



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2861595 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 471/14 (2006.01)
A61K 31/4375 (2006.01)
A61K 31/519 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)
C07D 471/22 (2006.01)
C07D 491/22 (2006.01)
C07D 495/14 (2006.01)
C07D 498/14 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

- (21) Translation Published 2017.04.24
- (80) Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent 2016.12.21
- (86) European Application Nr. 13783125.1
- (86) European Filing Date 2013.06.12
- (87) The European Application's Publication Date 2015.04.22
- (30) Priority 2012.06.13, US, 201261659245 P
2012.08.21, US, 201261691463 P
2012.12.20, US, 201261740012 P
2013.03.08, US, 201361774841 P
- (84) Designated Contracting States: AL AT BE BG CH CY CZ DE DK EE ES FI FR GB
GR HR HU IE IS IT LI LT LU LV MC MK MT NL NO
PL PT RO RS SE SI SK SM TR
Designated Extension States: BA ME
- (73) Proprietor Incyte Holdings Corporation, 1801 Augustine Cut-Off, Wilmington, DE 19803, US-USA
- (72) Inventor WU, Liangxing, 3708 Eastview Lane, Wilmington, Delaware 19082, US-USA
ZHANG, Colin, 309 Daniel Drive, Ambler, Pennsylvania 19002, US-USA
HE, Chunhong, 40 Magnolia Way, Chadds Ford, Pennsylvania 19317, US-USA
SUN, Yaping, 610 Sunflower Circle, Hockessin, Delaware 19707, US-USA
LU, Liang, 605 Sunflower Circle, Hockessin, Delaware 19707, US-USA
QIAN, Ding-Quan, 10 Donald Preston Drive, Newark, Delaware 19702, US-USA
XU, Meizhong, 8 Fritze Court, Hockessin, Delaware 19707, US-USA
ZHUO, Jincong, 17 Forwood Drive, Garnet Valley, Pennsylvania 19060, US-USA
YAO, Wenqing, 45 Magnolia Way, Chadds Ford, Pennsylvania 19317, US-USA
- (74) Agent or Attorney Oslo Patentkontor AS, Postboks 7007 Majorstua, 0306 OSLO, Norge

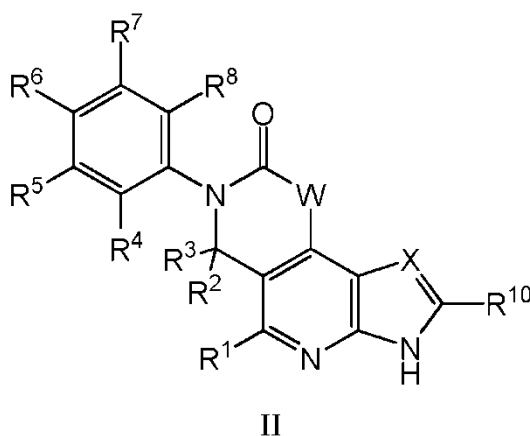
(54) Title **SUBSTITUTED TRICYCLIC COMPOUNDS AS FGFR INHIBITORS**

(56) References Cited: WO-A2-99/61444
WO-A2-2006/124731
WO-A2-2007/134259
GHORAB M M ET AL: "SYNTHESIS OF SOME SULFUR CONTAINING TETRAHYDROBENZOÄBÜTHIENO(PYRIDINES, QUINOLINES, OXAZINES AND PYRIMIDINES) AS POSSIBLE RADIOPROTECTIVE AND ANTINEOPLASTIC AGENTS",

PHOSPHORUS, SULFUR AND SILICON AND THE RELATED ELEMENTS, TAYLOR & FRANCIS INC, US, vol. 134/135, 1 January 1998 (1998-01-01), pages 57-76, XP008040341, ISSN: 1042-6507

EISSA: "Synthesis and evaluation of some surface active agents from long chain fatty amine", GRASAS Y ACEITES, CONSEJO SUPERIOR DE INVESTIGACIONES CIENTIFICAS (SPANISH NATIONAL RESEARCH COUNCIL), SPAIN, vol. 58, no. 4, 1 January 2007 (2007-01-01), pages 379-389, XP009175543, ISSN: 0017-3495

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

Patentkrav**1.** Forbindelse med formel II:

eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor:

5 W er NR^9 ;

X er CR^{15} eller N;

R^1 er H, $\text{NR}^{\text{A}}\text{R}^{\text{B}}$, halogen eller C_{1-3} -alkyl;

hver av R^2 og R^3 er uavhengig valgt fra H, CN, $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{\text{c}}\text{R}^{\text{d}}$ og C_{1-7} -alkyl, hvor nevnte C_{1-7} -alkyl valgfritt kan være substituert med 1, 2 eller 3 substituerter uavhengig
 10 valgt fra halogen, OR^{a} , CN, $\text{NR}^{\text{c}}\text{R}^{\text{d}}$ og $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{\text{c}}\text{R}^{\text{d}}$;

eller R^2 og R^3 danner sammen med karbonatomet som de er bundet til, en 3- til 7-leddet cykloalkylring eller en 4- til 7-leddet heterocykloalkylring, som hver valgfritt kan være substituert med 1, 2 eller 3 substituerter uavhengig valgt fra halogen, C_{1-6} -alkyl, C_{1-6} -halogenalkyl, CN, OR^{a} , SR^{a} , $\text{C}(\text{O})\text{R}^{\text{b}}$, $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{\text{c}}\text{R}^{\text{d}}$, $\text{C}(\text{O})\text{OR}^{\text{a}}$, $\text{OC}(\text{O})\text{R}^{\text{b}}$,
 15 $\text{OC}(\text{O})\text{NR}^{\text{c}}\text{R}^{\text{d}}$, $\text{NR}^{\text{c}}\text{R}^{\text{d}}$, $\text{NR}^{\text{c}}\text{C}(\text{O})\text{R}^{\text{b}}$ og $\text{NR}^{\text{c}}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{\text{a}}$;

R^4 , R^5 , R^6 , R^7 og R^8 er hver uavhengig valgt fra H, halogen, C_{1-6} -alkyl, C_{2-6} -alkenyl, C_{2-6} -alkynyl, C_{1-6} -halogenalkyl, C_{6-10} -aryl, C_{3-10} -cykloalkyl, 5- til 10-leddet heteroaryl, 4- til 10-leddet heterocykloalkyl, CN, $\text{OR}^{\text{a}1}$, $\text{SR}^{\text{a}1}$, $\text{C}(\text{O})\text{R}^{\text{b}1}$, $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{\text{c}1}\text{R}^{\text{d}1}$, $\text{C}(\text{O})\text{OR}^{\text{a}1}$, $\text{OC}(\text{O})\text{R}^{\text{b}1}$, $\text{OC}(\text{O})\text{NR}^{\text{c}1}\text{R}^{\text{d}1}$, $\text{NR}^{\text{c}1}\text{R}^{\text{d}1}$, $\text{NR}^{\text{c}1}\text{C}(\text{O})\text{R}^{\text{b}1}$, $\text{NR}^{\text{c}1}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{\text{a}1}$, $\text{NR}^{\text{c}1}\text{C}(\text{O})\text{NR}^{\text{c}1}\text{R}^{\text{d}1}$, $\text{C}(=\text{NR}^{\text{e}1})\text{R}^{\text{b}1}$, $\text{C}(=\text{NR}^{\text{e}1})\text{NR}^{\text{c}1}\text{R}^{\text{d}1}$, $\text{NR}^{\text{c}1}\text{C}(=\text{NR}^{\text{e}1})\text{NR}^{\text{c}1}\text{R}^{\text{d}1}$, $\text{NR}^{\text{c}1}\text{S}(\text{O})\text{R}^{\text{b}1}$,
 20 $\text{NR}^{\text{c}1}\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{\text{b}1}$, $\text{NR}^{\text{c}1}\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{\text{c}1}\text{R}^{\text{d}1}$, $\text{S}(\text{O})\text{R}^{\text{b}1}$, $\text{S}(\text{O})\text{NR}^{\text{c}1}\text{R}^{\text{d}1}$, $\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{\text{b}1}$ og $\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{\text{c}1}\text{R}^{\text{d}1}$;

