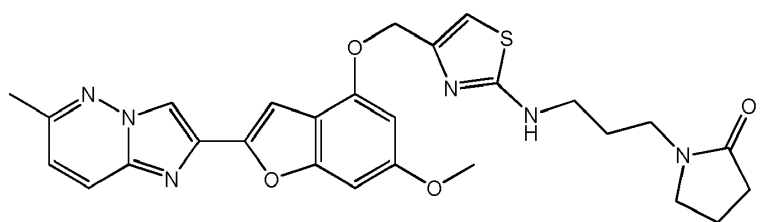
72



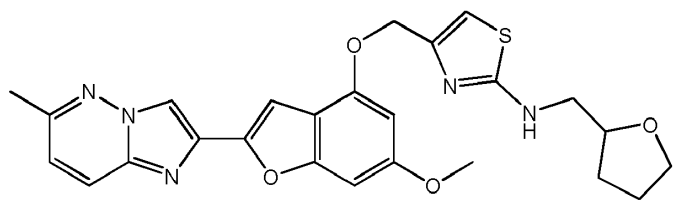
Chiral



5



10

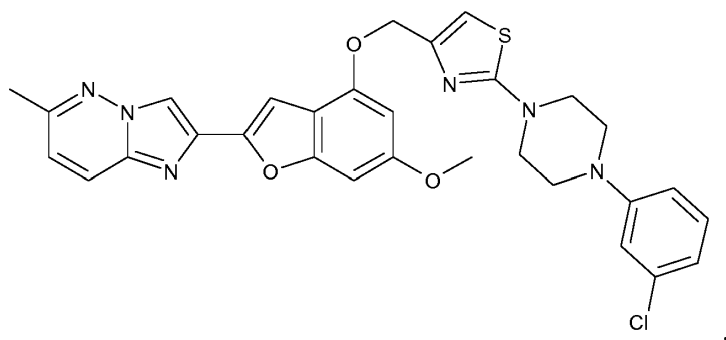
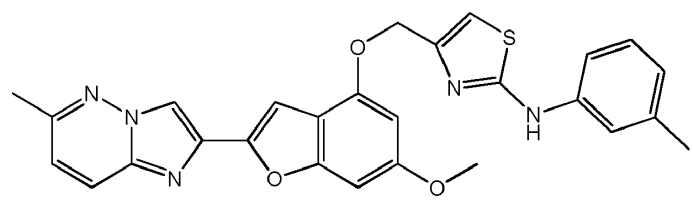
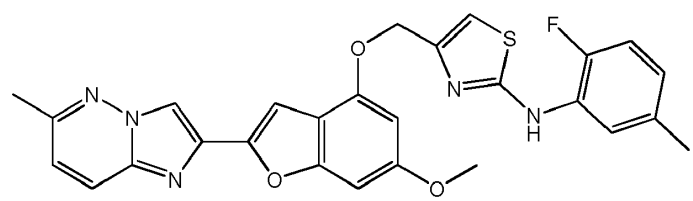
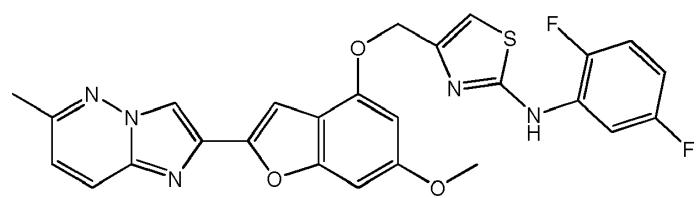
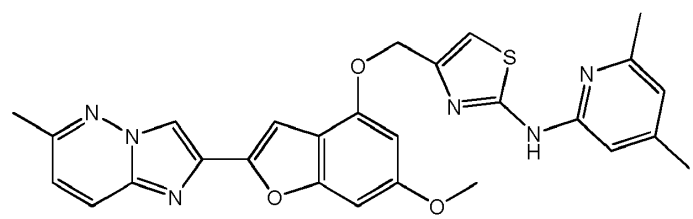
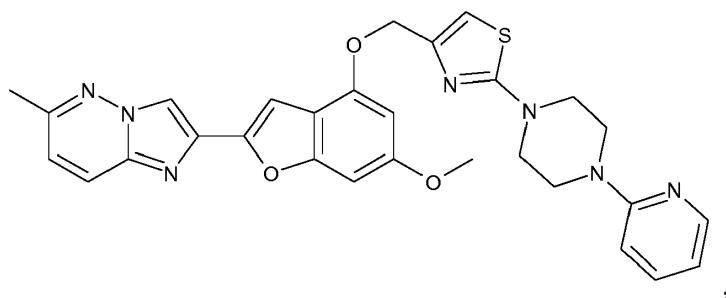




2

•

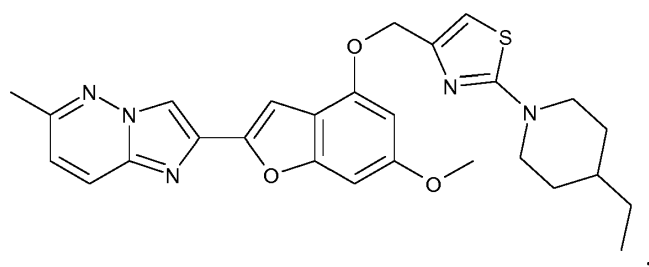
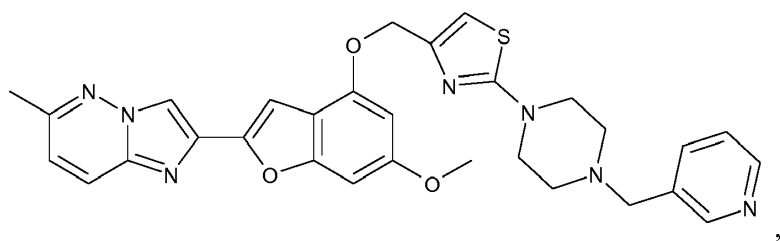
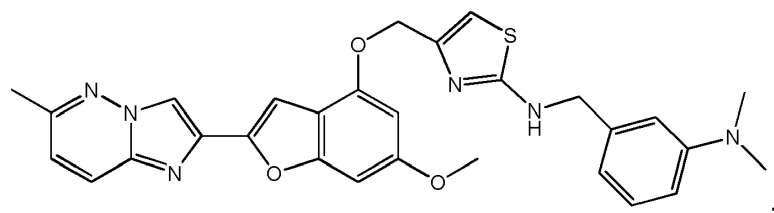
74



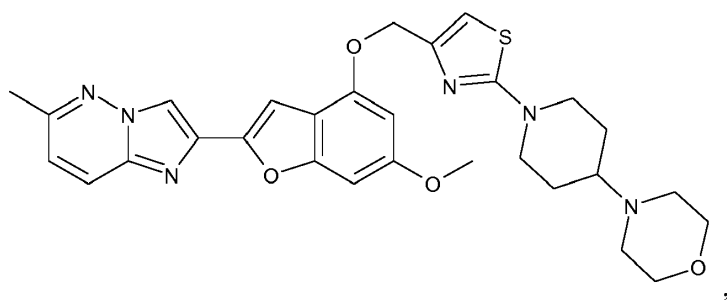
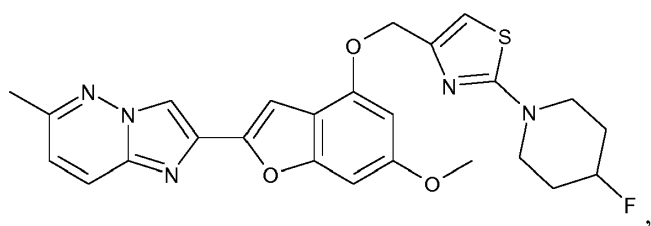
5

