



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 2966067 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

C07D 267/14 (2006.01) C07D 413/04 (2006.01) C07D 413/14 (2006.01)  
A61K 31/553 (2006.01) C07D 413/12 (2006.01) C07D 498/04 (2006.01)  
A61P 9/10 (2006.01)

**Norwegian Industrial Property Office**

---

(21)	Translation Published	2018.03.26
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2017.10.25
(86)	European Application Nr.	15177723.2
(86)	European Filing Date	2012.06.29
(87)	The European Application's Publication Date	2016.01.13
(30)	Priority	2011.07.01, US, 201161503980 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
(62)	Divided application	EP2726469, med inndato 2012.06.29
(73)	Proprietor	Gilead Sciences, Inc., 333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US-USA
(72)	Inventor	CORKEY, Britton Kenneth, c/o Gilead Sciences, Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US-USA ELZEIN, Elfatih, c/o Gilead Sciences, Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US-USA JIANG, Robert H., 8057 Park Villa Circle, Cupertino, CA 95014, US-USA KALLA, Rao V., c/o Gilead Sciences, Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US-USA KOLTUN, Dmitry, c/o Gilead Sciences, Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US-USA LI, Xiaofen, c/o Gilead Sciences, Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US-USA MARTINEZ, Ruben, 10661 Calston Way, San Diego, CA 92126, US-USA PARKHILL, Eric Q., c/o Gilead Sciences, Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US-USA PERRY, Thao, c/o Gilead Sciences, Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US-USA ZABLOCKI, Jeff, c/o Gilead Sciences, Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US-USA VENKATARAMANI, Chandrasekar, c/o Gilead Sciences, Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US-USA GRAUPE, Michael, c/o Gilead Sciences, Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US-USA GUERRERO, Juan, c/o Gilead Sciences, Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, US-USA
(74)	Agent or Attorney	TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

---

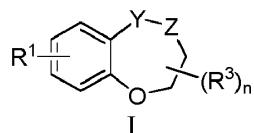
(54)	Title	<b>OXAZEPINES AS ION CHANNEL MODULATORS</b>
(56)	References Cited:	WO-A2-2011/056985, SCIRICA: "Ranolazine in patients with coronary artery disease", EXPERT OPIN. PHARMACOTHER., vol. 8, no. 13, 1 September 2007 (2007-09-01), pages 2149-2157, XP008122077, ISSN: 1465-6566, DOI: 10.1517/14656566.8.13.2149, BARSKY, BENCZE: "Hypoglycemic Cyclic Amidines", J. MED. CHEM., vol. 14, no. 1, 1971, pages 40-44, XP002682484., US-A1- 2011 076 292

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

5

1. Sammensetning omfattende en forbindelse med formel I kombinasjon med minst ett terapeutisk middel:



10

hvor:

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

$R^1$  er aryl, sykloalkyl, sykloalkenyl, heterosyklyl eller heteroaryl;

hvor arylet, sykloalkylet, sykloalkenylet, heterosyklylet eller heteroarylet

15 eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo,  $-NO_2$ ,  $-CN$ ,  $-SF_5$ ,  $-Si(CH_3)_3$ ,  $-O-R^{20}$ ,  $-S-R^{20}$ ,  $-C(O)-R^{20}$ ,  $-C(O)-OR^{20}$ ,  $-N(R^{20})(R^{22})$ ,  $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ ,  $-N(R^{20})-C(O)-R^{22}$ ,  $-N(R^{20})-C(O)-OR^{22}$ ,  $-N(R^{20})-S(=O)_2-R^{26}$ ,  $-S(=O)_2-R^{20}$ ,  $-O-S(=O)_2-R^{20}$ ,  $-S(=O)_2-N(R^{20})(R^{22})$ ,  $C_{1-6}$ -alkyl,  $C_{2-4}$ -alkenyl,  $C_{2-4}$ -alkynyl, sykloalkyl, aryl, heteroaryl og heterosyklyl; og

20 hvor  $C_{1-6}$ -alkylet,  $C_{2-4}$ -alkenylet,  $C_{2-4}$ -alkynylet, sykloalkylet, arylet, heteroarylet eller heterosyklylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo,  $-NO_2$ , fenyl, heterosyklyl, heteroaryl,  $C_{1-6}$ -alkyl, sykloalkyl,  $-N(R^{20})(R^{22})$ ,  $-C(O)-R^{20}$ ,  $-C(O)-OR^{20}$ ,  $-C(O)-N(R^{20})$ ,  $-CN$  og  $-O-R^{20}$ ;

25  $R^2$  er hydrogen,  $C_{1-6}$ -alkyl,  $-C(O)-R^{20}$ ,  $-C(O)-OR^{26}$ ,  $-C(O)-N(R^{26})(R^{26})$ ,  $-N(R^{20})-S(=O)_2-R^{20}$ , sykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterosyklyl;

30 hvor  $C_{1-6}$ -alkylet, sykloalkylet, arylet, heteroarylet eller heterosyklylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av  $C_{1-6}$ -alkyl,  $C_{2-4}$ -alkynyl, halo,  $-NO_2$ , sykloalkyl, aryl, heterosyklyl, heteroaryl,  $-N(R^{20})(R^{22})$ ,  $-C(O)-R^{20}$ ,  $-C(O)-OR^{20}$ ,  $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ ,  $-CN$ , okso og  $-O-R^{20}$ ;

hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, sykloalkylet, arylet, heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, aryl, heterosykyl, heteroaryl,-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og-O-R<sup>20</sup>; og

5 hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, sykloalkylet, arylet, heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, -CF<sub>3</sub>, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN, -S(O)<sub>2</sub>-R<sup>20</sup> og-O-R<sup>20</sup>;  
 n er 0, 1, 2, 3 eller 4;

10 hver R<sup>3</sup> uavhengig er C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterosyklyl;  
 hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter  
 uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, sykloalkyl, aryl, heterosyklyl,  
 heteroaryl, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>;

15 hvor sykloalkylet, arylet, heterosyklylet eller heteroarylet  
eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra  
gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub>-alkyl, aralkyl, sykloalkyl, aryl, heterosyklyl,  
heteroaryl, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>;  
og

hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, aralkylet, sykloalkylet, arylet,  
20 heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre  
substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo,-NO<sub>2</sub>, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -  
C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>;  
eller to R<sup>3</sup> knyttet til et felles karbonatom danner en okso;  
eller to R<sup>3</sup> knyttet til et felles eller tilstøtende karbonatomer danner et sykloalkyl  
25 eller heterosykyl:

hvor sykloalkylet eller heterosyklylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo,  $\text{-NO}_2$ ,  $\text{C}_{1-6}\text{-alkyl}$ , aralkyl, sykloalkyl, aryl, heterosykyl, heteroaryl,  $\text{-N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$ ,  $\text{-C(O)-R}^{20}$ ,  $\text{-C(O)-OR}^{20}$ ,  $\text{-C(O)-N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$ ,  $\text{-CN}$  og  $\text{-O-R}^{20}$ ;

30  $R^4$  er C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterosyklyl;

hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, sykloalkylet, arylet, heteroarylet eller heterosyklylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, sykloalkyl, aryl, heterosykyl, heteroaryl, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>;

5                    hvor sykloalkylet, arylet, heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub>-alkyl, aralkyl, sykloalkyl, aryl, heterosykyl, heteroaryl, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>;

og

10                  hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, aralkylet, sykloalkylet, arylet, heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halo, -NO<sub>2</sub>, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>;