hvor nevnte C₁₋₆-alkyl, C₂₋₆-alkenyl, C₂₋₆-alkynyl, C₆₋₁₀-aryl, C₃₋₁₀-cykloalkyl, 5- til 10-leddet heteroaryl og 4- til 10-leddet heterocykloalkyl hver valgfritt kan være substituert med 1, 2, 3, 4 eller 5 substituenten uavhengig valgt fra halogen, C₁₋₆-alkyl, C₂₋₆-alkenyl, C₂₋₆-alkynyl, C₁₋₆-halogenalkyl, CN, NO₂, OR^{a1}, SR^{a1}, C(O)R^{b1},
 5 C(O)NR^{c1}R^{d1}, C(O)OR^{a1}, OC(O)R^{b1}, OC(O)NR^{c1}R^{d1}, C(=NR^{e1})NR^{c1}R^{d1}, NR^{c1}C(=NR^{e1})-NR^{c1}R^{d1}, NR^{c1}R^{d1}, NR^{c1}C(O)R^{b1}, NR^{c1}C(O)OR^{a1}, NR^{c1}C(O)NR^{c1}R^{d1}, NR^{c1}S(O)R^{b1}, NR^{c1}S(O)₂R^{b1}, NR^{c1}S(O)₂NR^{c1}R^{d1}, S(O)R^{b1}, S(O)NR^{c1}R^{d1}, S(O)₂R^{b1} og S(O)₂NR^{c1}R^{d1};

R⁹ er H, C₁₋₆-alkyl, C₂₋₆-alkenyl, C₂₋₆-alkynyl, C₆₋₁₀-aryl, C₃₋₁₀-cykloalkyl, 5- til 10-leddet heteroaryl, 4- til 10-leddet heterocykloalkyl, C₆₋₁₀-aryl-C₁₋₄-alkyl, C₃₋₁₀-cykloalkyl-C₁₋₄-alkyl, (5- til 10-leddet heteroaryl)-C₁₋₄-alkyl eller (4- til 10-leddet heterocykloalkyl)-C₁₋₄-alkyl, hvor nevnte C₁₋₆-alkyl, C₂₋₆-alkenyl, C₂₋₆-alkynyl, C₆₋₁₀-aryl, C₃₋₁₀-cykloalkyl, 5- til 10-leddet heteroaryl, 4- til 10-leddet heterocykloalkyl, C₆₋₁₀-aryl-C₁₋₄-alkyl, C₃₋₁₀-cykloalkyl-C₁₋₄-alkyl, (5- til 10-leddet heteroaryl)-C₁₋₄-alkyl og (4- til 10-leddet heterocykloalkyl)-C₁₋₄-alkyl hver valgfritt kan være
 15 substituert med 1, 2, 3, 4 eller 5 substituenten uavhengig valgt fra R^{9a};

hver R^{9a} er uavhengig valgt fra Cy¹, halogen, C₁₋₆-alkyl, C₂₋₆-alkenyl, C₂₋₆-alkynyl, C₁₋₆-halogenalkyl, CN, NO₂, OR^{a2}, SR^{a2}, C(O)R^{b2}, C(O)NR^{c2}R^{d2}, C(O)OR^{a2}, OC(O)R^{b2}, OC(O)NR^{c2}R^{d2}, C(=NR^{e2})NR^{c2}R^{d2}, NR^{c2}C(=NR^{e2})NR^{c2}R^{d2}, NR^{c2}R^{d2}, NR^{c2}C(O)R^{b2}, NR^{c2}C(O)OR^{a2}, NR^{c2}C(O)NR^{c2}R^{d2}, NR^{c2}S(O)R^{b2}, NR^{c2}S(O)₂R^{b2}, NR^{c2}S(O)₂NR^{c2}R^{d2},
 20 S(O)R^{b2}, S(O)NR^{c2}R^{d2}, S(O)₂R^{b2} og S(O)₂NR^{c2}R^{d2}, hvor nevnte C₁₋₆-alkyl, C₂₋₆-alkenyl og C₂₋₆-alkynyl hver valgfritt kan være substituert med 1, 2 eller 3 substituenten uavhengig valgt fra Cy¹, halogen, CN, NO₂, OR^{a2}, SR^{a2}, C(O)R^{b2}, C(O)NR^{c2}R^{d2}, C(O)-OR^{a2}, OC(O)R^{b2}, OC(O)NR^{c2}R^{d2}, C(=NR^{e2})NR^{c2}R^{d2}, NR^{c2}C(=NR^{e2})NR^{c2}R^{d2}, NR^{c2}R^{d2}, NR^{c2}C(O)R^{b2}, NR^{c2}C(O)OR^{a2}, NR^{c2}C(O)NR^{c2}R^{d2}, NR^{c2}S(O)R^{b2}, NR^{c2}S(O)₂R^{b2},
 25 NR^{c2}S(O)₂NR^{c2}R^{d2}, S(O)R^{b2}, S(O)NR^{c2}R^{d2}, S(O)₂R^{b2} og S(O)₂NR^{c2}R^{d2};

R¹⁰ er valgt fra halogen, C₁₋₆-alkyl, C₂₋₆-alkenyl, C₂₋₆-alkynyl, C₁₋₆-halogenalkyl, C₆₋₁₀-aryl, C₃₋₁₀-cykloalkyl, 5- til 10-leddet heteroaryl, 4- til 10-leddet heterocykloalkyl, CN, NO₂, OR^{a3}, SR^{a3}, C(O)R^{b3}, C(O)NR^{c3}R^{d3}, C(O)OR^{a3}, OC(O)R^{b3}, OC(O)NR^{c3}R^{d3}, NR^{c3}R^{d3}, NR^{c3}C(O)R^{b3}, NR^{c3}C(O)OR^{a3}, NR^{c3}C(O)NR^{c3}R^{d3}, C(=NR^{e3})-R^{b3}, C(=NR^{e3})NR^{c3}R^{d3}, NR^{c3}C(=NR^{e3})NR^{c3}R^{d3}, NR^{c3}S(O)R^{b3}, NR^{c3}S(O)₂R^{b3}, NR^{c3}S(O)₂NR^{c3}R^{d3}, S(O)R^{b3}, S(O)NR^{c3}R^{d3}, S(O)₂R^{b3} og S(O)₂NR^{c3}R^{d3}; hvor nevnte C₁₋₆-alkyl, C₂₋₆-alkenyl, C₂₋₆-alkynyl, C₆₋₁₀-aryl, C₃₋₁₀-cykloalkyl, 5- til 10-leddet heteroaryl og 4- til 10-leddet heterocykloalkyl hver valgfritt kan være substituert med 1, 2, 3, 4 eller 5 substituenten uavhengig valgt fra R^{10a};