10

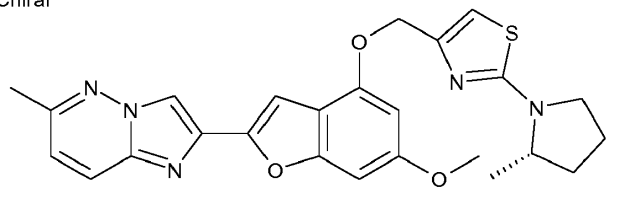
75



5

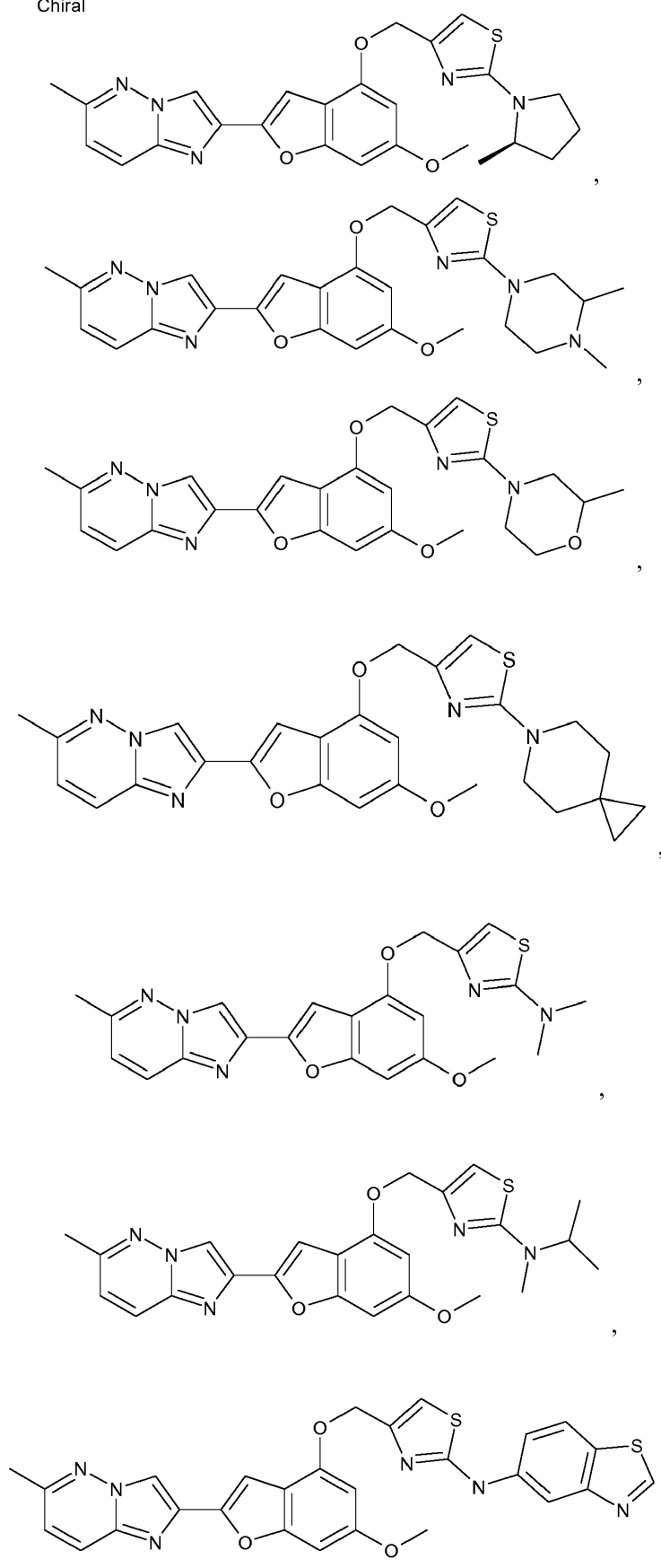


Chiral



10

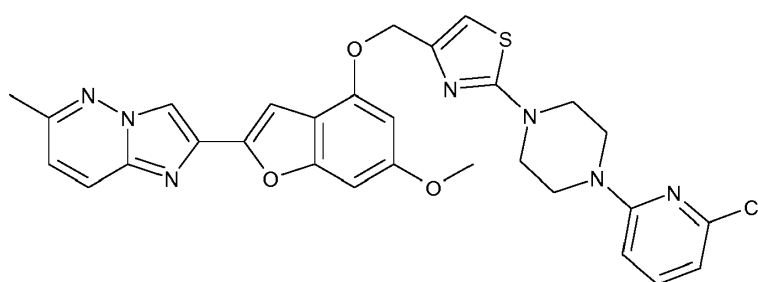
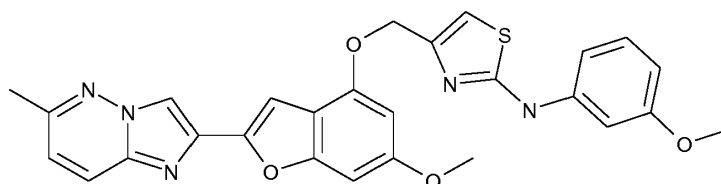
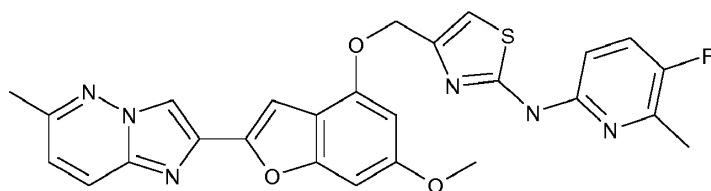
Chiral



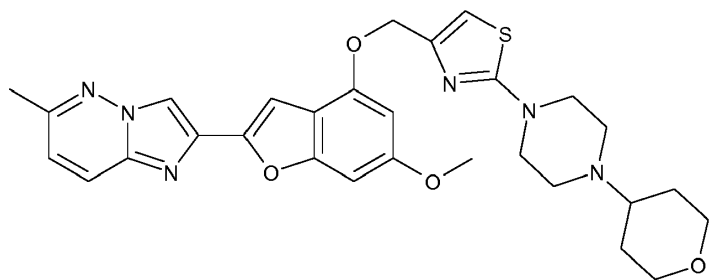
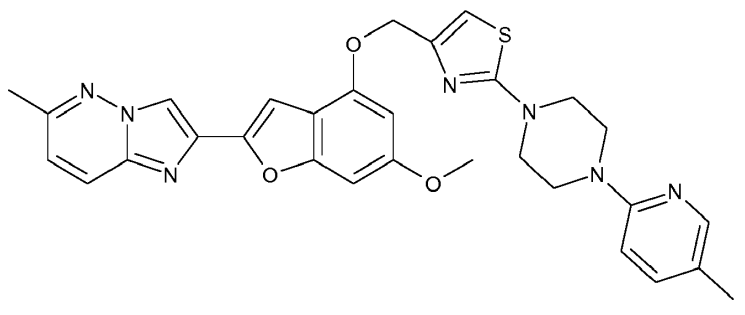
5

10

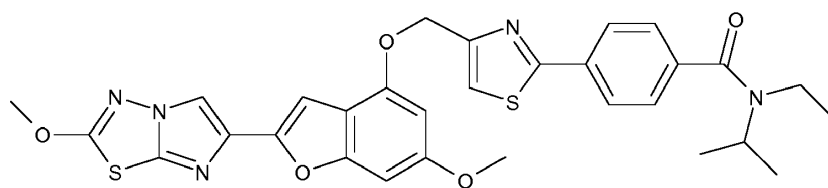
77



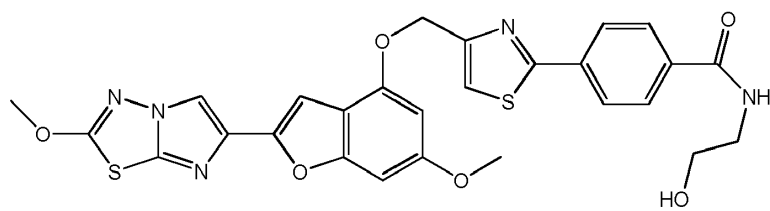
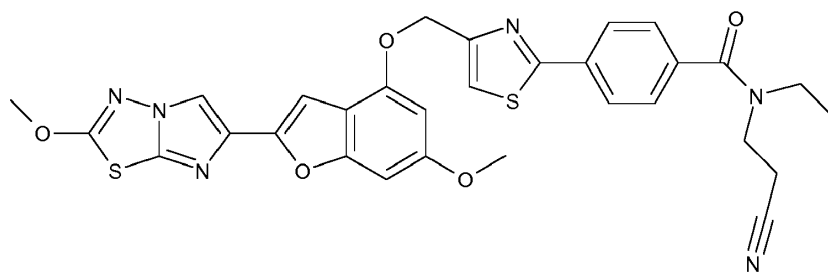
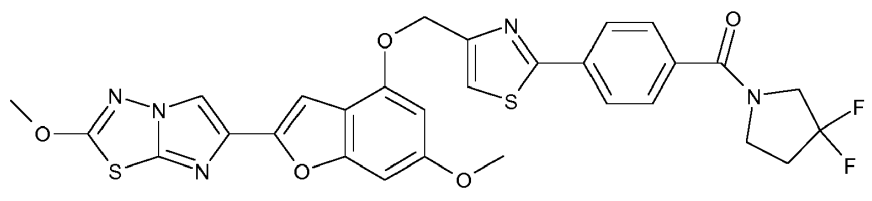
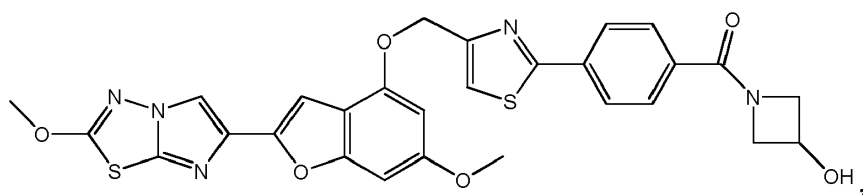
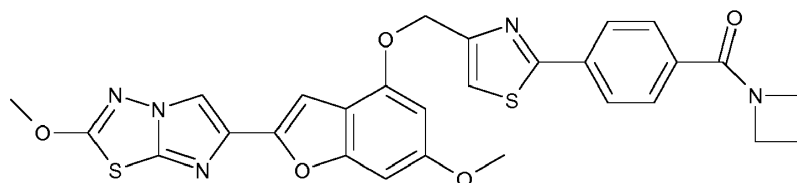
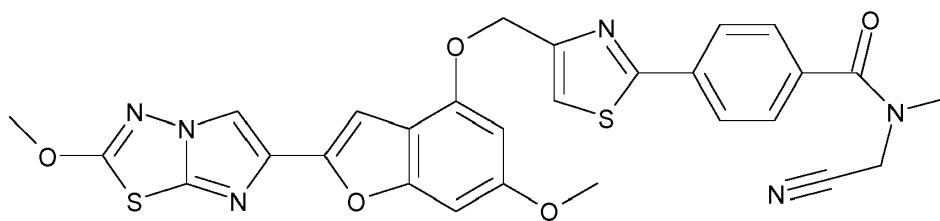
5