15                  eller R<sup>2</sup> og R<sup>4</sup> kan gå sammen med atomet de er tilknyttet og danne et heterosyklyl eller heteroaryl;

                      hvor heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, heteroaryl, -CN, -O-R<sup>20</sup>, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -N(R<sup>20</sup>)-C(O)-OR<sup>20</sup> og -C(O)-OR<sup>20</sup>; og

20                  hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet eller heteroarylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -CN, -O-R<sup>20</sup>, C<sub>1-6</sub>-alkyl, aryl, og heteroaryl;

R<sup>5</sup> er hydrogen, C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterosyklyl;

25                  hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, sykloalkylet, arylet, heteroarylet eller heterosyklylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, sykloalkyl, aryl, heterosykyl, heteroaryl, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>;

                      hvor sykloalkylet, arylet, heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub>-alkyl, aralkyl, sykloalkyl, aryl, heterosykyl,

heteroaryl, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>;

og

hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, aralkylet, sykloalkylet, arylet,

heterosyklyet eller heteroarylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre

- 5 substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halo,-NO<sub>2</sub>, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>;

R<sup>6</sup> er C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterosyklyl;

hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, sykloalkylet, arylet, heteroarylet eller heterosyklyet

eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen

- 10 bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, aryl, heterosyklyl, heteroaryl, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>;

hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, sykloalkylet, arylet, heterosyklyet eller

heteroarylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub>-alkyl, aralkyl, sykloalkyl, aryl,

- 15 heterosyklyl,heteroaryl, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)- R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>; og

hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, aralkylet, sykloalkylet, arylet,

heterosyklyet eller heteroarylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre

substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halo,-NO<sub>2</sub>, -

- 20 N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>;

eller R<sup>5</sup> og R<sup>6</sup> kan gå sammen med atomet de er tilknyttet og danne et heterosyklyl eller heteroaryl;

hvor heterosyklyet eller heteroarylet eventuelt er substituert med én, to

eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, C<sub>1-6</sub>-alkyl,

- 25 sykloalkyl, heterosyklyl, aryl, heteroaryl, okso, -CN, -O-R<sup>20</sup>, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -N(R<sup>20</sup>)-C(O)-R<sup>20</sup>, -N(R<sup>20</sup>)-C(O)-OR<sup>20</sup> og -C(O)-OR<sup>20</sup>; og

hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet eller heterosyklyet eventuelt er substituert med

én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, okso,

heteroaryl og -O-R<sup>20</sup>;

- 30 R<sup>20</sup> og R<sup>22</sup> i hvert tilfelle uavhengig er valgt fra gruppen bestående av hydrogen,

C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, heterosyklyl, aryl og heteroaryl; og

hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, sykloalkylet, heterosyklylet, arylet og heteroarylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halo, C<sub>1-4</sub>-alkyl, acylamino, okso, -NO<sub>2</sub>, -SO<sub>2</sub>R<sup>26</sup>, -CN, C<sub>1-3</sub>-alkoksy, aryloksy, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -C(O)-NH<sub>2</sub>, aryl, sykloalkyl og heteroaryl;

5                   hvor heteroarylet eventuelt videre er substituert med C<sub>1-4</sub>-alkyl eller sykloalkyl; eller

når R<sup>20</sup> og R<sup>22</sup> er knyttet til et felles nitrogenatom, R<sup>20</sup> og R<sup>22</sup> kan gå sammen og danne et heterosyklyl eller heteroaryl som så eventuelt blir substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halo, C<sub>1-4</sub>-alkyl, 10 aralkyl, aryloksy, aralkyloksy, acylamino, -NO<sub>2</sub>, -SO<sub>2</sub>R<sup>26</sup>, -CN, C<sub>1-3</sub>-alkoksy, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, aryl, heteroaryl og sykloalkyl; og

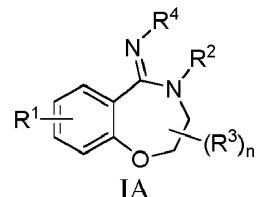
hver R<sup>26</sup> uavhengig er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, C<sub>1-4</sub>-alkyl, aryl og sykloalkyl;

15                   hvor C<sub>1-4</sub>-alkylet, arylet og sykloalkylet videre kan være substituert med fra 1 til 3 substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halo, C<sub>1-4</sub>-alkoksy, -CF<sub>3</sub> og -OCF<sub>3</sub>;

20                   eller et farmasøytsk akseptabelt salt, en stereoisomer, en blanding av stereoisomener eller en tautomer derav; forutsatt at når R<sup>2</sup> og R<sup>4</sup> går sammen med atomet de er tilknyttet og danner en eventuelt substituert imidazolyl, imidazolylet ikke er direkte substituert med en eventuelt substituert triazolyl, eller R<sup>1</sup> ikke er eventuelt substituert pyrazolyl, 2-pyridinonyl eller 2-fluorpyridinyl.

2.                 Sammensetning ifølge krav 1, hvor forbindelsen med formel I er representert ved formel IA:

25



hvor:

$R^1$  er aryl, sykloalkyl, sykloalkenyl, heterosyklyl eller heteroaryl;

- hvor arylet, sykloalkylet, sykloalkenylet, heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo,  $-NO_2$ ,  $-CN$ ,  $-SF_5$ ,  $-Si(CH_3)_3$ ,  $-O-R^{20}$ ,  $-S-R^{20}$ ,  $-C(O)-R^{20}$ ,  $-C(O)-OR^{20}$ ,  
 5  $-N(R^{20})(R^{22})$ ,  $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ ,  $-N(R^{20})-C(O)-R^{22}$ ,  $-N(R^{20})-C(O)-OR^{22}$ ,  $-N(R^{20})-$   
 $S(=O)_2-R^{26}$ ,  $-S(=O)_2-R^{20}$ ,  $-O-S(=O)_2-R^{20}$ ,  $-S(=O)_2-N(R^{20})(R^{22})$ ,  $C_{1-6}$ -alkyl,  $C_{2-4}$ -alkenyl,  
 $C_{2-4}$ -alkynyl, sykloalkyl, aryl, heteroaryl og heterosyklyl; og

- hvor  $C_{1-6}$ -alkylet,  $C_{2-4}$ -alkenylet,  $C_{2-4}$ -alkynylet, sykloalkylet,  
 arylet, heteroarylet eller heterosyklylet eventuelt er substituert med én, to eller tre  
 10 substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo,  $-NO_2$ , fenyl, heterosyklyl,  
 heteroaryl,  $C_{1-6}$ -alkyl, sykloalkyl,  $-N(R^{20})(R^{22})$ ,  $-C(O)-R^{20}$ ,  $-C(O)-OR^{20}$ ,  $-C(O)-$   
 $N(R^{20})(R^{22})$ ,  $-CN$  og  $-O-R^{20}$ ;

$R^2$  er hydrogen,  $C_{1-6}$ -alkyl,  $-C(O)-R^{20}$ ,  $-C(O)-OR^{26}$ ,  $-C(O)-N(R^{26})(R^{26})$ ,  $-$   
 $N(R^{20})-S(-O)_2-R^{20}$ , sykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterosyklyl;

- 15 hvor  $C_{1-6}$ -alkylet, sykloalkylet, arylet, heteroarylet eller heterosyklylet  
 eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen  
 bestående av  $C_{1-6}$ -alkyl,  $C_{2-4}$ -alkynyl, halo,  $-NO_2$ , sykloalkyl, aryl, heterosyklyl,  
 heteroaryl,  $-N(R^{20})(R^{22})$ ,  $-C(O)-R^{20}$ ,  $-C(O)-OR^{20}$ ,  $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ ,  $-CN$ , okso og  $-$   
 $O-R^{20}$ ;