- R^{15} er valgt fra H, halogen, C_{1-6} -alkyl, C_{2-6} -alkenyl, C_{2-6} -alkynyl, C_{1-6} -halogenalkyl, C_{6-10} -aryl, C_{3-10} -cykloalkyl, 5- til 10-leddet heteroaryl, 4- til 10-leddet heterocykloalkyl, CN, NO_2 , OR^{a3} , SR^{a3} , $C(O)R^{b3}$, $C(O)NR^{c3}R^{d3}$, $C(O)OR^{a3}$, $OC(O)R^{b3}$, $OC(O)NR^{c3}R^{d3}$, $NR^{c3}R^{d3}$, $NR^{c3}C(O)R^{b3}$, $NR^{c3}C(O)OR^{a3}$, $NR^{c3}C(O)NR^{c3}R^{d3}$, $C(=NR^{e3})-$
 5 R^{b3} , $C(=NR^{e3})NR^{c3}R^{d3}$, $NR^{c3}C(=NR^{e3})NR^{c3}R^{d3}$, $NR^{c3}S(O)R^{b3}$, $NR^{c3}S(O)_2R^{b3}$, $NR^{c3}S(O)_2NR^{c3}R^{d3}$, $S(O)R^{b3}$, $S(O)NR^{c3}R^{d3}$, $S(O)_2R^{b3}$ og $S(O)_2NR^{c3}R^{d3}$; hvor nevnte C_{1-6} -alkyl, C_{2-6} -alkenyl, C_{2-6} -alkynyl, C_{6-10} -aryl, C_{3-10} -cykloalkyl, 5- til 10-leddet heteroaryl og 4- til 10-leddet heterocykloalkyl hver valgfritt kan være substituert med 1, 2, 3, 4 eller 5 substituent uavhengig valgt fra R^{10a} ;
- 10 hver R^{10a} er uavhengig valgt fra Cy^2 , halogen, C_{1-6} -alkyl, C_{2-6} -alkenyl, C_{2-6} -alkynyl, C_{1-6} -halogenalkyl, CN, NO_2 , OR^{a3} , SR^{a3} , $C(O)R^{b3}$, $C(O)NR^{c3}R^{d3}$, $C(O)OR^{a3}$, $OC(O)R^{b3}$, $OC(O)NR^{c3}R^{d3}$, $C(=NR^{e3})NR^{c3}R^{d3}$, $NR^{c3}C(=NR^{e3})NR^{c3}R^{d3}$, $NR^{c3}R^{d3}$, $NR^{c3}C(O)R^{b3}$, $NR^{c3}C(O)OR^{a3}$, $NR^{c3}C(O)NR^{c3}R^{d3}$, $NR^{c3}S(O)R^{b3}$, $NR^{c3}S(O)_2R^{b3}$, $NR^{c3}S(O)_2NR^{c3}R^{d3}$, $S(O)R^{b3}$, $S(O)NR^{c3}R^{d3}$, $S(O)_2R^{b3}$ og $S(O)_2NR^{c3}R^{d3}$, hvor nevnte C_{1-6} -alkyl, C_{2-6} -alkenyl
 15 og C_{2-6} -alkynyl hver valgfritt kan være substituert med 1, 2 eller 3 substituent uavhengig valgt fra Cy^2 , halogen, CN, NO_2 , OR^{a3} , SR^{a3} , $C(O)R^{b3}$, $C(O)NR^{c3}R^{d3}$, $C(O)OR^{a3}$, $OC(O)R^{b3}$, $OC(O)NR^{c3}R^{d3}$, $C(=NR^{e3})NR^{c3}R^{d3}$, $NR^{c3}C(=NR^{e3})NR^{c3}R^{d3}$, $NR^{c3}R^{d3}$, $NR^{c3}C(O)R^{b3}$, $NR^{c3}C(O)OR^{a3}$, $NR^{c3}C(O)NR^{c3}R^{d3}$, $NR^{c3}S(O)R^{b3}$, $NR^{c3}S(O)_2R^{b3}$, $NR^{c3}S(O)_2NR^{c3}R^{d3}$, $S(O)R^{b3}$, $S(O)NR^{c3}R^{d3}$, $S(O)_2R^{b3}$ og $S(O)_2NR^{c3}R^{d3}$;
- 20 R^A og R^B er hver uavhengig valgt fra H, C_{1-4} -alkyl, C_{1-4} -halogenalkyl, C_{2-4} -alkenyl, C_{2-4} -alkynyl, C_{6-10} -aryl, C_{3-10} -cykloalkyl, 5- til 10-leddet heteroaryl, 4- til 10-leddet heterocykloalkyl, C_{6-10} -aryl- C_{1-4} -alkyl, C_{3-10} -cykloalkyl- C_{1-4} -alkyl, (5- til 10-leddet heteroaryl)- C_{1-4} -alkyl eller (4- til 10-leddet heterocykloalkyl)- C_{1-4} -alkyl, hvor nevnte C_{1-4} -alkyl, C_{2-4} -alkenyl, C_{2-4} -alkynyl, C_{6-10} -aryl, C_{3-10} -cykloalkyl, 5- til 10-
 25 leddet heteroaryl, 4- til 10-leddet heterocykloalkyl, C_{6-10} -aryl- C_{1-4} -alkyl, C_{3-10} -cykloalkyl- C_{1-4} -alkyl, (5- til 10-leddet heteroaryl)- C_{1-4} -alkyl og (4- til 10-leddet heterocykloalkyl)- C_{1-4} -alkyl valgfritt kan være substituert med 1, 2 eller 3 substituent uavhengig valgt fra OH, CN, amino, halogen, C_{1-4} -alkyl, C_{1-4} -alkoksy, C_{1-4} -alkyltio, C_{1-4} -alkylamino, di(C_{1-4} -alkyl)amino, C_{1-4} -halogenalkyl og C_{1-4} -
 30 halogenalkoksy;

- Cy^1 og Cy^2 er hver uavhengig valgt fra C_{6-10} -aryl, C_{3-10} -cykloalkyl, 5- til 10-leddet heteroaryl, 4- til 10-leddet heterocykloalkyl, som hver valgfritt kan være substituert med 1, 2, 3, 4 eller 5 substituent uavhengig valgt fra halogen, C_{1-6} -alkyl, C_{2-6} -alkenyl, C_{2-6} -alkynyl, C_{1-6} -halogenalkyl, C_{6-10} -aryl, C_{3-10} -cykloalkyl, 5- til
 35 10-leddet heteroaryl, 3- til 10-leddet heterocykloalkyl, CN, NO_2 , OR^{a5} , SR^{a5} , $C(O)-$

R^{b5} , $C(O)NR^{c5}R^{d5}$, $C(O)OR^{a5}$, $OC(O)R^{b5}$, $OC(O)NR^{c5}R^{d5}$, $NR^{c5}R^{d5}$, $NR^{c5}C(O)R^{b5}$,
 $NR^{c5}C(O)OR^{a5}$, $NR^{c5}C(O)NR^{c5}R^{d5}$, $C(=NR^{e5})R^{b5}$, $C(=NR^{e5})NR^{c5}R^{d5}$, $NR^{c5}C(=NR^{e5})-$
 $NR^{c5}R^{d5}$, $NR^{c5}S(O)R^{b5}$, $NR^{c5}S(O)_2R^{b5}$, $NR^{c5}S(O)_2NR^{c5}R^{d5}$, $S(O)R^{b5}$, $S(O)NR^{c5}R^{d5}$,
 $S(O)_2R^{b5}$ og $S(O)_2NR^{c5}R^{d5}$; hvor nevnte C_{1-6} -alkyl, C_{2-6} -alkenyl, C_{2-6} -alkynyl, C_{6-10} -
 5 aryl, C_{3-10} -cykloalkyl, 5- til 10-leddet heteroaryl og 4- til 10-leddet heterocykloalkyl
 hver valgfritt kan være substituert med 1, 2, 3, 4 eller 5 substituenten uavhengig
 valgt fra halogen, C_{1-6} -alkyl, C_{2-6} -alkenyl, C_{2-6} -alkynyl, C_{1-6} -halogenalkyl, CN, NO_2 ,
 OR^{a5} , SR^{a5} , $C(O)R^{b5}$, $C(O)NR^{c5}R^{d5}$, $C(O)OR^{a5}$, $OC(O)R^{b5}$, $OC(O)NR^{c5}R^{d5}$, $C(=NR^{e5})-$
 $NR^{c5}R^{d5}$, $NR^{c5}C(=NR^{e5})NR^{c5}R^{d5}$, $NR^{c5}R^{d5}$, $NR^{c5}C(O)R^{b5}$, $NR^{c5}C(O)OR^{a5}$, $NR^{c5}C(O)-$
 10 $NR^{c5}R^{d5}$, $NR^{c5}S(O)R^{b5}$, $NR^{c5}S(O)_2R^{b5}$, $NR^{c5}S(O)_2NR^{c5}R^{d5}$, $S(O)R^{b5}$, $S(O)NR^{c5}R^{d5}$,
 $S(O)_2R^{b5}$ og $S(O)_2NR^{c5}R^{d5}$;