10

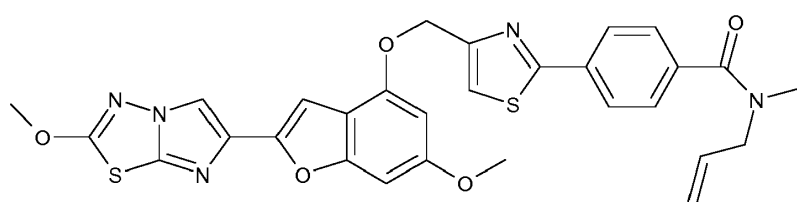
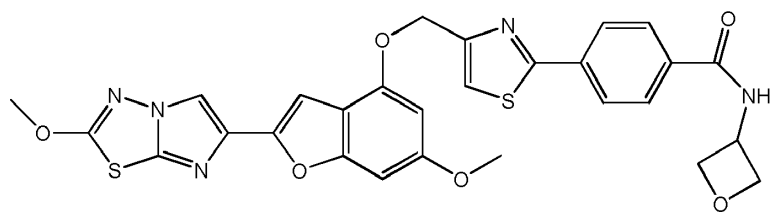
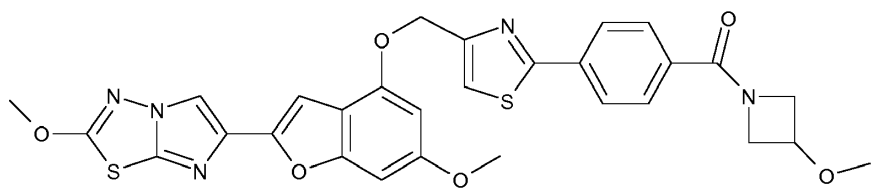


78

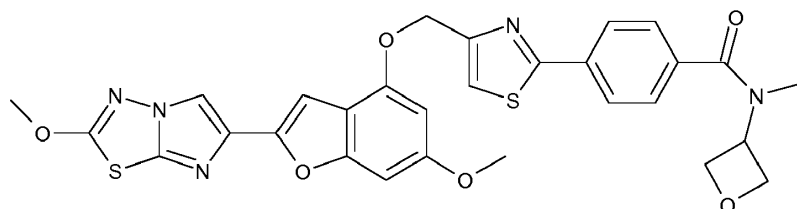
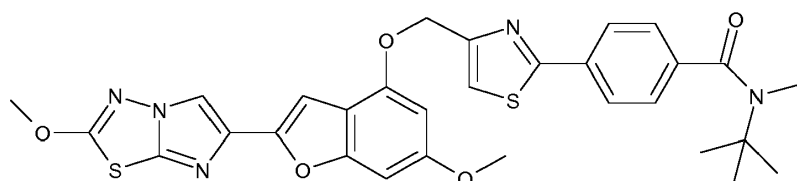


5

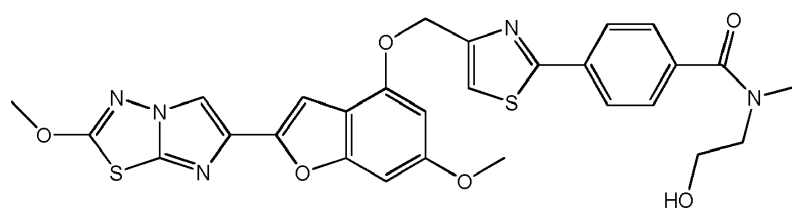
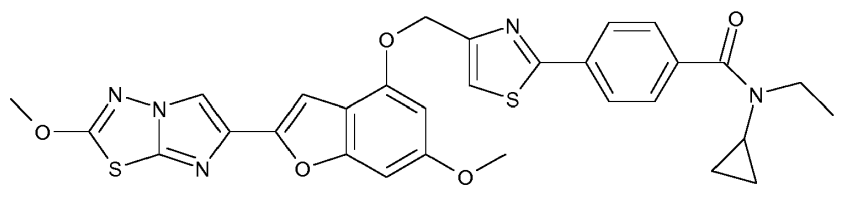
10

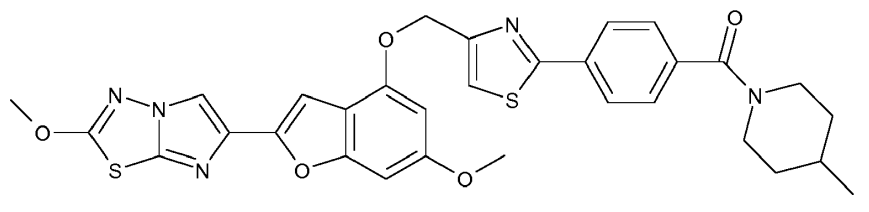
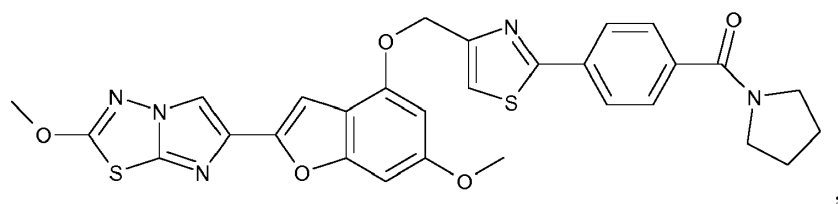


5

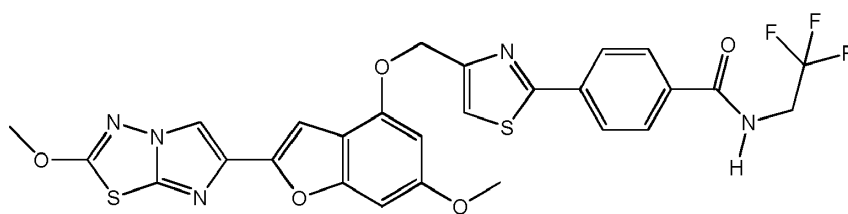
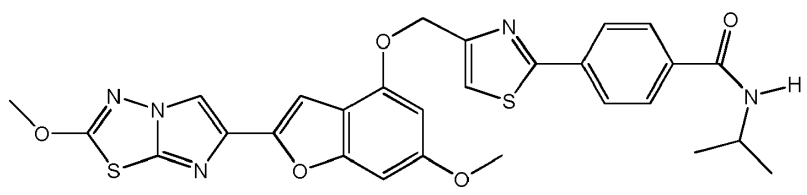
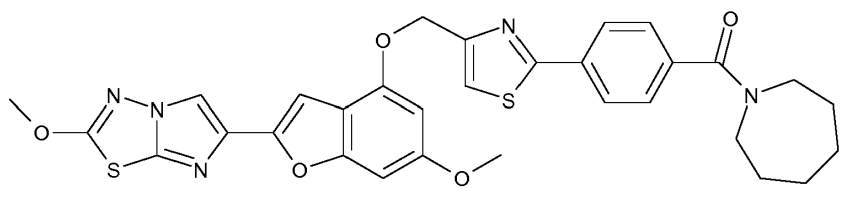