- 20 hvor  $C_{1-6}$ -alkylet, sykloalkylet, arylet, heterosyklylet eller heteroaryllet  
 eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra  
 gruppen bestående av halo,  $-NO_2$ ,  $C_{1-6}$ -alkyl, sykloalkyl, aryl, heterosyklyl,  
 heteroaryl,  $-N(R^{20})(R^{22})$ ,  $-C(O)-R^{20}$ ,  $-C(O)-OR^{20}$ ,  $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ ,  $-CN$  og  $-O-R^{20}$ ; og

- 25 hvor  $C_{1-6}$ -alkylet, sykloalkylet, arylet, heterosyklylet eller heteroaryllet  
 eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra  
 gruppen bestående av halo,  $-NO_2$ ,  $-CF_3$ ,  $-N(R^{20})(R^{22})$ ,  $-C(O)-R^{20}$ ,  $-C(O)-OR^{20}$ ,  $-C(O)-$   
 $N(R^{20})(R^{22})$ ,  $-CN$ ,  $-S(O)_2-R^{20}$  og  $-O-R^{20}$ ;

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

hver  $R^3$  uavhengig er  $C_{1-6}$ -alkyl, sykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterosyklyl;

- hvorpå  $C_{1-6}$ -alkylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo,  $-NO_2$ , sykloalkyl, aryl, heterosyklyl, heteroaryl,  $-N(R^{20})(R^{22})$ ,  $-C(O)-R^{20}$ ,  $-C(O)-OR^{20}$ ,  $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ ,  $-CN$  og  $-O-R^{20}$ ;
- hvorpå sykloalkylet, arylet, heterosyklylet eller heteroarylet
- 5 eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo,  $-NO_2$ ,  $C_{1-6}$ -alkyl, aralkyl, sykloalkyl, aryl, heterosyklyl, heteroaryl,  $-N(R^{20})(R^{22})$ ,  $-C(O)-R^{20}$ ,  $-C(O)-OR^{20}$ ,  $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ ,  $-CN$  og  $-O-R^{20}$ ;
- og
- hvorpå  $C_{1-6}$ -alkylet, aralkylet, sykloalkylet, arylet,
- 10 heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo,  $-NO_2$ ,  $-N(R^{20})(R^{22})$ ,  $-C(O)-R^{20}$ ,  $-C(O)-OR^{20}$ ,  $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ ,  $-CN$  og  $-O-R^{20}$ ;
- eller to  $R^3$  knyttet til et felles karbonatom danner en okso;
- eller to  $R^3$  knyttet til et felles eller tilstøtende karbonatomer danner et sykloalkyl
- 15 eller heterosyklyl;
- hvorpå sykloalkylet eller heterosyklylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo,  $-NO_2$ ,  $C_{1-6}$ -alkyl, aralkyl, sykloalkyl, aryl, heterosyklyl, heteroaryl,  $-N(R^{20})(R^{22})$ ,  $-C(O)-R^{20}$ ,  $-C(O)-OR^{20}$ ,  $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ ,  $-CN$  og  $-O-R^{20}$ ;
- 20  $R^4$  er  $C_{1-6}$ -alkyl, sykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterosyklyl;
- hvorpå  $C_{1-6}$ -alkylet, sykloalkylet, arylet, heteroarylet eller heterosyklylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo,  $-NO_2$ , sykloalkyl, aryl, heterosyklyl, heteroaryl,  $-N(R^{20})(R^{22})$ ,  $-C(O)-R^{20}$ ,  $-C(O)-OR^{20}$ ,  $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ ,  $-CN$  og  $-O-R^{20}$ ;
- 25 hvorpå sykloalkylet, arylet, heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo,  $-NO_2$ ,  $C_{1-6}$ -alkyl, aralkyl, sykloalkyl, aryl, heterosyklyl, heteroaryl,  $-N(R^{20})(R^{22})$ ,  $-C(O)-R^{20}$ ,  $-C(O)-OR^{20}$ ,  $-C(O)-N(R^{20})(R^{22})$ ,  $-CN$  og  $-O-R^{20}$ ;
- og
- 30 hvorpå  $C_{1-6}$ -alkylet, aralkylet, sykloalkylet, arylet, heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre

substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halo, -NO<sub>2</sub>, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>;

eller R<sup>2</sup> og R<sup>4</sup> kan gå sammen med atomet de er tilknyttet og danne et heterosyklyl eller heteroaryl;

5                 hvor heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, heteroaryl, -CN, -O-R<sup>20</sup>, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -N(R<sup>20</sup>)-C(O)-OR<sup>20</sup> og -C(O)-OR<sup>20</sup>; og

10                 hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet eller heteroarylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -CN, -O-R<sup>20</sup>, C<sub>1-6</sub>-alkyl, aryl, og heteroaryl;

15                 R<sup>20</sup> og R<sup>22</sup> i hvert tilfelle uavhengig er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, heterosyklyl, aryl og heteroaryl; og

20                 hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, sykloalkylet, heterosyklylet, arylet og heteroarylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halo, C<sub>1-4</sub>-alkyl, acylamino, okso, -NO<sub>2</sub>, -SO<sub>2</sub>R<sup>26</sup>, -CN, C<sub>1-3</sub>-alkoksy, aryloksy, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -C(O)-NH<sub>2</sub>, aryl, sykloalkyl og heteroaryl;

25                 hvor heteroarylet eventuelt videre er substituert med C<sub>1-4</sub>-alkyl eller sykloalkyl; eller

30                 når R<sup>20</sup> og R<sup>22</sup> er knyttet til et felles nitrogenatom, R<sup>20</sup> og R<sup>22</sup> kan gå sammen og danne et heterosyklyl eller heteroaryl som da eventuelt blir substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halo, C<sub>1-4</sub>-alkyl, aralkyl, aryloksy, aralkyloksy, acylamino, -NO<sub>2</sub>, -SO<sub>2</sub>R<sup>26</sup>, -CN, C<sub>1-3</sub>-alkoksy, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, aryl, heteroaryl og sykloalkyl; og

35                 hver R<sup>26</sup> uavhengig er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, C<sub>1-4</sub>-alkyl, aryl og sykloalkyl;

40                 hvor C<sub>1-4</sub>-alkylet, arylet og sykloalkylet videre kan være substituert med fra 1 til 3 substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halo, C<sub>1-4</sub>-alkoksy, -CF<sub>3</sub> og -OCF<sub>3</sub>;

45                 eller et farmasøytisk akseptabelt salt, en stereoisomer, en blanding av stereoisomener eller en tautomer derav; forutsatt at når R<sup>2</sup> og R<sup>4</sup> går sammen med

atomet de er tilknyttet og danner en eventuelt substituert imidazolyl, imidazolylet ikke er direkte substituert med en eventuelt substituert triazolyl, eller R<sup>1</sup> ikke er eventuelt substituert pyrazolyl, 2-pyridinonyl eller 2-fluorpyridinyl.