hver R^a , R^b , R^c , R^d , R^{a1} , R^{b1} , R^{c1} , R^{d1} , R^{a2} , R^{b2} , R^{c2} , R^{d2} , R^{a3} , R^{b3} , R^{c3} , R^{d3} , R^{a5} , R^{b5} , R^{c5}
 og R^{d5} er uavhengig valgt fra H, C_{1-6} -alkyl, C_{1-4} -halogenalkyl, C_{2-6} -alkenyl, C_{2-6} -
 alkynyl, C_{6-10} -aryl, C_{3-10} -cykloalkyl, 5- til 10-leddet heteroaryl, 4- til 10-leddet
 15 heterocykloalkyl, C_{6-10} -aryl- C_{1-4} -alkyl, C_{3-10} -cykloalkyl- C_{1-4} -alkyl, (5- til 10-leddet
 heteroaryl)- C_{1-4} -alkyl eller (4- til 10-leddet heterocykloalkyl)- C_{1-4} -alkyl, hvor
 nevnte C_{1-6} -alkyl, C_{2-6} -alkenyl, C_{2-6} -alkynyl, C_{6-10} -aryl, C_{3-10} -cykloalkyl, 5- til 10-
 leddet heteroaryl, 4- til 10-leddet heterocykloalkyl, C_{6-10} -aryl- C_{1-4} -alkyl, C_{3-10} -
 cykloalkyl- C_{1-4} -alkyl, (5- til 10-leddet heteroaryl)- C_{1-4} -alkyl og (4- til 10-leddet
 20 heterocykloalkyl)- C_{1-4} -alkyl valgfritt kan være substituert med 1, 2, 3, 4 eller 5
 substituenten uavhengig valgt fra C_{1-4} -alkyl, C_{1-4} -halogenalkyl, halogen, CN, OR^{a6} ,
 SR^{a6} , $C(O)R^{b6}$, $C(O)NR^{c6}R^{d6}$, $C(O)OR^{a6}$, $OC(O)R^{b6}$, $OC(O)NR^{c6}R^{d6}$, $NR^{c6}R^{d6}$, $NR^{c6}C(O)-$
 R^{b6} , $NR^{c6}C(O)NR^{c6}R^{d6}$, $NR^{c6}C(O)OR^{a6}$, $C(=NR^{e6})NR^{c6}R^{d6}$, $NR^{c6}C(=NR^{e6})NR^{c6}R^{d6}$, $S(O)-$
 R^{b6} , $S(O)NR^{c6}R^{d6}$, $S(O)_2R^{b6}$, $NR^{c6}S(O)_2R^{b6}$, $NR^{c6}S(O)_2NR^{c6}R^{d6}$ og $S(O)_2NR^{c6}R^{d6}$;

25 eller hvilket som helst R^c og R^d danner sammen med N-atomet som de er bundet
 til, en 4-, 5-, 6- eller 7-leddet heterocykloalkylgruppe som valgfritt kan være
 substituert med 1, 2 eller 3 substituenten uavhengig valgt fra C_{1-6} -alkyl, C_{3-7} -
 cykloalkyl, 4- til 7-leddet heterocykloalkyl, C_{6-10} -aryl, 5- til 6-leddet heteroaryl, C_{1-6} -
 halogenalkyl, halogen, CN, OR^{a6} , SR^{a6} , $C(O)R^{b6}$, $C(O)NR^{c6}R^{d6}$, $C(O)OR^{a6}$, $OC(O)R^{b6}$,
 30 $OC(O)NR^{c6}R^{d6}$, $NR^{c6}R^{d6}$, $NR^{c6}C(O)R^{b6}$, $NR^{c6}C(O)NR^{c6}R^{d6}$, $NR^{c6}C(O)OR^{a6}$, $C(=NR^{e6})-$
 $NR^{c6}R^{d6}$, $NR^{c6}C(=NR^{e6})NR^{c6}R^{d6}$, $S(O)R^{b6}$, $S(O)NR^{c6}R^{d6}$, $S(O)_2R^{b6}$, $NR^{c6}S(O)_2R^{b6}$,
 $NR^{c6}S(O)_2NR^{c6}R^{d6}$ og $S(O)_2NR^{c6}R^{d6}$, hvor nevnte C_{1-6} -alkyl, C_{3-7} -cykloalkyl, 4- til 7-
 leddet heterocykloalkyl, C_{6-10} -aryl og 5- til 6-leddet heteroaryl valgfritt kan være
 substituert med 1, 2 eller 3 substituenten uavhengig valgt fra halogen, CN, OR^{a6} ,
 35 SR^{a6} , $C(O)R^{b6}$, $C(O)NR^{c6}R^{d6}$, $C(O)OR^{a6}$, $OC(O)R^{b6}$, $OC(O)NR^{c6}R^{d6}$, $NR^{c6}R^{d6}$, $NR^{c6}C(O)-$

R^{b6} , $NR^{c6}C(O)NR^{c6}R^{d6}$, $NR^{c6}C(O)OR^{a6}$, $C(=NR^{e6})NR^{c6}R^{d6}$, $NR^{c6}C(=NR^{e6})NR^{c6}R^{d6}$, $S(O)-R^{b6}$, $S(O)NR^{c6}R^{d6}$, $S(O)_2R^{b6}$, $NR^{c6}S(O)_2R^{b6}$, $NR^{c6}S(O)_2NR^{c6}R^{d6}$ og $S(O)_2NR^{c6}R^{d6}$;

eller hvilket som helst R^{c1} og R^{d1} danner sammen med N-atomet som de er bundet til, en 4-, 5-, 6- eller 7-leddet heterocykloalkylgruppe som valgfritt kan være

5 substituert med 1, 2 eller 3 substituenten uavhengig valgt fra C_{1-6} -alkyl, C_{3-7} -cykloalkyl, 4- til 7-leddet heterocykloalkyl, C_{6-10} -aryl, 5- til 6-leddet heteroaryl, C_{1-6} -halogenalkyl, halogen, CN, OR^{a6} , SR^{a6} , $C(O)R^{b6}$, $C(O)NR^{c6}R^{d6}$, $C(O)OR^{a6}$, $OC(O)R^{b6}$, $OC(O)NR^{c6}R^{d6}$, $NR^{c6}R^{d6}$, $NR^{c6}C(O)R^{b6}$, $NR^{c6}C(O)NR^{c6}R^{d6}$, $NR^{c6}C(O)OR^{a6}$, $C(=NR^{e6})-NR^{c6}R^{d6}$, $NR^{c6}C(=NR^{e6})NR^{c6}R^{d6}$, $S(O)R^{b6}$, $S(O)NR^{c6}R^{d6}$, $S(O)_2R^{b6}$, $NR^{c6}S(O)_2R^{b6}$,

10 $NR^{c6}S(O)_2NR^{c6}R^{d6}$ og $S(O)_2NR^{c6}R^{d6}$, hvor nevnte C_{1-6} -alkyl, C_{3-7} -cykloalkyl, 4- til 7-leddet heterocykloalkyl, C_{6-10} -aryl og 5- til 6-leddet heteroaryl valgfritt kan være substituert med 1, 2 eller 3 substituenten uavhengig valgt fra halogen, CN, OR^{a6} , SR^{a6} , $C(O)R^{b6}$, $C(O)NR^{c6}R^{d6}$, $C(O)OR^{a6}$, $OC(O)R^{b6}$, $OC(O)NR^{c6}R^{d6}$, $NR^{c6}R^{d6}$, $NR^{c6}C(O)-R^{b6}$, $NR^{c6}C(O)NR^{c6}R^{d6}$, $NR^{c6}C(O)OR^{a6}$, $C(=NR^{e6})NR^{c6}R^{d6}$, $NR^{c6}C(=NR^{e6})NR^{c6}R^{d6}$, $S(O)-R^{b6}$, $S(O)NR^{c6}R^{d6}$, $S(O)_2R^{b6}$, $NR^{c6}S(O)_2R^{b6}$, $NR^{c6}S(O)_2NR^{c6}R^{d6}$ og $S(O)_2NR^{c6}R^{d6}$;

15

eller hvilket som helst R^{c2} og R^{d2} danner sammen med N-atomet som de er bundet til, en 4-, 5-, 6- eller 7-leddet heterocykloalkylgruppe som valgfritt kan være substituert med 1, 2 eller 3 substituenten uavhengig valgt fra C_{1-6} -alkyl, C_{3-7} -cykloalkyl, 4- til 7-leddet heterocykloalkyl, C_{6-10} -aryl og 5- til 6-leddet heteroaryl,

20 C_{1-6} -halogenalkyl, halogen, CN, OR^{a6} , SR^{a6} , $C(O)R^{b6}$, $C(O)NR^{c6}R^{d6}$, $C(O)OR^{a6}$, $OC(O)R^{b6}$, $OC(O)NR^{c6}R^{d6}$, $NR^{c6}R^{d6}$, $NR^{c6}C(O)R^{b6}$, $NR^{c6}C(O)NR^{c6}R^{d6}$, $NR^{c6}C(O)OR^{a6}$, $C(=NR^{e6})NR^{c6}R^{d6}$, $NR^{c6}C(=NR^{e6})NR^{c6}R^{d6}$, $S(O)R^{b6}$, $S(O)NR^{c6}R^{d6}$, $S(O)_2R^{b6}$, $NR^{c6}S(O)_2R^{b6}$, $NR^{c6}S(O)_2NR^{c6}R^{d6}$ og $S(O)_2NR^{c6}R^{d6}$, hvor nevnte C_{1-6} -alkyl, C_{3-7} -cykloalkyl, 4- til 7-leddet heterocykloalkyl, C_{6-10} -aryl og 5- til 6-leddet heteroaryl