10

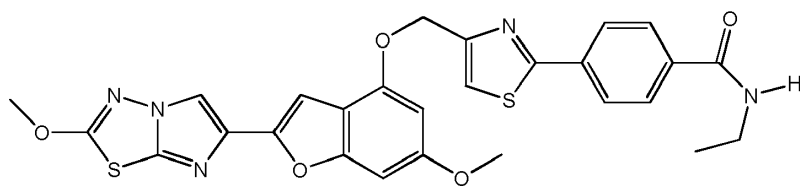




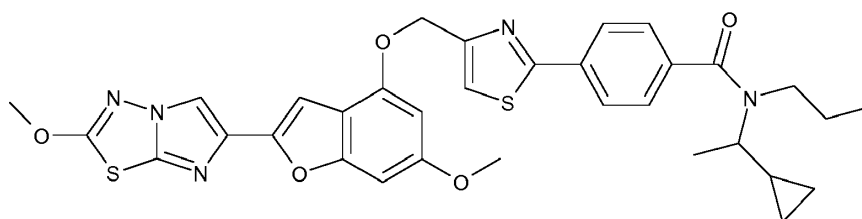
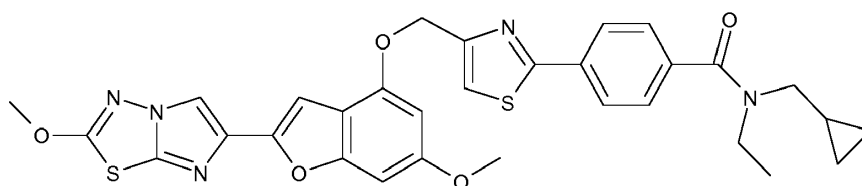
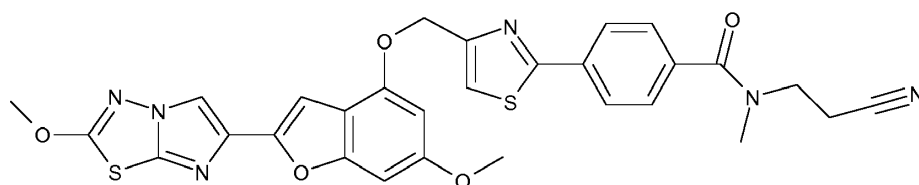
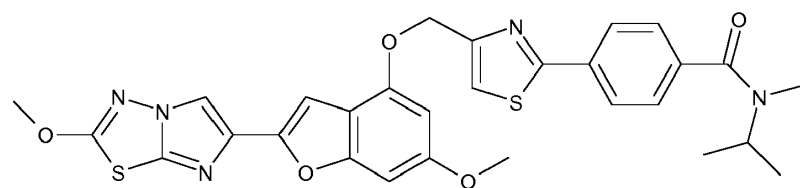
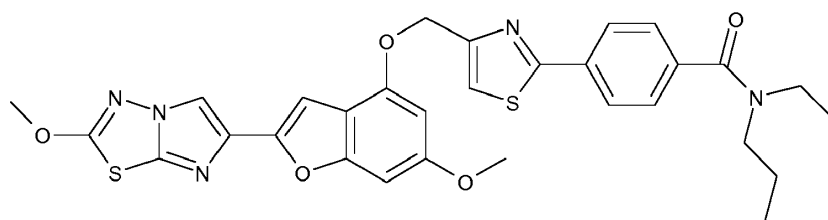
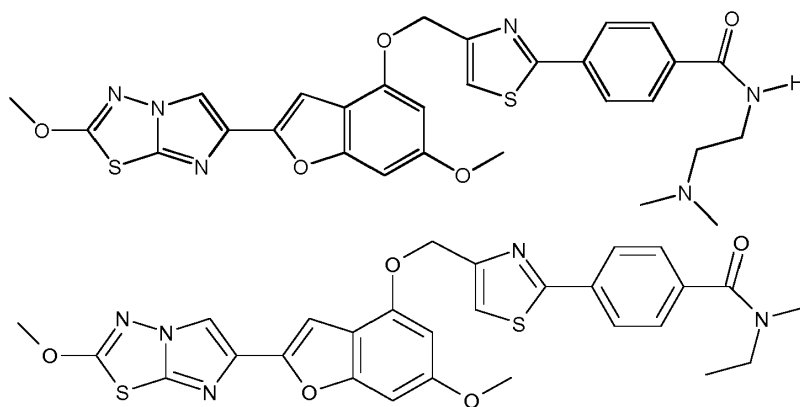
5

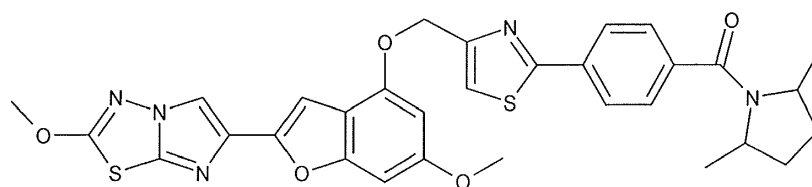
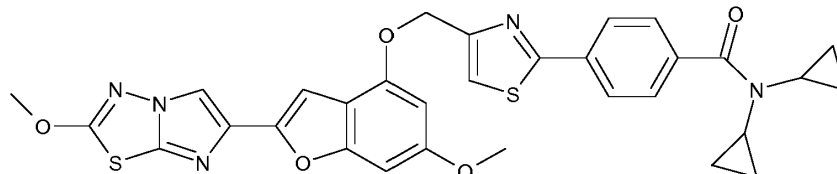
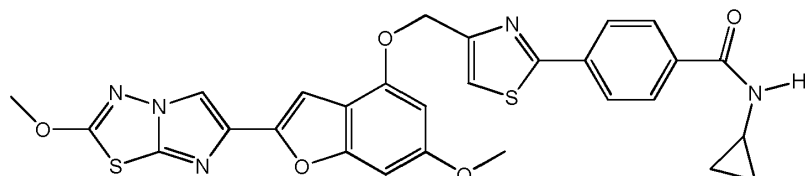
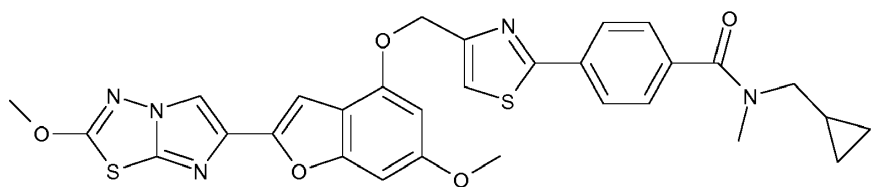


10

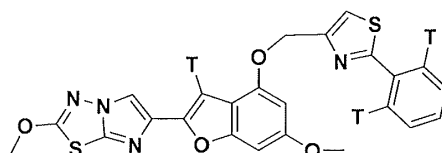


81





5



10 **13.** Forbindelsen som definert i krav 1, hvor:

Y er S eller -CH=CH-;

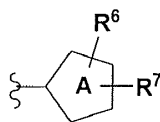
R¹ er valgt fra gruppen bestående av:

- 15 CH₃,
SCH₃,
OCH₃,
CH(CH₃) F,
C(CH₃) F₂, og
20 CF₃;

X¹ er CH eller N;

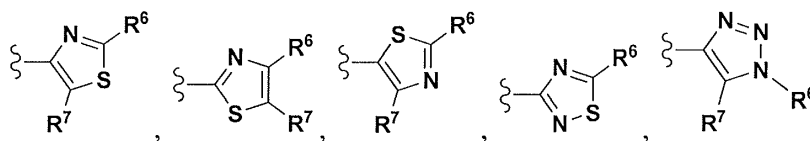
X^2 og X^4 er hver CH; og
 X^3 er CR^3 hvor R^3 er OCH_3 , F eller Cl;
 den 5-leddete heteroarylingen

5

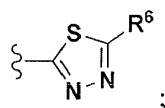


er valgt fra gruppen bestående av

10



og

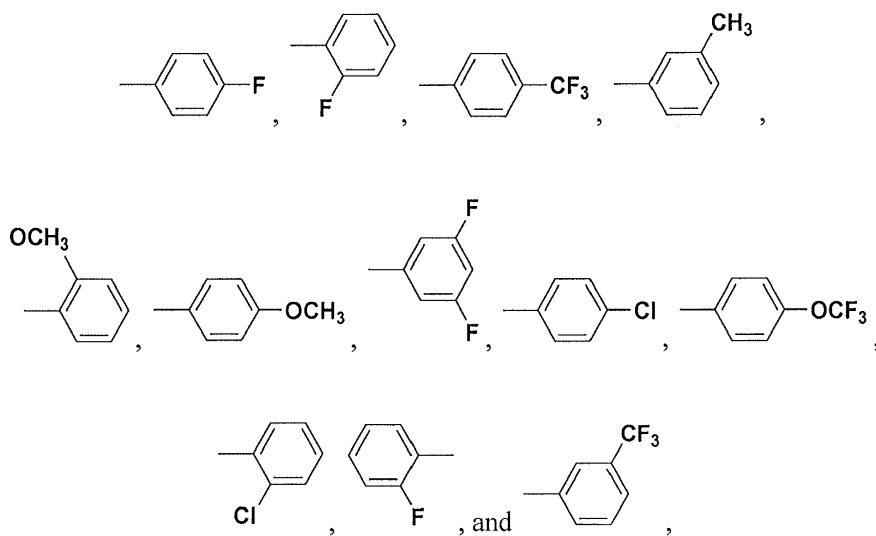


15

R^6 er valgt fra gruppen bestående av:

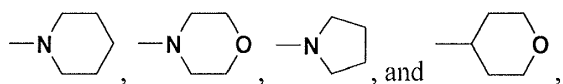
a) fenyl eller substituert fenyl, som er valgt fra gruppen bestående av

20



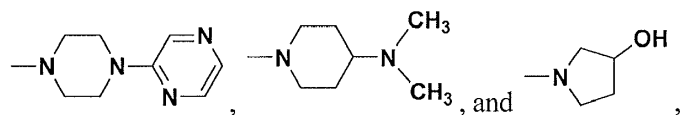
25

b) heterocyklyl, som er valgt fra gruppen bestående av



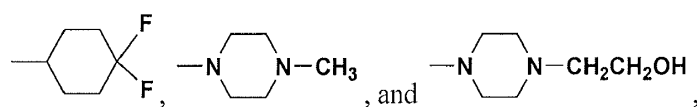
c) substituert heterocyklyl, som er valgt fra gruppen bestående av