5    3.    Sammensetning ifølge krav 2, hvor:

R<sup>1</sup> er aryl, sykloalkyl, sykloalkenyl, heterosyklyl eller heteroaryl;

hvor arylet, sykloalkylet, sykloalkenylet, heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, -CN, -SF<sub>5</sub>, -Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -O-R<sup>20</sup>, -S-R<sup>20</sup>, -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -N(R<sup>20</sup>)-C(O)-R<sup>22</sup>, -N(R<sup>20</sup>)-C(O)-OR<sup>22</sup>, -N(R<sup>20</sup>)-S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>26</sup>, -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>20</sup>, -O-S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>20</sup>, -S(=O)<sub>2</sub>-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), C<sub>1-6</sub>-alkyl, C<sub>2-4</sub>-alkenyl, C<sub>2-4</sub>-alkynyl, sykloalkyl, aryl, heteroaryl og heterosyklyl; og

hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, C<sub>2-4</sub>-alkenylet, C<sub>2-4</sub>-alkynylet, sykloalkylet, arylet, heteroarylet eller heterosyklylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, fenyl, heterosyklyl, heteroaryl, C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>;

n er 0; og

R<sup>2</sup> og R<sup>4</sup> går sammen med atomet de er tilknyttet og danner et heterosyklyl eller heteroaryl;

hvor heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, heteroaryl, -CN, -O-R<sup>20</sup>, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -N(R<sup>20</sup>)-C(O)-OR<sup>20</sup> og -C(O)-OR<sup>20</sup>; og

hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet eller heteroarylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -CN, -O-R<sup>20</sup>, C<sub>1-6</sub>-alkyl, aryl, og heteroaryl.

4.    Sammensetning ifølge krav 2, hvor:

30    R<sup>1</sup> er aryl;

- hvor arylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, -CN, -SF<sub>5</sub>, -Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -O-R<sup>20</sup>, -S-R<sup>20</sup>, -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -N(R<sup>20</sup>)-C(O)-R<sup>22</sup>, -N(R<sup>20</sup>)-C(O)-OR<sup>22</sup>, -N(R<sup>20</sup>)-S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>26</sup>, -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>20</sup>, -O-S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>20</sup>, -S(=O)<sub>2</sub>-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), C<sub>1-6</sub>-alkyl, C<sub>2-4</sub>-alkenyl, C<sub>2-4</sub>-alkynyl, sykloalkyl, aryl, heteroaryl og heterosyklyl; og
- hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, C<sub>2-4</sub>-alkenylet, C<sub>2-4</sub>-alkynylet, sykloalkylet, arylet, heteroarylet eller heterosyklylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, fenyl, heterosyklyl, heteroaryl, C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>;
- n er 0; og
- R<sup>2</sup> og R<sup>4</sup> går sammen med atomet de er tilknyttet og danner et heterosyklyl eller heteroaryl;
- 15               hvor heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, heteroaryl, -CN, -O-R<sup>20</sup>, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -N(R<sup>20</sup>)-C(O)-OR<sup>20</sup> og -C(O)-OR<sup>20</sup>; og
- hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet eller heteroarylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -CN, -O-R<sup>20</sup>, C<sub>1-6</sub>-alkyl, aryl, og heteroaryl.
5.               Sammensetning ifølge krav 2, hvor:
- R<sup>1</sup> er aryl, eventuelt substituert med -O-R<sup>20</sup> eller C<sub>1-6</sub>-alkyl; og
- 25               hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet eventuelt er substituert med én, to eller tre halo;
- n er 0;
- R<sup>2</sup> og R<sup>4</sup> går sammen med atomet de er tilknyttet og danner et heterosyklyl eller heteroaryl;
- hvor heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, C<sub>1-6</sub>-alkyl,

sykloalkyl, heteroaryl, -CN, -O-R<sup>20</sup>, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -N(R<sup>20</sup>)-C(O)-OR<sup>20</sup> og -C(O)-OR<sup>20</sup>; og

hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet eller heteroarylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -CN, -O-R<sup>20</sup>,

5 C<sub>1-6</sub>-alkyl, aryl, og heteroaryl.

6. Sammensetning ifølge krav 2, hvor:

R<sup>1</sup> er feny l substituert med -O-CF<sub>3</sub> eller -CF<sub>3</sub>;

n er 0; og

10 R<sup>2</sup> og R<sup>4</sup> går sammen med atomet de er tilknyttet og danner et heterosyklyl eller heteroaryl;

hvor heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, heteroaryl, -CN, -C(O)-R<sup>20</sup>, -N(R<sup>20</sup>)-C(O)-OR<sup>20</sup> og -C(O)-OR<sup>20</sup>; og

15 hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet eller heteroarylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -CN, -O-R<sup>20</sup>, C<sub>1-6</sub>-alkyl, aryl, og heteroaryl.

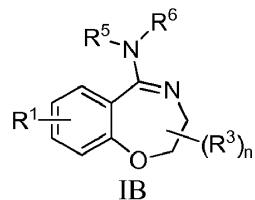
7. Sammensetning ifølge krav 1, hvor forbindelsen med formel I er valgt fra

20 gruppen bestående av:

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

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

8. Sammensetning ifølge krav 1, hvor forbindelsen med formel I er representert  
5 ved formel IB:



hvor:

- 10      R<sup>1</sup> er aryl, sykloalkyl, sykloalkenyl, heterosyklyl eller heteroaryl;  
       hvor arylet, sykloalkylet, sykloalkenylet, heterosyklylet eller heteroarylet  
       eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen  
       bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, -CN, -SF<sub>5</sub>, -Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -O-R<sup>20</sup>, -S-R<sup>20</sup>, -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>,  
       -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -N(R<sup>20</sup>)-C(O)-R<sup>22</sup>, -N(R<sup>20</sup>)-C(O)-OR<sup>22</sup>, -N(R<sup>20</sup>)-  
 15      S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>26</sup>, -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>20</sup>, -O-S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>20</sup>, -S(=O)<sub>2</sub>-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), C<sub>1-6</sub>-alkyl, C<sub>2-4</sub>-alkenyl,  
       C<sub>2-4</sub>-alkynyl, sykloalkyl, aryl, heteroaryl og heterosyklyl; og  
       hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, C<sub>2-4</sub>-alkenylet, C<sub>2-4</sub>-alkynylet, sykloalkylet,  
       arylet, heteroarylet eller heterosyklylet eventuelt er substituert med én, to eller tre  
       substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, fenyl, heterosyklyl,  
 20      heteroaryl, C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-  
       N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>;  
       n er 0, 1, 2, 3 eller 4;  
       hver R<sup>3</sup> uavhengig er C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterosyklyl;  
       hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter  
 25      uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, sykloalkyl, aryl, heterosyklyl,  
       heteroaryl, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>;  
       hvor sykloalkylet, arylet, heterosyklylet eller heteroarylet  
       eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra

gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub>-alkyl, aralkyl, sykloalkyl, aryl, heterosyklyl, heteroaryl, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>; og

hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, aralkylet, sykloalkylet, arylet,

- 5 heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>;
- eller to R<sup>3</sup> knyttet til et felles karbonatom danner en okso;
- eller to R<sup>3</sup> knyttet til et felles eller tilstøtende karbonatomer danner et sykloalkyl
- 10 eller heterosyklyl;
- hvor sykloalkylet eller heterosyklylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub>-alkyl, aralkyl, sykloalkyl, aryl, heterosyklyl, heteroaryl, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>;
- 15 R<sup>5</sup> er hydrogen, C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterosyklyl;
- hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, sykloalkylet, arylet, heteroarylet eller heterosyklylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, sykloalkyl, aryl, heterosyklyl, heteroaryl, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>;
- 20 hvor sykloalkylet, arylet, heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub>-alkyl, aralkyl, sykloalkyl, aryl, heterosyklyl, heteroaryl, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>;
- og
- 25 hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, aralkylet, sykloalkylet, arylet, heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halo, -NO<sub>2</sub>, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>;
- R<sup>6</sup> er C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterosyklyl;
- 30 hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, sykloalkylet, arylet, heteroarylet eller heterosyklylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen

bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, aryl, heterosyklyl, heteroaryl, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>;

hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, sykloalkylet, arylet, heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig

- 5 valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub>-alkyl, aralkyl, sykloalkyl, aryl, heterosyklyl, heteroaryl, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>; og

hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, aralkylet, sykloalkylet, arylet,