25 valgfritt kan være substituert med 1, 2 eller 3 substituenten uavhengig valgt fra halogen, CN, OR^{a6} , SR^{a6} , $C(O)R^{b6}$, $C(O)NR^{c6}R^{d6}$, $C(O)OR^{a6}$, $OC(O)R^{b6}$, $OC(O)NR^{c6}R^{d6}$, $NR^{c6}R^{d6}$, $NR^{c6}C(O)R^{b6}$, $NR^{c6}C(O)NR^{c6}R^{d6}$, $NR^{c6}C(O)OR^{a6}$, $C(=NR^{e6})NR^{c6}R^{d6}$, $NR^{c6}C(=NR^{e6})NR^{c6}R^{d6}$, $S(O)R^{b6}$, $S(O)NR^{c6}R^{d6}$, $S(O)_2R^{b6}$, $NR^{c6}S(O)_2R^{b6}$, $NR^{c6}S(O)_2NR^{c6}R^{d6}$ og $S(O)_2NR^{c6}R^{d6}$;

30 eller hvilket som helst R^{c3} og R^{d3} danner sammen med N-atomet som de er bundet til, en 4-, 5-, 6- eller 7-leddet heterocykloalkylgruppe som valgfritt kan være substituert med 1, 2 eller 3 substituenten uavhengig valgt fra C_{1-6} -alkyl, C_{3-7} -cykloalkyl, 4- til 7-leddet heterocykloalkyl, C_{6-10} -aryl, 5- til 6-leddet heteroaryl, C_{1-6} -halogenalkyl, halogen, CN, OR^{a6} , SR^{a6} , $C(O)R^{b6}$, $C(O)NR^{c6}R^{d6}$, $C(O)OR^{a6}$, $OC(O)R^{b6}$,

35 $OC(O)NR^{c6}R^{d6}$, $NR^{c6}R^{d6}$, $NR^{c6}C(O)R^{b6}$, $NR^{c6}C(O)NR^{c6}R^{d6}$, $NR^{c6}C(O)OR^{a6}$, $C(=NR^{e6})-$

$\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$, $\text{NR}^{\text{c6}}\text{C}(=\text{NR}^{\text{e6}})\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$, $\text{S}(\text{O})\text{R}^{\text{b6}}$, $\text{S}(\text{O})\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$, $\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{\text{b6}}$, $\text{NR}^{\text{c6}}\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{\text{b6}}$,
 $\text{NR}^{\text{c6}}\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$ og $\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$, hvor nevnte C_{1-6} -alkyl, C_{3-7} -cykloalkyl, 4- til 7-
 leddet heterocykloalkyl, C_{6-10} -aryl og 5- til 6-leddet heteroaryl valgfritt kan være
 substituert med 1, 2 eller 3 substituenten uavhengig valgt fra halogen, CN , OR^{a6} ,
 5 SR^{a6} , $\text{C}(\text{O})\text{R}^{\text{b6}}$, $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$, $\text{C}(\text{O})\text{OR}^{\text{a6}}$, $\text{OC}(\text{O})\text{R}^{\text{b6}}$, $\text{OC}(\text{O})\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$, $\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$, $\text{NR}^{\text{c6}}\text{C}(\text{O})\text{R}^{\text{b6}}$,
 $\text{NR}^{\text{c6}}\text{C}(\text{O})\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$, $\text{NR}^{\text{c6}}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{\text{a6}}$, $\text{C}(=\text{NR}^{\text{e6}})\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$, $\text{NR}^{\text{c6}}\text{C}(=\text{NR}^{\text{e6}})\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$, $\text{S}(\text{O})\text{R}^{\text{b6}}$,
 $\text{S}(\text{O})\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$, $\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{\text{b6}}$, $\text{NR}^{\text{c6}}\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{\text{b6}}$, $\text{NR}^{\text{c6}}\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$ og $\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$;

eller hvilket som helst R^{c5} og R^{d5} danner sammen med N-atomet som de er bundet
 til, en 4-, 5-, 6- eller 7-leddet heterocykloalkylgruppe som valgfritt kan være
 10 substituert med 1, 2 eller 3 substituenten uavhengig valgt fra C_{1-6} -alkyl, C_{3-7} -
 cykloalkyl, 4- til 7-leddet heterocykloalkyl, C_{6-10} -aryl, 5- til 6-leddet heteroaryl, C_{1-6} -
 halogenalkyl, halogen, CN , OR^{a6} , SR^{a6} , $\text{C}(\text{O})\text{R}^{\text{b6}}$, $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$, $\text{C}(\text{O})\text{OR}^{\text{a6}}$, $\text{OC}(\text{O})\text{R}^{\text{b6}}$,
 $\text{OC}(\text{O})\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$, $\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$, $\text{NR}^{\text{c6}}\text{C}(\text{O})\text{R}^{\text{b6}}$, $\text{NR}^{\text{c6}}\text{C}(\text{O})\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$, $\text{NR}^{\text{c6}}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{\text{a6}}$, $\text{C}(=\text{NR}^{\text{e6}})\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$,
 $\text{NR}^{\text{c6}}\text{C}(=\text{NR}^{\text{e6}})\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$, $\text{S}(\text{O})\text{R}^{\text{b6}}$, $\text{S}(\text{O})\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$, $\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{\text{b6}}$, $\text{NR}^{\text{c6}}\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{\text{b6}}$,
 15 $\text{NR}^{\text{c6}}\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$ og $\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$, hvor nevnte C_{1-6} -alkyl, C_{3-7} -cykloalkyl, 4- til 7-
 leddet heterocykloalkyl, C_{6-10} -aryl og 5- til 6-leddet heteroaryl valgfritt kan være
 substituert med 1, 2 eller 3 substituenten uavhengig valgt fra halogen, CN , OR^{a6} ,
 SR^{a6} , $\text{C}(\text{O})\text{R}^{\text{b6}}$, $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$, $\text{C}(\text{O})\text{OR}^{\text{a6}}$, $\text{OC}(\text{O})\text{R}^{\text{b6}}$, $\text{OC}(\text{O})\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$, $\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$, $\text{NR}^{\text{c6}}\text{C}(\text{O})\text{R}^{\text{b6}}$,
 $\text{NR}^{\text{c6}}\text{C}(\text{O})\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$, $\text{NR}^{\text{c6}}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{\text{a6}}$, $\text{C}(=\text{NR}^{\text{e6}})\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$, $\text{NR}^{\text{c6}}\text{C}(=\text{NR}^{\text{e6}})\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$, $\text{S}(\text{O})\text{R}^{\text{b6}}$,
 20 $\text{S}(\text{O})\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$, $\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{\text{b6}}$, $\text{NR}^{\text{c6}}\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{\text{b6}}$, $\text{NR}^{\text{c6}}\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$ og $\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$;

hver R^{e1} , R^{e2} , R^{e3} og R^{e5} er uavhengig valgt fra H , C_{1-4} -alkyl, CN , OR^{a6} , SR^{b6} ,
 $\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{\text{b6}}$, $\text{C}(\text{O})\text{R}^{\text{b6}}$, $\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$ og $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{\text{c6}}\text{R}^{\text{d6}}$;

hver R^{a6} , R^{b6} , R^{c6} og R^{d6} er uavhengig valgt fra H , C_{1-4} -alkyl, C_{1-4} -halogenalkyl, C_{2-4} -
 alkenyl og C_{2-4} -alkynyl, hvor nevnte C_{1-4} -alkyl, C_{2-4} -alkenyl og C_{2-4} -alkynyl valgfritt
 25 kan være substituert med 1, 2 eller 3 substituenten uavhengig valgt fra OH , CN ,
 amino, halogen, C_{1-4} -alkyl, C_{1-4} -alkoksy, C_{1-4} -alkyltio, C_{1-4} -alkylamino, $\text{di}(\text{C}_{1-4}$ -
 alkyl)amino, C_{1-4} -halogenalkyl og C_{1-4} -halogenalkoksy;

eller hvilket som helst R^{c6} og R^{d6} danner sammen med N-atomet som de er bundet
 til, en 4-, 5-, 6- eller 7-leddet heterocykloalkylgruppe som valgfritt kan være
 30 substituert med 1, 2 eller 3 substituenten uavhengig valgt fra OH , CN , amino,
 halogen, C_{1-6} -alkyl, C_{1-4} -alkoksy, C_{1-4} -alkyltio, C_{1-4} -alkylamino, $\text{di}(\text{C}_{1-4}$ -alkyl)amino,
 C_{1-4} -halogenalkyl og C_{1-4} -halogenalkoksy; og

hver R^{e6} er uavhengig valgt fra H , C_{1-4} -alkyl og CN .