5

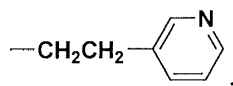


d) cykloalkyl, som er valgt fra gruppen bestående av

10

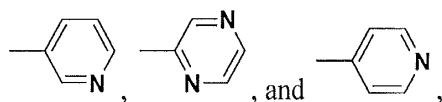


e) heteroaryl-C₁-C₃-alkyl, som er



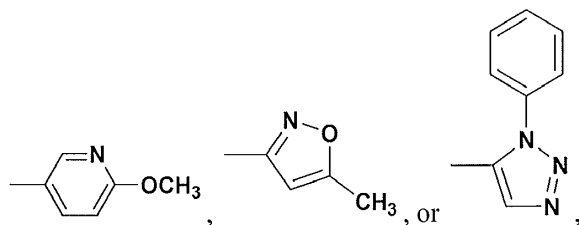
15

f) heteroaryl, som er valgt fra gruppen bestående av



20

g) substituert heteroaryl, som er valgt fra gruppen bestående av



h) haloalkyl, som er -CF₃,

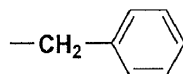
25

i) halogen, som er Br,

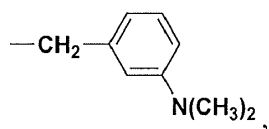
j) alkoksyaloksyalkyl, som er -CH₂OCH₂CH₂OCH₃,

k) alkyl som er valgt fra -CH₂CH₃ eller CH₃,

l) aryl-C₁-C₃-alkyl, som er valgt fra

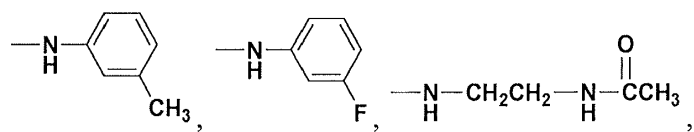
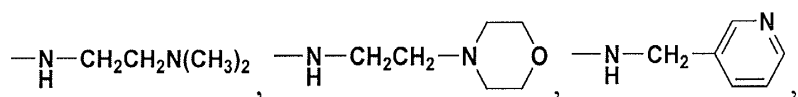


5 eller

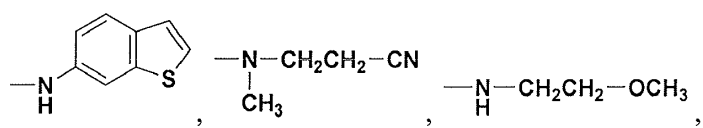
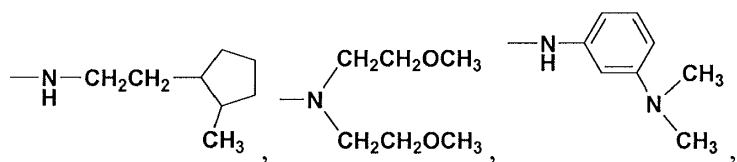


m) H,

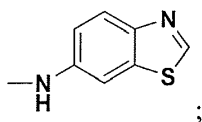
10 n) -NR¹¹R¹², som er valgt fra gruppen bestående av



15



20 og



og

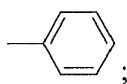
25

R⁷ er valgt fra H eller C₁-C₄ alkyl.

14. Forbindelsen som definert i krav 1, hvor:

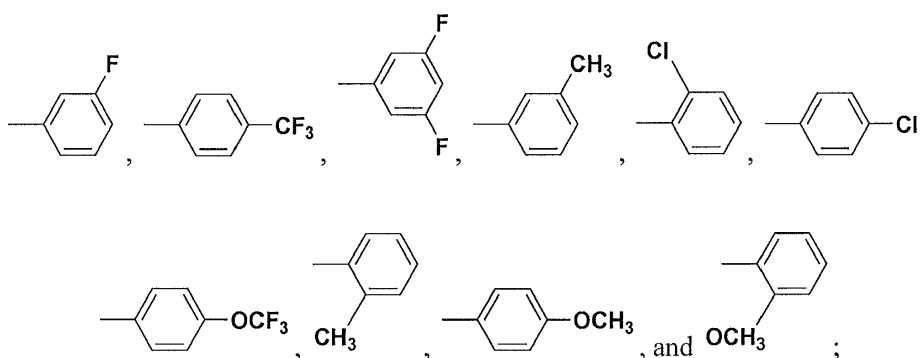
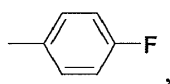


5 er valgt fra gruppen bestående av



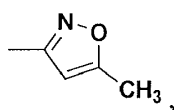
substituert fenyl, som er valgt fra gruppen bestående av

10

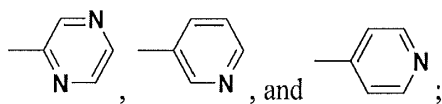


15

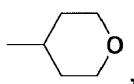
heteroaryl, som er valgt fra gruppen bestående av



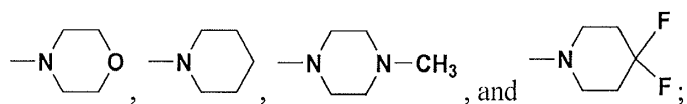
20



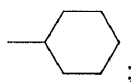
heterocyklyl, som er valgt fra gruppen bestående av



25



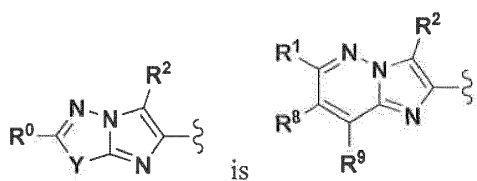
og cykloalkyl, som er



og

R^7 er valgt fra gruppen bestående av H og C_1 - C_4 alkyl.

10 **15.** Forbindelsen som definert i krav 1, hvor:



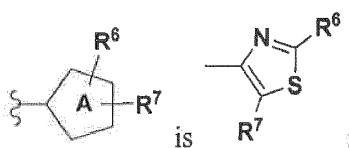
hvor

R^1 er CH_3 ;

X^1 er CH;

R^2 er H;

R^3 er OCH_3 ;



R^6 er valgt fra gruppen bestående av:

a) fenyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av klor, $-CF_3$, cyano, $-OCH_3$, $-OCF_3$, $-SO_2CH_3$ og $(C=O)N(CH_3)_2$;

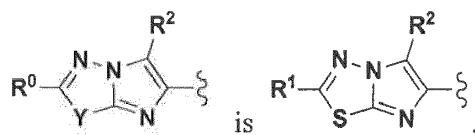
b) pyridinyl eller pyrimidinyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av fluor, klor, $-CH_3$ og $-OCH_3$; og

c) piperidinyl, morfolinyl eller tiomorfolinyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av fluor, OH, $-CH_3$ og $-NH_2$;

R^7 er valgt fra gruppen bestående av H og $-\text{CH}_3$; og
 R^8 og R^9 er hver H.

16. Forbindelsen som definert i krav 1, hvor:

5



hvor

10

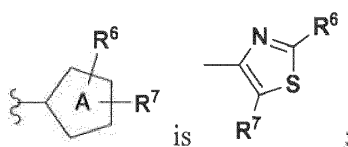
R^1 er OCH_3 , $-\text{CHFCH}_3$, eller $-\text{CF}_2\text{CH}_3$;

R^2 er H;

X^1 er CH;

R^3 er OCH_3 eller fluor;

15

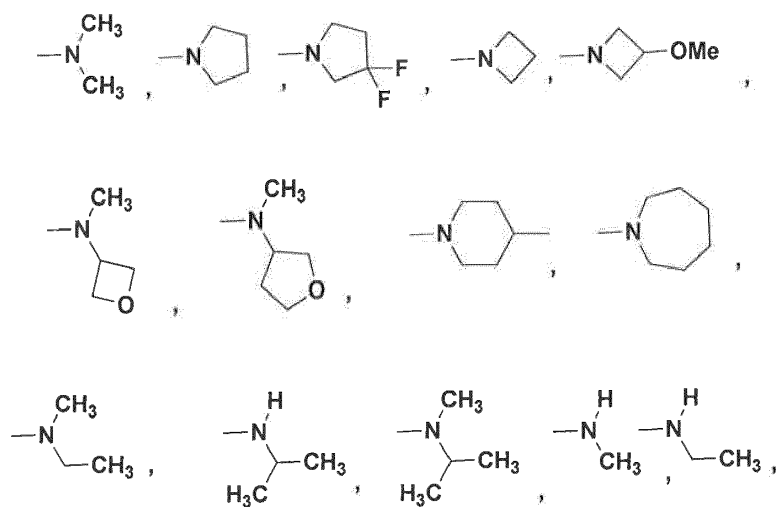


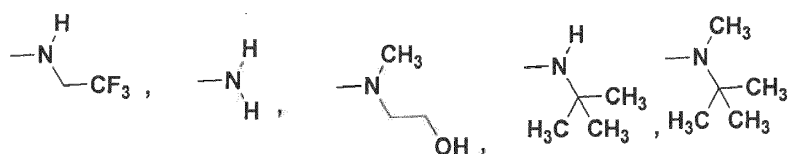
R^6 er valgt fra gruppen bestående av:

20

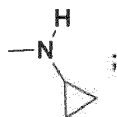
a) fenyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående
av fluor, klor, $-\text{CH}_3$, $-\text{CF}_3$, OH, cyano, $-\text{CH}_2\text{CN}$, $-\text{OCH}_3$, $-\text{OCF}_3$, $-\text{CH}_2\text{OH}$,
 $-\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{OH}$, $-\text{SO}_2\text{CH}_3$ og $(\text{C}=\text{O})\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$, hvor $\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$ er valgt fra:

25





eller



5

b) pyridinyl eller pyrimidinyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av fluor, klor, -CH_3 og -OCH_3 ;

10

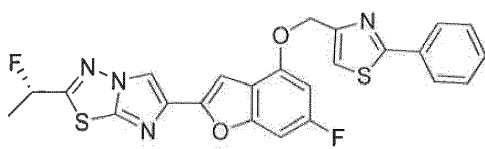
c) tetrahydropyranyl, tetrahydrotiopyranyl, piperidinyl, morfolinyl, tiomorfolinyl eller piperazin substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av fluor, OH, -CH_3 og -NH_2 ; og

d) cykloheksyl substituert med 0 til 3 grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av fluor, OH og NH_2 ; og

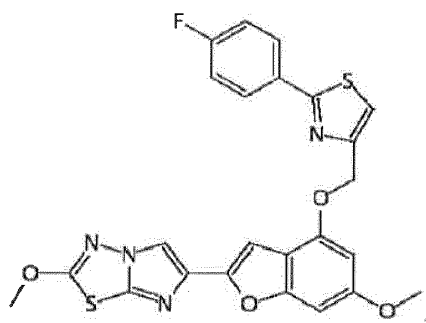
15

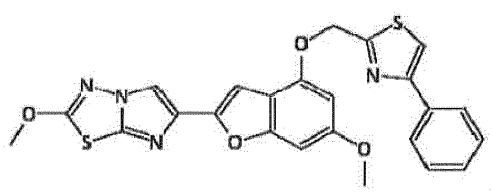
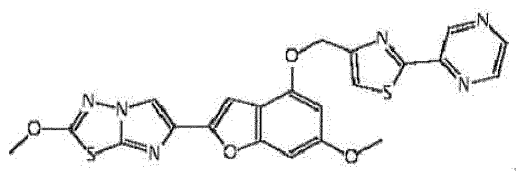
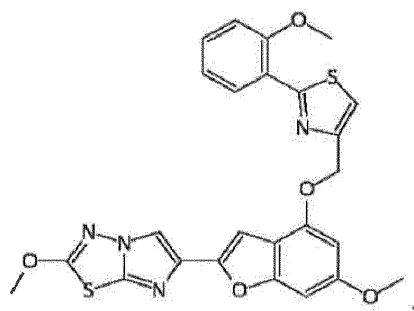
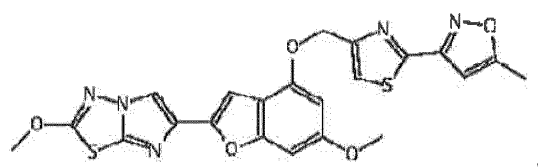
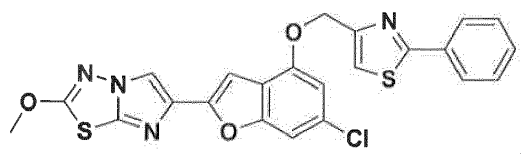
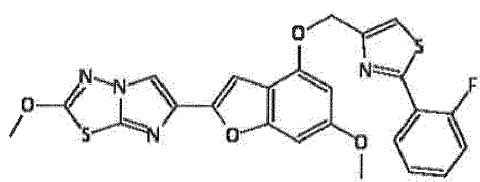
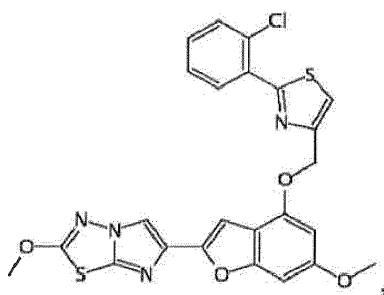
R^7 er valgt fra gruppen bestående av H og -CH_3 .

17. En forbindelse ifølge krav 1, hvor forbindelsen er valgt fra



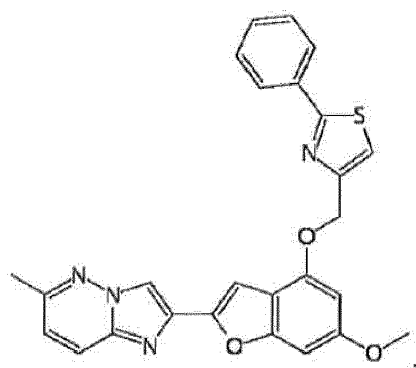
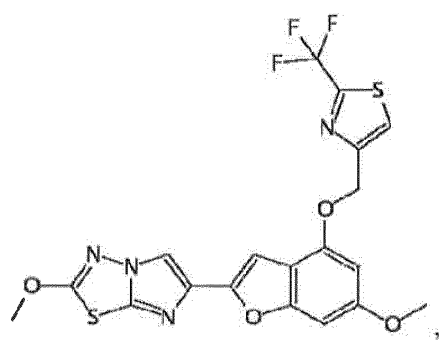
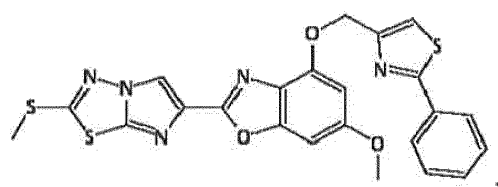
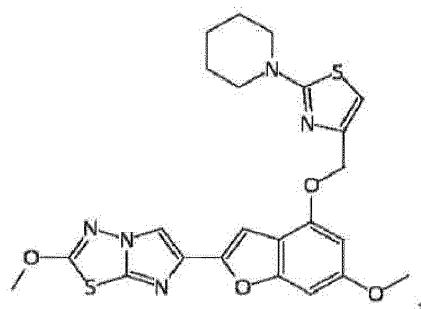
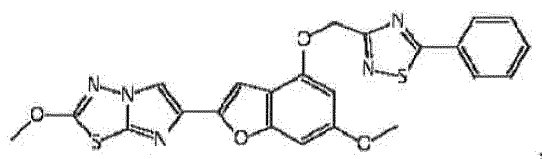
20

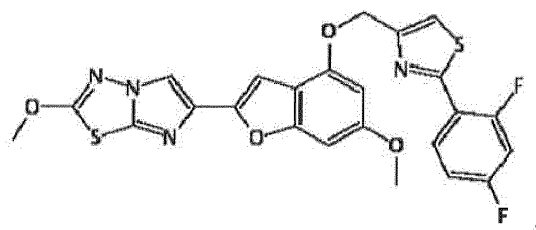
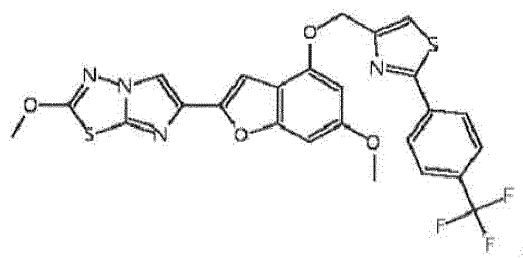
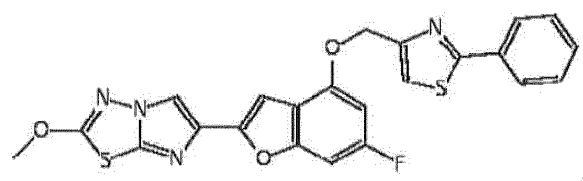
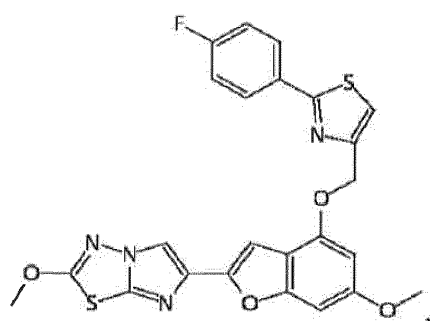
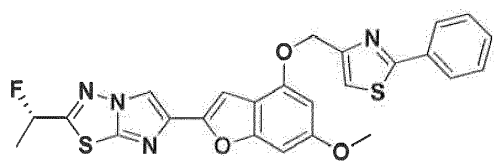
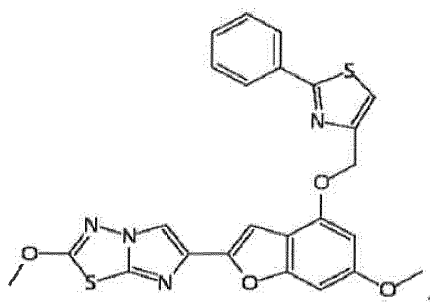