- 10 heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halo,-NO<sub>2</sub>, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>;

eller R<sup>5</sup> og R<sup>6</sup> kan gå sammen med atomet de er tilknyttet og danne et heterosyklyl eller heteroaryl;

- 15 hvor heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, heterosyklyl, aryl, heteroaryl, okso, -CN, -O-R<sup>20</sup>, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -N(R<sup>20</sup>)-C(O)-R<sup>20</sup>, -N(R<sup>20</sup>)-C(O)-OR<sup>20</sup> og -C(O)-OR<sup>20</sup>; og

- 20 hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet eller heterosyklylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, okso, heteroaryl og -O-R<sup>20</sup>;

R<sup>20</sup> og R<sup>22</sup> i hvert tilfelle uavhengig er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, heterosyklyl, aryl og heteroaryl; og

- 25 hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, sykloalkylet, heterosyklylet, arylet og heteroarylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halo, C<sub>1-4</sub>-alkyl, acylamino, okso, -NO<sub>2</sub>, -SO<sub>2</sub>R<sup>26</sup>, -CN, C<sub>1-3</sub>-alkoksy, aryloksy,-CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -C(O)-NH<sub>2</sub>, aryl, sykloalkyl og heteroaryl;

hvor heteroarylet eventuelt videre er substituert med C<sub>1-4</sub>-alkyl eller sykloalkyl; eller

- 30 når R<sup>20</sup> og R<sup>22</sup> er knyttet til et felles nitrogenatom, R<sup>20</sup> og R<sup>22</sup> kan gå sammen og danne et heterosyklyl eller heteroaryl som så eventuelt blir substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halo, C<sub>1-4</sub>-alkyl,

aralkyl, aryloksy, aralkyloksy, acylamino,  $-\text{NO}_2$ ,  $-\text{SO}_2\text{R}^{26}$ ,  $-\text{CN}$ ,  $\text{C}_{1-3}\text{-alkoksy}$ ,  $-\text{CF}_3$ ,  $-\text{OCF}_3$ , aryl, heteroaryl og sykloalkyl; og

hver  $\text{R}^{26}$  uavhengig er valgt fra gruppen bestående av hydrogen,  $\text{C}_{1-4}\text{-alkyl}$ , aryl og sykloalkyl;

5 hvor  $\text{C}_{1-4}\text{-alkylet}$ , arylet og sykloalkylet videre kan være substituert med fra 1 til 3 substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halo,  $\text{C}_{1-4}\text{-alkoksy}$ ,  $-\text{CF}_3$  og  $-\text{OCF}_3$ ;

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

10

9. Sammensetning ifølge krav 8, hvor:

$\text{R}^1$  er aryl, sykloalkyl, sykloalkenyl, heterosyklyl eller heteroaryl;

hvor arylet, sykloalkylet, sykloalkenylet, heterosyklylet eller heteroaryleth eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo,  $-\text{NO}_2$ ,  $-\text{CN}$ ,  $-\text{SF}_5$ ,  $-\text{Si}(\text{CH}_3)_3$ ,  $-\text{O}-\text{R}^{20}$ ,  $-\text{S}-\text{R}^{20}$ ,  $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$ ,  $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$ ,  $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$ ,  $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$ ,  $-\text{N}(\text{R}^{20})-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{22}$ ,  $-\text{N}(\text{R}^{20})-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{22}$ ,  $-\text{N}(\text{R}^{20})-\text{S}(=\text{O})_2-\text{R}^{26}$ ,  $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{R}^{20}$ ,  $-\text{O}-\text{S}(=\text{O})_2-\text{R}^{20}$ ,  $-\text{S}(=\text{O})_2-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$ ,  $\text{C}_{1-6}\text{-alkyl}$ ,  $\text{C}_{2-4}\text{-alkenyl}$ ,  $\text{C}_{2-4}\text{-alkynyl}$ , sykloalkyl, aryl, heteroaryl og heterosyklyl; og

hvor  $\text{C}_{1-6}\text{-alkylet}$ ,  $\text{C}_{2-4}\text{-alkenylet}$ ,  $\text{C}_{2-4}\text{-alkynylet}$ , sykloalkylet,

20 arylet, heteroaryleth eller heterosyklylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo,  $-\text{NO}_2$ , fenyl, heterosyklyl, heteroaryl,  $\text{C}_{1-6}\text{-alkyl}$ , sykloalkyl,  $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$ ,  $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$ ,  $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$ ,  $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$ ,  $-\text{CN}$  og  $-\text{O}-\text{R}^{20}$ ;

n er 0;

25  $\text{R}^5$  er hydrogen eller  $\text{C}_{1-6}\text{-alkyl}$ ; og

$\text{R}^6$  er  $\text{C}_{1-6}\text{-alkyl}$ , sykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterosyklyl;

hvor  $\text{C}_{1-6}\text{-alkylet}$ , sykloalkylet, arylet, heteroaryleth eller heterosyklylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo,  $-\text{NO}_2$ ,  $\text{C}_{1-6}\text{-alkyl}$ , sykloalkyl, aryl, heterosyklyl, heteroaryl,  $-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$ ,  $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{20}$ ,  $-\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{20}$ ,  $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{R}^{20})(\text{R}^{22})$ ,  $-\text{CN}$  og  $-\text{O}-\text{R}^{20}$ ;

- hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, sykloalkylet, arylet, heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub>-alkyl, aralkyl, sykloalkyl, aryl, heterosyklyl, heteroaryl, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>; og
- hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, aralkylet, sykloalkylet, arylet, heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halo, -NO<sub>2</sub>, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>;
- 10       eller R<sup>5</sup> og R<sup>6</sup> kan gå sammen med atomet de er tilknyttet og danne et heterosyklyl eller heteroaryl;
- hvor heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, heterosyklyl, aryl, heteroaryl, okso, -CN, -O-R<sup>20</sup>, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -N(R<sup>20</sup>)-C(O)-R<sup>20</sup>, -N(R<sup>20</sup>)-C(O)-OR<sup>20</sup> og -C(O)-OR<sup>20</sup>; og
- hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet eller heterosyklylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, okso, heteroaryl og -O-R<sup>20</sup>.
- 20   10. Sammensetning ifølge krav 8, hvor:
- R<sup>1</sup> er aryl;
- hvor arylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, -CN, -SF<sub>5</sub>, -Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -O-R<sup>20</sup>, -S-R<sup>20</sup>, -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -N(R<sup>20</sup>)-C(O)-R<sup>22</sup>, -N(R<sup>20</sup>)-C(O)-OR<sup>22</sup>, -N(R<sup>20</sup>)-S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>26</sup>, -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>20</sup>, -O-S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>20</sup>, -S(-O)<sub>2</sub>-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), C<sub>1-6</sub>-alkyl, C<sub>2-4</sub>-alkenyl, C<sub>2-4</sub>-alkynyl, sykloalkyl, aryl, heteroaryl og heterosyklyl; og
- hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, C<sub>2-4</sub>-alkenylet, C<sub>2-4</sub>-alkynylet, sykloalkylet, arylet, heteroarylet eller heterosyklylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, fenyl, heterosyklyl,

heteroaryl, C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>;

n er 0;

R<sup>5</sup> er hydrogen eller C<sub>1-6</sub>-alkyl; og

5 R<sup>6</sup> er C<sub>1-15</sub> alkyl, sykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterosyklyl;

hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, sykloalkylet, arylet, heteroarylet eller heterosyklylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, aryl, heterosyklyl, heteroaryl, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>;

10 hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, sykloalkylet, arylet, heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub>-alkyl, aralkyl, sykloalkyl, aryl, heterosyklyl, heteroaryl, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>; og

15 hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, aralkylet, sykloalkylet, arylet, heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halo, -NO<sub>2</sub>, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>;

20 eller R<sup>5</sup> og R<sup>6</sup> kan gå sammen med atomet de er tilknyttet og danne et heterosyklyl eller heteroaryl;

hvor heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, heterosyklyl, aryl, heteroaryl, okso, -CN, -OR<sup>20</sup>, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -N(R<sup>20</sup>)-C(O)-R<sup>20</sup>, -N(R<sup>20</sup>)-C(O)-OR<sup>20</sup> og -C(O)-OR<sup>20</sup>; og

25 hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet eller heterosyklylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, okso, heteroaryl og -O-R<sup>20</sup>.