2. Forbindelse ifølge krav 1 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor:

- a) R^9 er H, C_{1-6} -alkyl, C_{6-10} -aryl, C_{3-10} -cykloalkyl, 5- til 10-leddet heteroaryl, 4- til 10-leddet heterocykloalkyl, C_{6-10} -aryl- C_{1-4} -alkyl, C_{3-10} -cykloalkyl- C_{1-4} -alkyl, (5- til 10-leddet heteroaryl)- C_{1-4} -alkyl eller (4- til 10-leddet heterocykloalkyl)- C_{1-4} -alkyl,
 5 hvor nevnte C_{1-6} -alkyl, C_{6-10} -aryl, C_{3-10} -cykloalkyl, 5- til 10-leddet heteroaryl, 4- til 10-leddet heterocykloalkyl, C_{6-10} -aryl- C_{1-4} -alkyl, C_{3-10} -cykloalkyl- C_{1-4} -alkyl, (5- til 10-leddet heteroaryl)- C_{1-4} -alkyl og (4- til 10-leddet heterocykloalkyl)- C_{1-4} -alkyl hver valgfritt kan være substituert med R^{9a} ; eller
- b) R^9 er H, C_{1-6} -alkyl, C_{3-10} -cykloalkyl, 4- til 10-leddet heterocykloalkyl, C_{6-10} -
 10 aryl- C_{1-4} -alkyl eller C_{3-10} -cykloalkyl- C_{1-4} -alkyl; eller
- c) R^9 er C_{1-6} -alkyl; eller
- d) R^9 er metyl.

3. Forbindelse ifølge krav 1 eller 2 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor hver av R^1 , R^2 og R^3 er H.

15 **4.** Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor:

- a) R^4 , R^5 , R^6 , R^7 og R^8 er hver uavhengig valgt fra H, halogen, C_{1-6} -alkyl, C_{1-6} -halogenalkyl, CN og OR^{a1} ; eller
- b) R^4 , R^5 , R^6 , R^7 og R^8 er hver uavhengig valgt fra H, halogen og metoksy; eller
- 20 c) både R^5 og R^7 er metoksy og R^4 , R^6 og R^8 er hver uavhengig valgt fra H og halogen; eller
- d) R^4 er halogen, R^5 er metoksy, R^6 er H, R^7 er metoksy og R^8 er halogen.

5. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor:

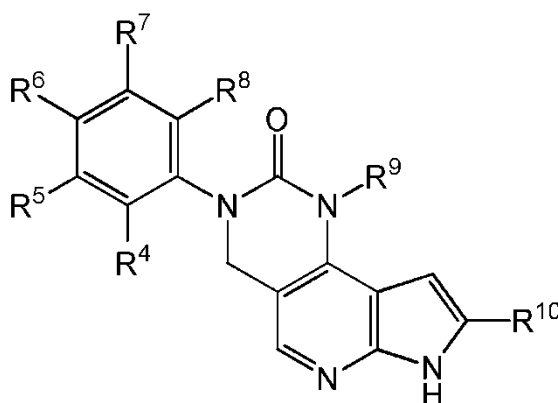
- 25 a) X er CR^{15} ; eller

b) X er CH.

6. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor R^{15} er H eller 5- til 10-leddet heteroaryl som valgfritt kan være substituert med C_{1-6} -alkyl.

5 **7.** Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav hvor R^{10} er C_{1-6} -alkyl som valgfritt kan være substituert med 4- til 7-leddet heterocykloalkyl hvor nevnte 4- til 7-leddede heterocykloalkyl er valgt fra morfolinyl, piperazinyl, piperidinyl, pyrrolidinyl, tetrahydrofuranyl og azetidinyll og hvor nevnte 4- til 7-leddede heterocykloalkyl
10 valgfritt kan være substituert med 1, 2 eller 3 substituenten uavhengig valgt fra halogen, C_{1-6} -alkyl, C_{1-6} -halogenalkyl, CN, OR^{a5} , $C(O)R^{b5}$, $C(O)NR^{c5}R^{d5}$, $C(O)OR^{a5}$, $OC(O)R^{b5}$, $NR^{c5}R^{d5}$ og $NR^{c5}C(O)R^{b5}$.

8. Forbindelse ifølge krav 1 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, med formel IIa:



IIa.

15

9. Forbindelse ifølge krav 8 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor R^4 er halogen, R^5 er metoksy, R^6 er H, R^7 er metoksy og R^8 er halogen.

10. Forbindelse ifølge krav 8 eller 9 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor R^9 er C_{1-6} -alkyl.

20 **11.** Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 8 til 10 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav hvor R^{10} er C_{1-6} -alkyl som valgfritt kan være substituert med 4- til 7-leddet heterocykloalkyl hvor nevnte 4- til 7-leddede heterocykloalkyl er valgt fra morfolinyl, piperazinyl, piperidinyl, pyrrolidinyl,

tetrahydrofuranyl og azetidinyll og hvor nevnte 4- til 7-leddede heterocykloalkyl valgfritt kan være substituert med 1, 2 eller 3 substituenten uavhengig valgt fra halogen, C₁₋₆-alkyl, C₁₋₆-halogenalkyl, CN, OR^{a5}, C(O)R^{b5}, C(O)NR^{c5}R^{d5}, C(O)OR^{a5}, OC(O)R^{b5}, NR^{c5}R^{d5} og NR^{c5}C(O)R^{b5}.

5 **12.** Forbindelse ifølge krav 1, som er valgt fra:

3-(3,5-Dimetoksyfenyl)-1-metyl-8-(1-metyl-1H-pyrazol-4-yl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(3,5-Dimetoksyfenyl)-N,1-dimetyl-2-okso-2,3,4,7-tetrahydro-1H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-8-karboksamid;

10 3-(2-Klor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-metyl-8-(1-metyl-1H-pyrazol-4-yl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(2-Klor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-[1-(2-hydroksyetyl)-1H-pyrazol-4-yl]-1-metyl-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

15 3-(2-Klor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-metyl-8-(1-metyl-1H-pyrazol-5-yl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(2-Klor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-metyl-2-okso-2,3,4,7-tetrahydro-1H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-8-karbonitril;

3-(3,5-Dimetoksyfenyl)-1-metyl-8-(1-metyl-1,2,3,6-tetrahydropyridin-4-yl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

20 3-(3,5-Dimetoksyfenyl)-1-metyl-8-(1-metyl-piperidin-4-yl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(3,5-Dimetoksyfenyl)-N,N,1-trimetyl-2-okso-2,3,4,7-tetrahydro-1H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-8-karboksamid;

25 3-(3,5-Dimetoksyfenyl)-8-[(3-hydroksyazetidin-1-yl)karbonyl]-1-metyl-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(3,5-Dimetoksyfenyl)-8-[(3-hydroksypyrrolidin-1-yl)karbonyl]-1-metyl-
1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(3,5-Dimetoksyfenyl)-1-metyl-8-[(4-metylpiperazin-1-yl)karbonyl]-1,3,4,7-
tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

- 5 3-(2-Klor-3,5-dimetoksyfenyl)-N,1-dimetyl-2-okso-2,3,4,7-tetrahydro-1H-
pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-8-karboksamid;

3-(2-Klor-3,5-dimetoksyfenyl)-N,N,1-trimetyl-2-okso-2,3,4,7-tetrahydro-1H-
pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-8-karboksamid;

- 10 3-(2-Klor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-[(3-hydroksyazetidin-1-yl)karbonyl]-1-metyl-
1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(2-Klor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-metyl-8-[(4-metylpiperazin-1-yl)karbonyl]-
1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

N-Cyklopropyl-3-(2-fluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-metyl-2-okso-2,3,4,7-
tetrahydro-1H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-8-karboksamid;

- 15 3-(2-Fluor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-[(3-hydroksyazetidin-1-yl)karbonyl]-1-metyl-
1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

1-{[3-(2-Fluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-metyl-2-okso-2,3,4,7-tetrahydro-1H-
pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-8-yl]karbonyl}pyrrolidin-3-karbonitril;

- 20 3-(2-Fluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-metyl-8-[(4-metylpiperazin-1-yl)karbonyl]-
1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(2-Fluor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-[(3-hydroksypiperidin-1-yl)karbonyl]-1-metyl-
1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(2-Fluor-3,5-dimetoksyfenyl)-N,N,1-trimetyl-2-okso-2,3,4,7-tetrahydro-1H-
pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-8-karboksamid;

- 25 3-(2,6-Difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-N,N,1-trimetyl-2-okso-2,3,4,7-tetrahydro-
1H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-8-karboksamid;

eller et farmasøytisk akseptabelt salt av hvilken som helst av de ovennevnte.