5

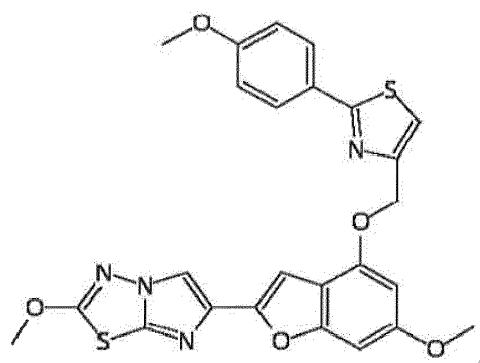
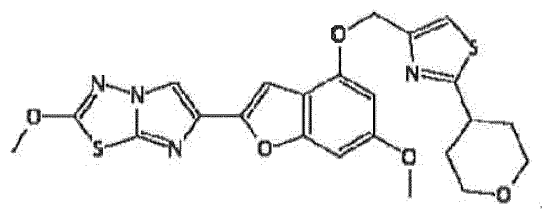
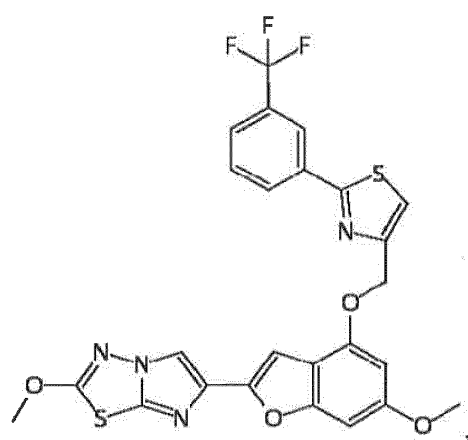
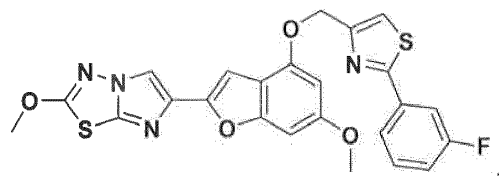
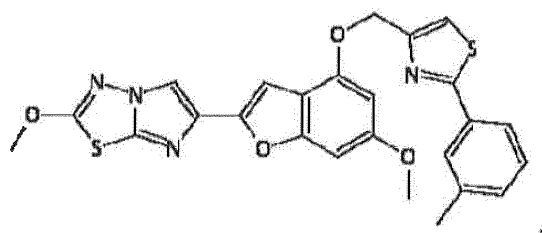
10





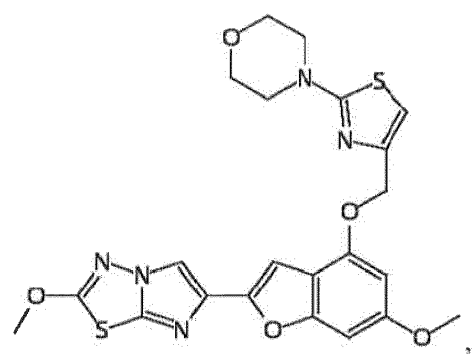
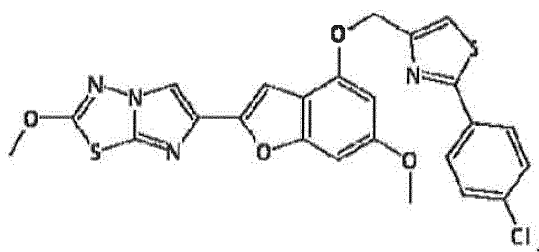
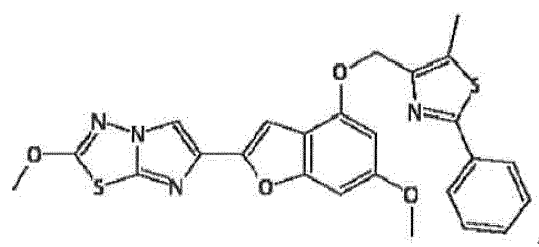
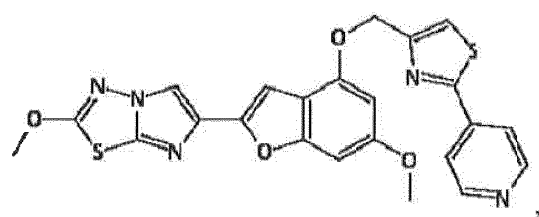
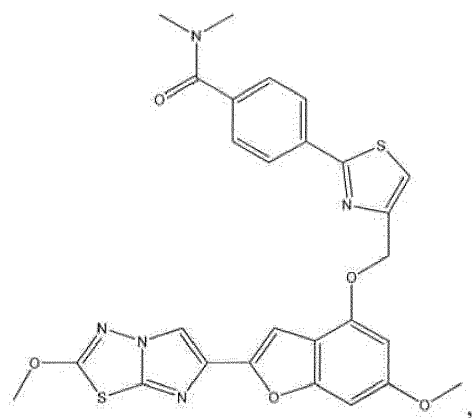
5

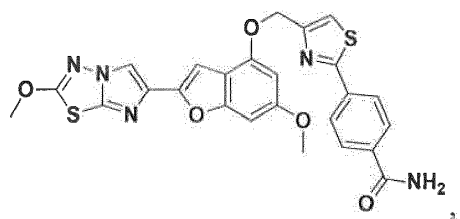
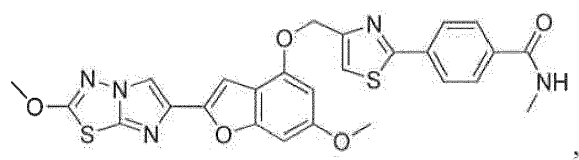
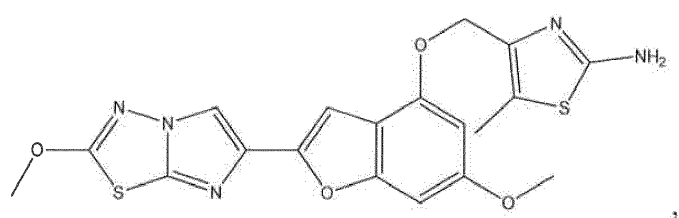
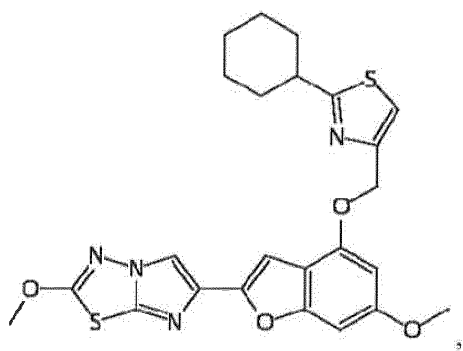
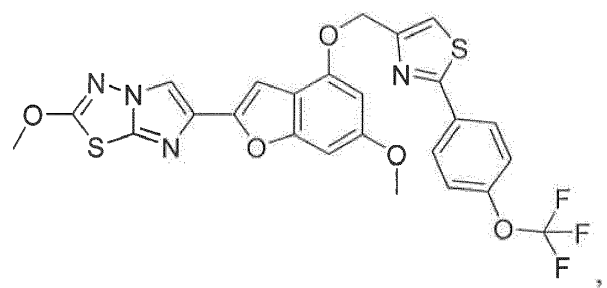
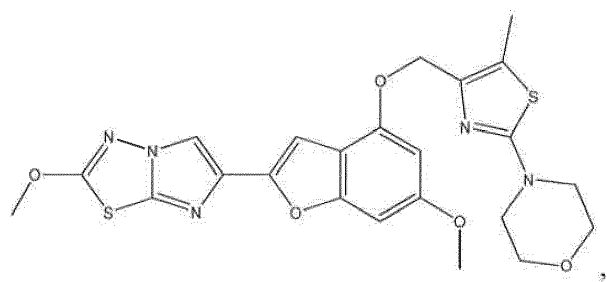
10



5

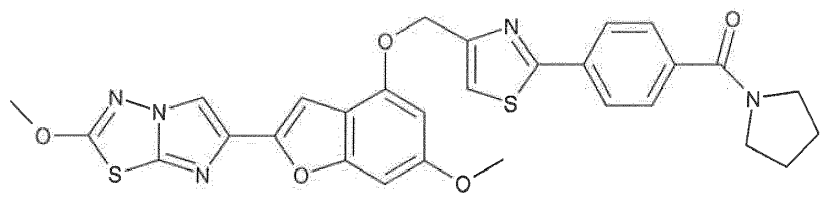
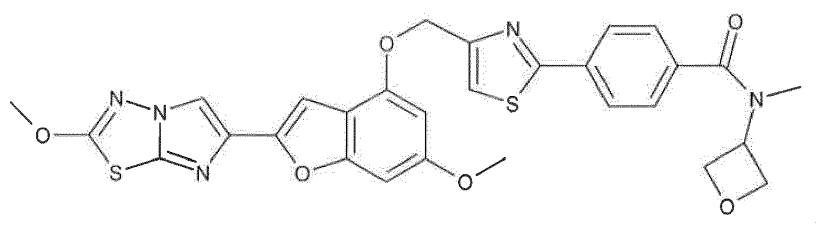
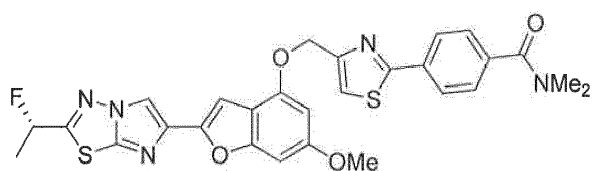
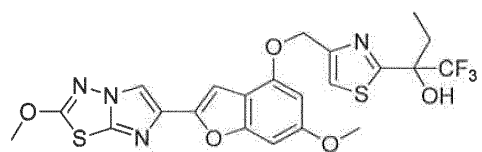
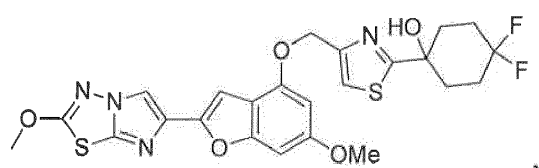
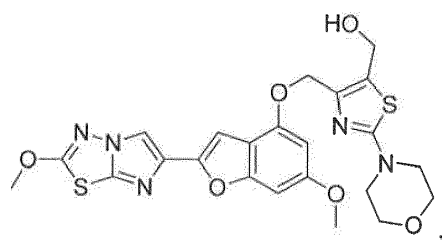
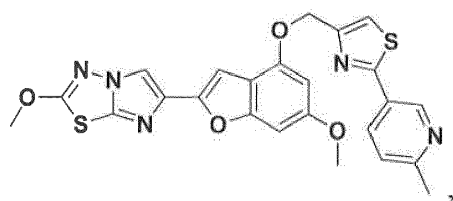
10