11. Sammensetning krav 8, hvor:

30 R<sup>1</sup> er aryl, eventuelt substituert med -O-R<sup>20</sup> eller C<sub>1-6</sub>-alkyl; og

hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet eventuelt er substituert med én, to eller tre halo;

n er 0;

R<sup>5</sup> er hydrogen eller C<sub>1-6</sub>-alkyl; og

R<sup>6</sup> er C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterosyklyl;

hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, sykloalkylet, arylet, heteroarylet eller heterosyklylet

- 5 eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, aryl, heterosyklyl, heteroaryl, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>;

hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, sykloalkylet, arylet, heterosyklylet eller

- 10 heteroarylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub>-alkyl, aralkyl, sykloalkyl, aryl, heterosyklyl, heteroaryl, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>; og

hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, aralkylet, sykloalkylet, arylet,

- 15 heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halo, -NO<sub>2</sub>, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>;

eller R<sup>5</sup> og R<sup>6</sup> kan gå sammen med atomet de er tilknyttet og danne et heterosyklyl eller heteroaryl;

- 20 hvor heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, heterosyklyl, aryl, heteroaryl, okso, -CN, -O-R<sup>20</sup>, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -N(R<sup>20</sup>)-C(O)-R<sup>20</sup>, -N(R<sup>20</sup>)-C(O)-OR<sup>20</sup> og -C(O)-OR<sup>20</sup>; og

- 25 hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet eller heterosyklylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, okso, heteroaryl og -O-R<sup>20</sup>.

## 12. Sammensetning krav 8, hvor:

R<sup>1</sup> er fenyl, substituert med -O-CF<sub>3</sub> eller -CF<sub>3</sub>;

n er 0;

- 30 R<sup>5</sup> er hydrogen eller C<sub>1-6</sub>-alkyl; og

R<sup>6</sup> er C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterosyklyl;

hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, sykloalkylet, arylet, heteroarylet eller heterosyklylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, aryl, heterosykyl, heteroaryl, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>;

5                hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, sykloalkylet, arylet, heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub>-alkyl, aralkyl, sykloalkyl, aryl, heterosykyl, heteroaryl, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>; og

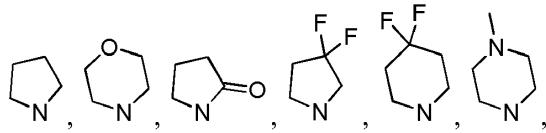
10              hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, aralkylet, sykloalkylet, arylet, heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halo, -NO<sub>2</sub>, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>;

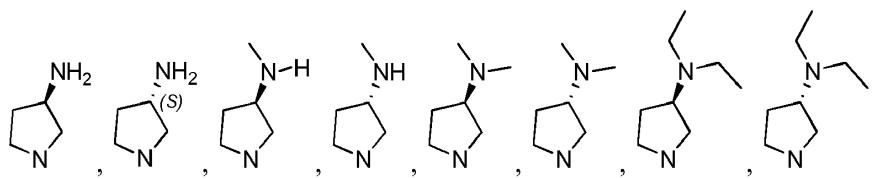
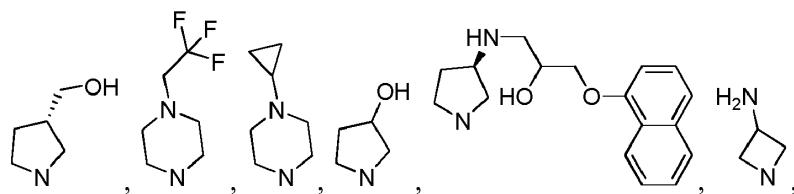
15              eller R<sup>5</sup> og R<sup>6</sup> kan gå sammen med atomet de er tilknyttet og danne et heterosykyl eller heteroaryl;

                  hvor heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, heterosykyl, aryl, heteroaryl, okso, -CN, -OR<sup>20</sup>, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -N(R<sup>20</sup>)-C(O)-R<sup>20</sup>, -N(R<sup>20</sup>)-C(O)-OR<sup>20</sup> og -C(O)-OR<sup>20</sup>; og

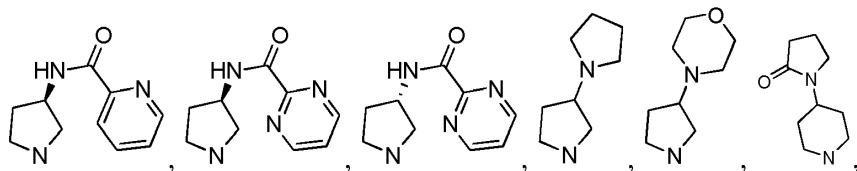
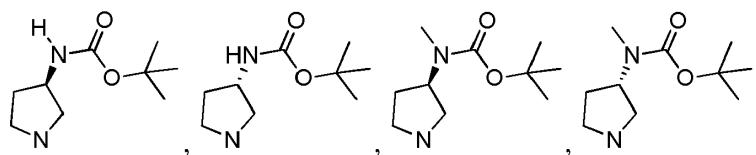
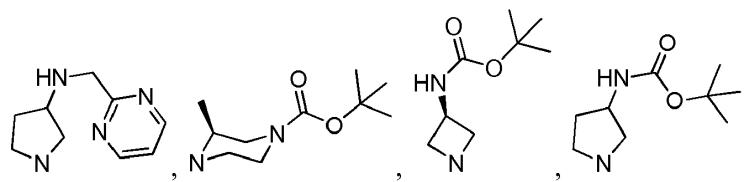
20              hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet eller heterosyklylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, okso, heteroaryl og -O-R<sup>20</sup>.

13. Sammensetning ifølge krav 8, hvor gruppene R<sup>5</sup> og R<sup>6</sup> kombinerer med nitrogenatomet de er tilknyttet og danner en heterosykylgruppe valgt fra gruppen bestående av

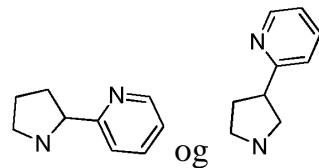




5



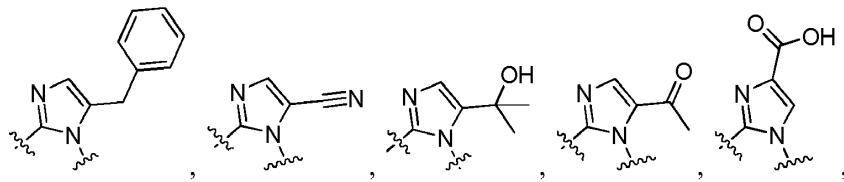
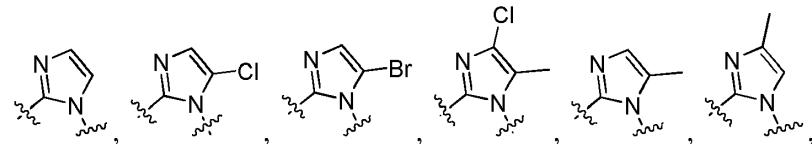
10