13. Forbindelse ifølge krav 1:

a) valgt fra:

3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-metyl-8-(tetrahydro-2H-pyran-4-yl)-
5 1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-metyl-8-[(4-metylpiperazin-1-yl)karbonyl]-
1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-metyl-8-(morfolin-4-ylkarbonyl)-1,3,4,7-
tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

10 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-[(4,4-difluorpiperidin-1-yl)karbonyl]-1-
metyl-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

eller et farmasøytisk akseptabelt salt av hvilken som helst av de ovennevnte; eller

b) valgt fra:

3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-[(4-etylpiperazin-1-yl)metyl]-1-metyl-
15 1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-[2-(4-etylpiperazin-1-yl)etyl]-1-metyl-
1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-[3-(4-etylpiperazin-1-yl)propyl]-1-metyl-
1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

20 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-[(1-etylpiperidin-4-yl)metyl]-1-metyl-
1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-metyl-8-(morfolin-4-ylmetyl)-1,3,4,7-
tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-[(4-hydroksypiperidin-1-yl)metyl]-1-metyl-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-[(4,4-difluorpiperidin-1-yl)metyl]-1-metyl-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

5 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-[(3,3-difluorpiperidin-1-yl)metyl]-1-metyl-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-metyl-8-(2-morfolin-4-yletyl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

8-(2-azetidin-1-yletyl)-3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-metyl-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-metyl-8-(2-pyrrolidin-1-yletyl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-metyl-8-(3-morfolin-4-ylpropyl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

15 8-[3-(4-cyklopropylpiperazin-1-yl)propyl]-3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-metyl-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-[(4-etyl piperazin-1-yl)karbonyl]-1-metyl-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

20 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-[(3R,5S)-3,5-dimetyl piperazin-1-yl]-karbonyl}-1-metyl-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]-pyrimidin-2-on;

eller et farmasøytisk akseptabelt salt av hvilken som helst av de ovennevnte; eller

c) valgt fra:

25 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-etyl-8-(morfolin-4-ylmetyl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

- 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-etyl-8-[(4-metyl)piperazin-1-yl)metyl]-
1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
- 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-etyl-8-[(4-etyl)piperazin-1-yl)metyl]-
1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
- 5 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-metyl-8-[(4-metyl)piperazin-1-yl)metyl]-
1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
- 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-{[4-(2-hidroksyetyl)piperazin-1-yl]-
metyl}-1-metyl-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-
2-on;
- 10 3-(4-{[3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-metyl-2-okso-2,3,4,7-tetrahydro-
1H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-8-yl)metyl}piperazin-1-yl)-
propanitril;
- 1-{[3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-metyl-2-okso-2,3,4,7-tetrahydro-1H-
pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-8-yl)metyl}piperidin-4-karbonitril;
- 15 (3S)-1-{[3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-metyl-2-okso-2,3,4,7-tetrahydro-
1H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-8-yl)metyl}pyrrolidin-3-karbonitril;
- 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-metyl-8-{[(1-metyl)piperidin-4-yl)amino]-
metyl}-1,3,4,7-tetrahydro-2Hpyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
- 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-metyl-8-{[(3S)-tetrahydrofuran-3-
ylamino]metyl}-1,3,4,7-tetrahydro-2Hpyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-
2-on;
- 20 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-metyl-8-{[(3R)-tetrahydrofuran-3-
ylamino]metyl}-1,3,4,7-tetrahydro-2Hpyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-
2-on;
- 25 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-(1H-imidazol-1-ylmetyl)-1-metyl-1,3,4,7-
tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

- 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-metyl-8-(1H-pyrazol-1-ylmetyl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
- 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-metyl-8-[(1-metyl-1H-pyrazol-4-yl)metyl]-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
- 5 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-metyl-8-(2-pyridin-2-yletyl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
- 3-(2-klor-6-fluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-etyl-8-(morfolin-4-ylmetyl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
- 8-[2-(dietylamino)etyl]-3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-metyl-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
- 10 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-[2-(3-fluorazetidin-1-yl)etyl]-1-metyl-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
- 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-[2-(3-metoksyazetidin-1-yl)etyl]-1-metyl-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
- 15 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-(2-hidroksyetyl)-8-(2-morfolin-4-yletyl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
- 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-(2-fluorfenyl)-8-(morfolin-4-ylmetyl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
- 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-[(4-etyl piperazin-1-yl)metyl]-1-(2-fluorfenyl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
- 20 1-cyklobutyl-3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-(morfolin-4-ylmetyl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
- 1-cyklobutyl-3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-(2-morfolin-4-yletyl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
- 25 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-(morfolin-4-ylmetyl)-1-propyl-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-etyl-8-(2-morfolin-4-yletyl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

1-cyklopropyl-3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-(morfolin-4-ylmetyl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

5 1-cyklopropyl-3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-[(4-metylpiperazin-1-yl)-metyl]-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

1-cyklopropyl-3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-[(4-etyl piperazin-1-yl)-metyl]-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

10 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-(4-fluorfenyl)-8-(morfolin-4-ylmetyl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-(4-fluorfenyl)-8-[(4-metylpiperazin-1-yl)-metyl]-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-(4-fluorfenyl)-8-[(4-etyl piperazin-1-yl)-metyl]-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

15 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-(2,3-difluorfenyl)-8-[(4-metylpiperazin-1-yl)metyl]-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-(2,3-difluorfenyl)-8-[(4-etyl piperazin-1-yl)-metyl]-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

20 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-(morfolin-4-ylmetyl)-1-pyridin-4-yl-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-[(4-metylpiperazin-1-yl)metyl]-1-pyridin-4-yl-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-(2-fluorfenyl)-8-(2-morfolin-4-yletyl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5, 6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

25 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-(2-fluorfenyl)-8-[2-(4-metylpiperazin-1-yl)etyl]-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-(2-fluorfenyl)-8-[2-(4-etylpiperazin-1-yl)-etyl]-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-[(2-metoksypyridin-4-yl)metyl]-8-(morfolin-4-ylmetyl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]-
5 pyrimidin-2-on;

3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-(1-metyl-1H-pyrazol-4-yl)-8-(morfolin-4-ylmetyl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-[(4-metylpiperazin-1-yl)metyl]-1-(1-metyl-1H-pyrazol-4-yl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]-
10 pyrimidin-2-on;

3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-[(4-etylpiperazin-1-yl)metyl]-1-(1-metyl-1H-pyrazol-4-yl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]-pyrimidm-2-on;

1-{[3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-metyl-2-okso-2,3,4,7-tetrahydro-1H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-8-yl)metyl}azetidin-3-karbonitril;
15

(3R)-1-{[3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-metyl-2-okso-2,3,4,7-tetrahydro-1H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-8-yl)metyl}pyrrolidin-3-karbonitril;

3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-[2-(3-fluorazetidin-1-yl)etyl]-1-(2-hidroksyetyl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
20

3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-(2,3-difluorfenyl)-8-(morfolin-4-ylmetyl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-(3-fluorfenyl)-8-(morfolin-4-ylmetyl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5, 6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-(3-fluorfenyl)-8-[(4-metylpiperazin-1-yl)-metyl]-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
25