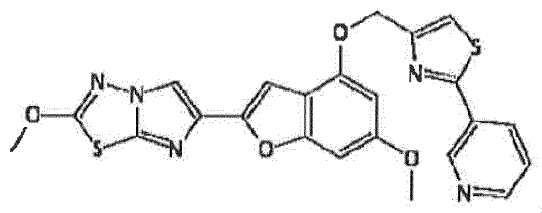
5

10



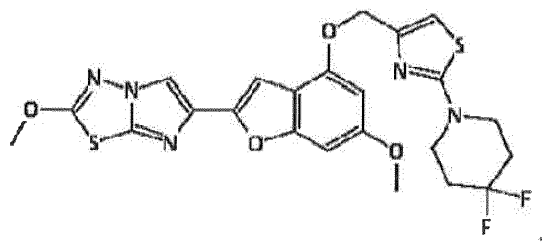
5

10



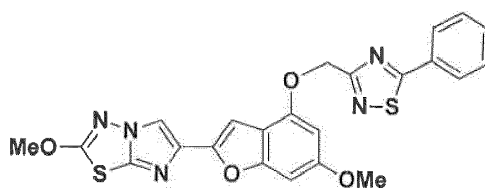
og

5



eller farmasøytisk akseptabelt salt derav.

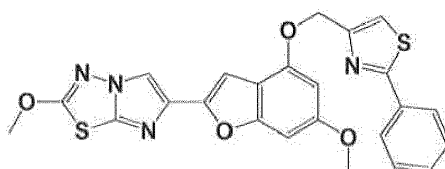
10 **18.** En forbindelse ifølge krav 17, med formel



eller farmasøytisk akseptabelt salt derav.

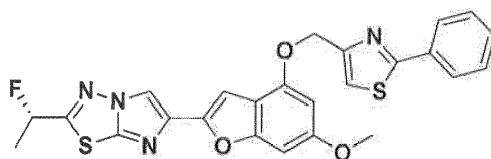
15

19. En forbindelse ifølge krav 17, med formel:



20 eller farmasøytisk akseptabelt salt derav.

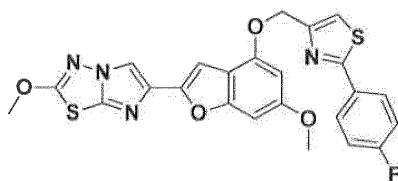
20. En forbindelse ifølge krav 17, med formel:



eller farmasøytisk akseptabelt salt derav.

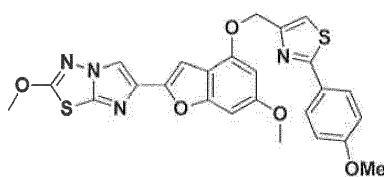
5

21. En forbindelse ifølge krav 17, med formel:



10 eller farmasøytisk akseptabelt salt derav.

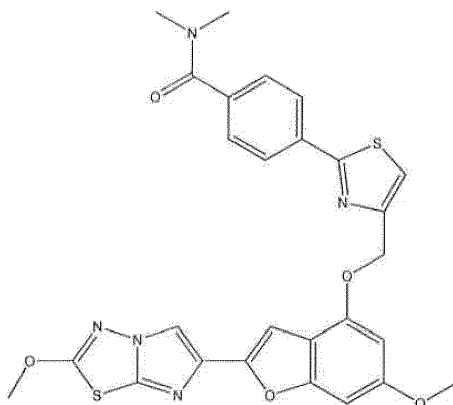
22. En forbindelse ifølge krav 17, med formel:



15

eller farmasøytisk akseptabelt salt derav.

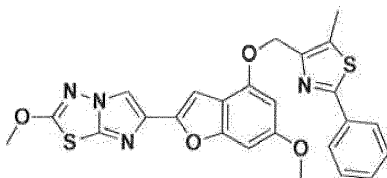
23. En forbindelse ifølge krav 17, med formel:



20

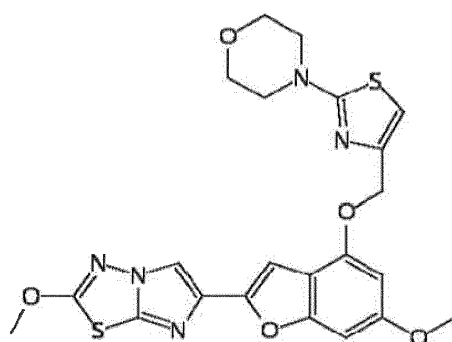
eller farmasøytisk akseptabelt salt derav.

24. En forbindelse ifølge krav 17, som har formelen



5 eller farmasøytisk akseptabelt salt derav.

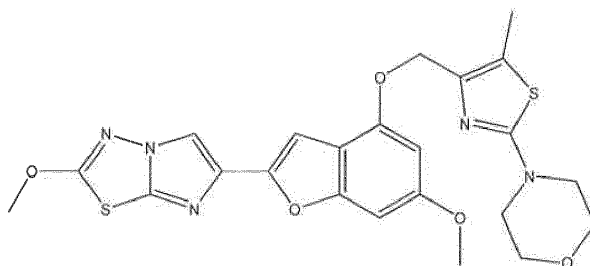
25. En forbindelse ifølge krav 17, med formel:



10

eller farmasøytisk akseptabelt salt derav.

26. En forbindelse ifølge krav 17, med formel

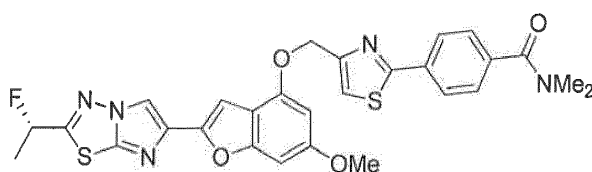


15

eller farmasøytisk akseptabelt salt derav.

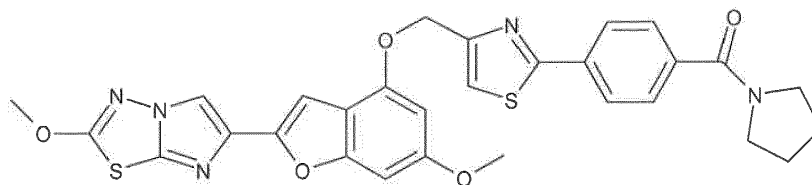
27. En forbindelse ifølge krav 17, med formel:

20



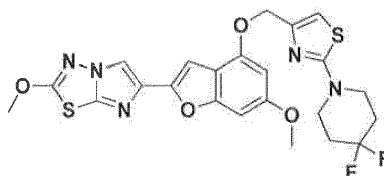
eller farmasøytisk akseptabelt salt derav.

28. En forbindelse ifølge krav 17, med formel:



eller farmasøytisk akseptabelt salt derav.

29. En forbindelse ifølge krav 17, med formel:



eller farmasøytisk akseptabelt salt derav.

- 15 **30.** En farmasøytisk blanding som omfatter en farmasøytisk akseptabel bærer og en forbindelse som definert i et hvilket som helst av kravene 1 til 29, eller stereoisomerer, tautomerer, farmasøytisk akseptable salter eller solvater derav, alene eller i kombinasjon med et annet terapeutisk middel.
- 20 **31.** Forbindelse som definert i et hvilket som helst av kravene 1 til 29, eller stereoisomerer, tautomerer, farmasøytisk akseptable salter eller solvater derav, for anvendelse i terapi, fortrinnsvis til anvendelse ved behandling av en tromboembolisk lidelse eller den primære eller sekundære profylakse av en tromboembolisk lidelse, hvor den tromboemboliske lidelse er valgt fra gruppen bestående av arterielle
- 25 kardiovaskulære tromboemboliske lidelser, venøse kardiovaskulære tromboemboliske lidelser, cerebrovaskulære tromboemboliske lidelser og tromboemboliske lidelser i hjertets kamre eller i den perifere sirkulasjon.