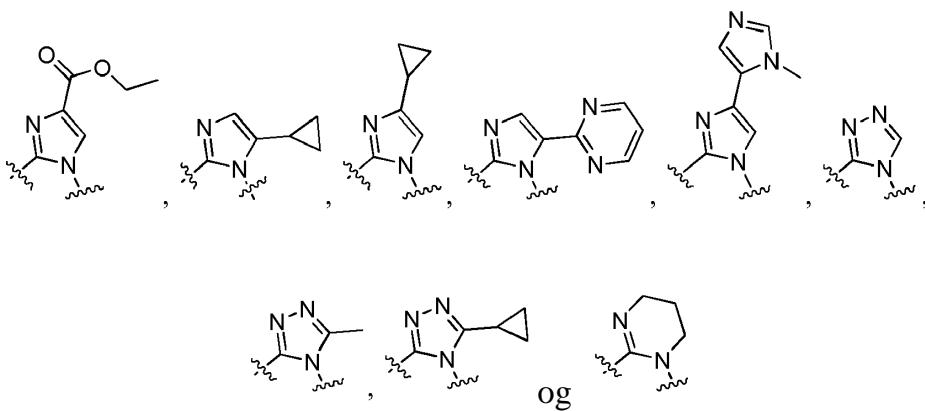
hvor tilknytningspunktet for oksazepinringen er ved det bivalente nitrogenatomet som tegnet.

15

14. Sammensetning ifølge krav1, hvor R<sup>2</sup> og R<sup>4</sup> går sammen med atomet de er tilknyttet og danner et heterosyklyl eller heteroaryl valgt fra gruppen bestående av



5



- 10 hvor de brutte linjene betegner tilknytningspunktene til oksazepinringen for å danne en trisyklisk gruppe.

15. Sammensetning ifølge krav 8, hvor forbindelsen med formel I er valgt fra gruppen bestående av:

II-1	5-morfolino-7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin
II-2	N-benzyl-7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin
II-3	5-(pyrrolidin-1-yl)-7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin
II-4	N-syklopropyl-7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin
II-5	N-benzyl-N-metyl-7-(4-(tritluorometyl)fenyl)-2,3-

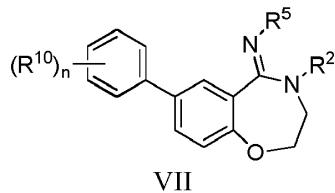
	dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin
II-9	N-((3-fluorpyridin-2-yl)metyl)-7-(4-(trifluormethyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin
II-10	N-(pyridin-2-ylmetyl)-7-(4-(trifluormethyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin
II-11	N-(syklopropylmetyl)-7-(4-(trifluormethyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin
II-13	(S)-tert-butyl 1-(7-(4-(trifluormethyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-yl)pyrrolidin-3-ylkarbamat
II-14	N-(2-(1H-imidazol-1-yl)ethyl)-7-(4-(trifluormethyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin
II-15	(S)-N,N-dimetyl-1-(7-(4-(trifluormethyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-yl)pyrrolidin-3-amin
II-19	N-(pyridin-2-yl)-7-(4-(trifluormethyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin
II-20	N-(2-(pyridin-2-yloksy)ethyl)-7-(4-(trifluormethyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin
II-22	N-(2-fenoksyethyl)-7-(4-(trifluormethyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin
II-24	N-(2-(2-klorofenoksy)ethyl)-7-(4-(trifluoromethyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin
II-25	7-(4-(trifluormethyl)fenyl)-N-((6-(trifluormethyl)pyridin-2-yl)metyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin
II-31	5-(4-syklopropylpiperazin-1-yl)-7-(4-(trifluormethyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin
II-32	N-fenyl-7-(4-(trifluormethyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin
II-33	N-((1-metyl-1H-benzo[d]imidazol-2-yl)metyl)-7-(4-(trifluormethyl)fenyl)-2,3-

	dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin
II-37	N-(pyrimidin-2-ylmethyl)-1-(7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-yl)pyrrolidin-3-amin
II-38	(R)-tert-butyl methyl(1-(7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-yl)pyrrolidin-3-yl)karbamat
II-39	(R)-N-metyl-1-(7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-yl)pyrrolidin-3-amin
II-40	(S)-tert-butyl methyl(1-(7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-yl)pyrrolidin-3-yl)karbamat
II-43	(S)-tert-butyl 3-(7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-ylamino)pyrrolidin-1-karboksylat
II-47	(R)-N-(1-(7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-yl)pyrrolidin-3-yl)pikolinamid
II-48	(S)-N,N-dietyl-1-(7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-yl)pyrrolidin-3-amin
II-50	(R)-tert-butyl 1-(7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-yl)pyrrolidin-3-ylkarbamat
II-51	(R)-N,N-dimetyl-1-(7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-yl)pyrrolidin-3-amin
II-54	N-fenyl-7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin
II-55	5-(3-morfolinopyrrolidin-1-yl)-7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin
II-56	(S)-1-(7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-yl)pyrrolidin-3-amin
II-57	tert-butyl 1-(7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-yl)pyrrolidin-3-ylkarbamat
II-58	5-(2-(pyridin-2-yl)pyrrolidin-1-yl)-7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-

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

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

- 5 16. Sammensetning omfattende en forbindelse med formel VII kombinasjon med minst ett terapeutisk middel:



10 hvor:

n er 0, 1, 2 eller 3:

hver R<sup>10</sup> uavhengig er valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, -CN, -SF<sub>5</sub>, -Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -O-R<sup>20</sup>, -S-R<sup>20</sup>, -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -N(R<sup>20</sup>)-C(O)-R<sup>22</sup>, -N(R<sup>20</sup>)-C(O)-OR<sup>22</sup>, -N(R<sup>20</sup>)-S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>26</sup>, -S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>20</sup>, -S(=O)<sub>2</sub>-

15 N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), C<sub>1-6</sub>-alkyl, C<sub>2-4</sub>-alkenyl, C<sub>2-4</sub>-alkynyl, sykloalkyl, aryl, heteroaryl og heterosyklyl; og

hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, C<sub>2-4</sub>-alkenylet, C<sub>2-4</sub>-alkynylet, sykloalkylet, arylet, heteroarylet eller heterosyklylet eventuelt er substituert med én, to eller tre

substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, fenyl, heterosyklyl, heteroaryl, C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>;

R<sup>2</sup> er hydrogen, C<sub>1-15</sub> alkyl, -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>26</sup>, -C(O)-N(R<sup>26</sup>)(R<sup>28</sup>), -

5 N(R<sup>20</sup>)-S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>20</sup>, sykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterosyklyl;

hvor C<sub>1-15</sub> alkylet, sykloalkylet, arylet, heteroarylet eller heterosyklylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av C<sub>1-6</sub>-alkyl, C<sub>2-4</sub>-alkynyl, halo, -NO<sub>2</sub>, sykloalkyl, aryl, heterosyklyl, heteroaryl, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN, okso og -O-

10 R<sup>20</sup>;

hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, sykloalkylet, arylet, heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub>-alkyl, sykloalkyl, aryl, heterosyklyl, heteroaryl, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>;

15 og

hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, sykloalkylet, arylet, heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, -CF<sub>3</sub>, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN, -S(O)<sub>2</sub>-R<sup>20</sup> og -O-R<sup>20</sup>;