- 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-(3-fluorfenyl)-8-[(4-etyl piperazin-1-yl)-metyl]-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
- 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-etyl-8-[(2-okso pyridin-1(2H)-yl)metyl]-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
- 5 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-etyl-8-[(pyridin-3-yloksy)metyl]-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
- 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-(2-hidroksyetyl)-8-(morfolin-4-ylmetyl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
- 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-(2,3-difluorfenyl)-8-(2-morfolin-4-yletyl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
- 10 1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
- 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-(2,3-difluorfenyl)-8-[2-(4-metyl piperazin-1-yl)etyl]-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
- 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-(2,3-difluorfenyl)-8-[2-(4-etyl piperazin-1-yl)etyl]-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
- 15 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-(4-fluorfenyl)-8-(2-morfolin-4-yletyl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
- 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-(4-fluorfenyl)-8-[2-(4-metyl piperazin-1-yl)etyl]-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
- 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-(3-fluorfenyl)-8-(2-morfolin-4-yletyl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
- 20 1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
- 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-(3-fluorfenyl)-8-[2-(4-metyl piperazin-1-yl)etyl]-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
- 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-(3-fluorfenyl)-8-[2-(4-etyl piperazin-1-yl)etyl]-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;
- 25 1-{2-[3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-etyl-2-okso-2,3,4,7-tetrahydro-1H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-8-yl)etyl}azetidin-3-karbonitril;

3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-etyl-8-[2-(3-fluorazetidin-1-yl)etyl]-
1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-(2-fluoretyl)-8-(morfolin-4-ylmetyl)-
1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on; og

- 5 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-(2-fluoretyl)-8-[(4-metyl piperazin-1-yl)-
metyl]-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on;

eller et farmasøytisk akseptabelt salt av hvilken som helst av de ovennevnte.

- 14.** Forbindelse ifølge krav 1, som er 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-etyl-8-(morfolin-4-ylmetyl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido-
10 [4,3-d]pyrimidin-2-on eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

15. Forbindelse ifølge krav 1, som er 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-etyl-8-(morfolin-4-ylmetyl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido-
[4,3-d]pyrimidin-2-on.

- 16.** Forbindelse ifølge krav 1, som er 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-[(4-etyl piperazin-1-yl)metyl]-1-metyl-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]-
15 pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

17. Forbindelse ifølge krav 1, som er 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-8-[(4-etyl piperazin-1-yl)metyl]-1-metyl-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]-
pyrido[4,3-d]pyrimidin-2-on.

- 20 **18.** Forbindelse ifølge krav 1, som er 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-metyl-8-(morfolin-4-ylmetyl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido-
[4,3-d]pyrimidin-2-on eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

- 19.** Forbindelse ifølge krav 1, som er 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-metyl-8-(morfolin-4-ylmetyl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido-
25 [4,3-d]pyrimidin-2-on.

20. Forbindelse ifølge krav 1, som er 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-etyl-8-(2-morfolin-4-yletyl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido-
[4,3-d]pyrimidin-2-on eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

21. Forbindelse ifølge krav 1, som er 3-(2,6-difluor-3,5-dimetoksyfenyl)-1-etyl-8-(2-morfolin-4-yletyl)-1,3,4,7-tetrahydro-2H-pyrrolo[3',2':5,6]pyrido-[4,3-d]pyrimidin-2-on.

22. Farmasøytisk sammensetning omfattende:

5 (a) en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 13 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og minst én farmasøytisk akseptabel bærer; eller

(b) en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 14, 16, 18 eller 20 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og minst én farmasøytisk akseptabel
10 bærer; eller

(c) en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 15, 17, 19 eller 21 og minst én farmasøytisk akseptabel bærer.

23. Fremgangsmåte for å hemme et FGFR-enzym, omfattende *in vitro* å bringe enzymet i berøring med:

15 (a) en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 13 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav; eller

(b) en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 14, 16, 18 eller 20 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav; eller

(c) en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 15, 17, 19 eller 21.

20 **24.** Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 13, 14, 16, 18 eller 20, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse ved:

a) behandling av kreft; eller

b) behandling av kreft hvor kreftarten er valgt fra blærekreft, brystkreft, livmorhalskreft, tykktarmskreft, endometrial kreft, magekreft, kreft i hode og hals,
25 nyrekreft, leverkreft, lungekreft, eggstokkreft, prostatakreft, øsofageal kreft, galleblærekreft, kreft i bukspyttkjertelen, skjoldbruskkjertelkreft, hudkreft, leukemi, multippelt myeloma, kronisk lymfocytisk lymfom, voksen T-celleleukemi,

B-cellelymfom, akutt myelogen leukemi, Hodgkins eller ikke-Hodgkins lymfom, Waldenstroms Makroglubulinemi, hårete cellelymfom, Burketts lymfom, glioblastom, melanom og rhabdosarkoma.

25. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 13, 14, 16, 18 eller
5 20, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse ved:

- a) behandling av en myeloproliferativ forstyrrelse; eller
- b) behandling av en myeloproliferativ forstyrrelse hvor nevnte myeloproliferative forstyrrelse er valgt fra polycytemi vera, essensiell trombocytomi og primær myelofibrose.

10 **26.** Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 13, 14, 16, 18 eller
20, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse ved:

- a) behandling av en skjelett- eller chondrocyttforstyrrelse; eller
- b) behandling av en skjelett- eller chondrocyttforstyrrelse hvor nevnte skjelett- eller chondrocyttforstyrrelse er valgt fra achondroplasia, hypochondroplasia,
15 dvergvekst, thanatoforisk dysplasi (TD), Aperts syndrom, Crouzons syndrom, Jackson-Weiss-syndrom, Beare-Stevenson-cutis gyrate-syndrom, Pfeiffers syndrom og craniosynostosisyndrom.

27. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 13, 14, 16, 18 eller
20, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse ved:

- 20 a) behandling av en hypofosfatemiforstyrrelse; eller
- b) behandling av en hypofosfatemiforstyrrelse hvor nevnte hypofosfatemiforstyrrelse er X-koblet hypofosfatemisk rakitt, autosomal recessiv hypofosfatemisk rakitt og autosomal dominant hypofosfatemisk rakitt eller svulstindusert osteromalasi.

25 **28.** Forbindelse ifølge krav 15, 17, 19 eller 21, for anvendelse ved:

- a) behandling av kreft; eller

- b) behandling av kreft hvor kreftarten er valgt fra blærekreft, brystkreft, livmorhalskreft, tykktarmskreft, endometrial kreft, magekreft, kreft i hode og hals, nyrekreft, leverkreft, lungekreft, eggstokkreft, prostatakreft, øsofageal kreft, galleblærekreft, kreft i bukspyttkjertelen, skjoldbruskkjertelkreft, hudkreft,
- 5 leukemi, multippelt myeloma, kronisk lymfocytisk lymfom, voksen T-celleleukemi, B-cellelymfom, akutt myelogen leukemi, Hodgkins eller ikke-Hodgkins lymfom, Waldenstroms Makroglubulinemi, hårete cellelymfom, Burketts lymfom, glioblastom, melanom og rhabdosarkoma.

29. Forbindelse ifølge krav 15, 17, 19 eller 21, for anvendelse ved:

- 10 a) behandling av en myeloproliferativ forstyrrelse; eller
- b) behandling av en myeloproliferativ forstyrrelse hvor nevnte myeloproliferative forstyrrelse er valgt fra polycytemi vera, essensiell trombocytomi og primær myelofibrose.

30. Forbindelse ifølge krav 15, 17, 19 eller 21, for anvendelse ved:

- 15 a) behandling av en skjelett- eller kondrocyttforstyrrelse; eller
- b) behandling av en skjelett- eller kondrocyttforstyrrelse hvor nevnte skjelett- eller kondrocyttforstyrrelse er valgt fra achondroplasia, hypochondroplasia, dvergvekst, thanatoforisk dysplasi (TD), Aperts syndrom, Crouzons syndrom, Jackson-Weiss-syndrom, Beare-Stevenson-cutis gyrate-syndrom, Pfeiffers syndrom
- 20 og craniosynostosesyndrom.

31. Forbindelse ifølge krav 15, 17, 19 eller 21, for anvendelse ved:

- a) behandling av en hypofosfatemiforstyrrelse; eller
- b) behandling av en hypofosfatemiforstyrrelse hvor nevnte hypofosfatemiforstyrrelse er X-koblet hypofosfatemisk rakitt, autosomal recessiv
- 25 hypofosfatemisk rakitt og autosomal dominant hypofosfatemisk rakitt eller svulstindusert osteromalasi.