20 R<sup>5</sup> er hydrogen, C<sub>1-15</sub> alkyl, C<sub>1-4</sub>-alkoksy, -C(O)-O-R<sup>26</sup>, -C(O)-N(R<sup>26</sup>)(R<sup>28</sup>), -N(R<sup>20</sup>)-S(=O)<sub>2</sub>-R<sup>20</sup>, sykloalkyl, aryl, heteroaryl eller heterosyklyl;

hvor C<sub>1-15</sub> alkylet eventuelt er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, sykloalkyl, aryl, heterosyklyl, heteroaryl, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>;

hvor sykloalkylet, arylet, heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo, -NO<sub>2</sub>, C<sub>1-6</sub>-alkyl, aralkyl, sykloalkyl, aryl, heterosyklyl, heteroaryl, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>;

30 og

- hvor C<sub>1-6</sub>-alkylet, aralkylet, sykloalkylet, arylet,  
heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt videre er substituert med én, to eller tre  
substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halo, -NO<sub>2</sub>, -  
N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -C(O)-R<sup>20</sup>, -C(O)-OR<sup>20</sup>, -C(O)-N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -CN og -O-R<sup>20</sup>;
- 5           eller R<sup>2</sup> og R<sup>5</sup> kan gå sammen med atomet de er tilknyttet og danne et  
heterosyklyl eller heteroaryl;  
                hvor heterosyklylet eller heteroarylet eventuelt er substituert med én, to  
                eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av C<sub>1-15</sub> alkyl, sykloalkyl,  
                heteroaryl, -O-R<sup>20</sup>, -N(R<sup>20</sup>)(R<sup>22</sup>), -N(R<sup>20</sup>)-C(O)-OR<sup>20</sup> og -C(O)-OR<sup>20</sup>; og
- 10           hvor C<sub>1-15</sub> alkylet eventuelt er substituert med én, to eller tre  
                substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av halo og heteroaryl;  
                R<sup>20</sup> og R<sup>22</sup> i hvert tilfelle uavhengig er valgt fra gruppen bestående av hydrogen,  
                C<sub>1-15</sub> alkyl, C<sub>2-15</sub> alkenyl, C<sub>2-15</sub> alkynyl, sykloalkyl, heterosyklyl, aryl og heteroaryl; og  
                hvor C<sub>1-15</sub> alkylet, C<sub>2-15</sub> alkenylet, C<sub>2-15</sub> alkynylet, sykloalkylet,  
15           heterosyklylet, arylet og heteroarylet eventuelt er substituert med én, to eller tre  
                substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halo, C<sub>1-4</sub>-alkyl,  
                acylamino, -NO<sub>2</sub>, -SO<sub>2</sub>R<sup>26</sup>, -CN, C<sub>1-4</sub>-alkoksy, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -C(O)-NH<sub>2</sub>,  
                aryl, sykloalkyl og heteroaryl;  
                hvor heteroarylet eventuelt videre er substituert med C<sub>1-4</sub>-alkyl  
20           eller sykloalkyl; eller  
                når R<sup>20</sup> og R<sup>22</sup> er knyttet til et felles nitrogenatom, R<sup>20</sup> og R<sup>22</sup> kan gå sammen og  
                danne en heterosyklisk ring eller heteroarylring som så eventuelt blir substituert med  
                én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halo,  
                C<sub>1-4</sub>-alkyl, aralkyl, aryl, aryloksy, aralkyloksy, acylamino, -NO<sub>2</sub>, -SO<sub>2</sub>R<sup>26</sup>, -CN, C<sub>1-3</sub>-  
25           alkoksy, -CF<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, aryl, heteroaryl og sykloalkyl;  
                R<sup>25</sup> i hvert tilfelle uavhengig er en kovalent binding eller C<sub>1-3</sub>-alkylen, eventuelt  
                substituert med én eller to C<sub>1-3</sub> alkylgrupper; og  
                R<sup>26</sup> og R<sup>28</sup> i hvert tilfelle uavhengig er valgt fra gruppen bestående av hydrogen,  
                C<sub>1-4</sub>-alkyl, aryl og sykloalkyl; og

hvor C<sub>1-4</sub>-alkylet, arylet og sykloalkylet videre kan være substituert med fra 1 til 3 substituenter uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydroksyl, halo, C<sub>1-4</sub>-alkoksy, -CF<sub>3</sub> og -OCF<sub>3</sub>;

eller et farmasøytisk akseptabelt salt, en ester, en hydrat, et solvat, en

- 5 stereoisomer, en blanding av stereoisomerer, en tautomer og/eller en polymorf derav.

17. Sammensetning ifølge krav 16, hvor, når R<sup>2</sup> og R<sup>5</sup> går sammen med atomet de er tilknyttet og danner et eventuelt substituert imidazolyl, imidazolylet ikke er direkte substituert med en eventuelt substituert triazolyl, eller R<sup>1</sup> ikke eventuelt er substituert  
10 pyrazolyl, 2-pyridinonyl eller 2-fluorpyridinyl.

18. Sammensetning ifølge krav 16, omfattende N-(syklopropylmetyl)-7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-amin eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

15

19. Sammensetning ifølge krav 16, omfattende (R)-tert-butyl 3-(7-(4-(trifluormetyl)fenyl)-2,3-dihydrobenzo[f][1,4]oksazepin-5-ylamino)pyrrolidin-1-karboksylat eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

20 20. Sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 19 for bruk i terapi.

21. Sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 19 for bruk ved behandling av kardiovaskulære sykdommer eller lidelser, fortrinnsvis angina, inkludert stabil angina, ustabil angina, treningsutløst angina, variantangina, arytmier, claudicatio  
25 intermettens, myokardialt infarkt, herunder ikke-STE myokardialt infarkt, pulmonær hypertensjon, herunder pulmonær arteriell hypertensjon, hjertesvikt, herunder kongestiv hjertesvikt og diastolisk hjertesvikt og hjertesvikt med bevart ejeksjonsfraksjon, akutt hjertesvikt eller residiverende iskemi.

30 22. Sammensetning for bruk ifølge krav 21, hvor det andre terapeutiske middelet er valgt fra gruppen bestående av antianginamidler, hjertesviktmidler, antitrombotiske

midler, antiarytmika, antihypertensiva og lipidsenkende midler.

23. Sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 19 for bruk ved behandling av pulmonære lidelser, fortrinnsvis astma, kronisk obstruktiv pulmonær sykdom, bronkitt og emfysem.

24. Sammensetning for bruk ifølge krav 23, hvor det andre terapeutiske middelet er valgt fra gruppen bestående av beta2-agonister, antikolinergika, kortikosteroider og elektrolyttilskudd.

10

25. Sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 19 for bruk ved behandling av metabolske lidelser, fortrinnsvis diabetes, herunder type I og type II diabetes, metabolsk syndrom, dyslipidemi, obesitet, glukoseintoleranse, hypertensjon, forhøyet serumkolesterol og forhøyede triglyserider.

15

26. Sammensetning for bruk ifølge krav 25, hvor det andre terapeutiske middelet er valgt fra gruppen bestående av antihypertensiva, lipidsenkende midler, insulin, sulfonylureaer, biguanider, alfaglukosidasehemmere og inkretinmimetika.

20 27. Sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 19 for bruk ved behandling av gastrointestinale lidelser, fortrinnsvis gastroøsofageal reflukssykdom (GERD), inflammatorisk tarmsykdom (IBD), gastroenteritt, gastritt og peptisk magesår og pankreatitt.

25 28. Sammensetning for bruk ifølge krav 27, hvor det andre terapeutiske middelet er valgt fra gruppen bestående av protonpumpehemmere, H2-blokkere, prostaglandiner, og antacida.

30 29. Sammensetning for bruk i terapi ifølge krav 20, hvor det andre terapeutiske middelet er valgt fra gruppen bestående av antibiotika, smertestillende midler, antidepressiva og beroligende midler.