



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3077395 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61P 35/00 (2006.01)
A61K 31/4375 (2006.01)
C07D 471/04 (2006.01)
C07D 471/08 (2006.01)
C07D 487/04 (2006.01)
C07D 487/10 (2006.01)
C07D 498/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2018.03.12
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2017.11.15
(86)	European Application Nr.	14816404.9
(86)	European Filing Date	2014.11.20
(87)	The European Application's Publication Date	2016.10.12
(30)	Priority	2013.12.05, US, 201361912074 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	Pfizer Inc., 235 East 42nd Street, New York, NY 10017, US-USA
(72)	Inventor	BROWN, Matthew Frank, 443 Wheeler Road, Stonington, Connecticut 06378, US-USA CASIMIRO-GARCIA, Agustin, 61 Woodland Road, Concord, Massachusetts 01742, US-USA CHE, Ye, 166 Ledgewood Road Apartment 308, Groton, Connecticut 06340, US-USA COE, Jotham Wadsworth, 8 Bush Hill Drive, Niantic, Connecticut 06357, US-USA FLANAGAN, Mark Edward, 10 Queen Eleanor Drive, Gales Ferry, Connecticut 06335, US-USA GILBERT, Adam Matthew, 178 Denison Drive, Guilford, Connecticut 06437, US-USA HAYWARD, Matthew Merrill, 3 Pyrus Court, Old Lyme, Connecticut 06371, US-USA LANGILLE, Jonathan David, 15 Clark Place, Quaker Hill, Connecticut 06375, US-USA MONTGOMERY, Justin Ian, 61 Spicer Hill Road, Ledyard, Connecticut 06339, US-USA TELLIEZ, Jean-Baptiste, 211 East Emerson Road, Lexington, Massachusetts 02420, US-USA

THORARENSEN, Atli, 581 Great Road, Stow, Massachusetts 01775, US-USA
UNWALLA, Raymond Jal, 22 Fox Run Road, Bedford, Massachusetts 01730, US-
USA
TRUJILLO, John I, 33 Saw Mill Drive, Ledyard, Connecticut 06339, US-USA

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

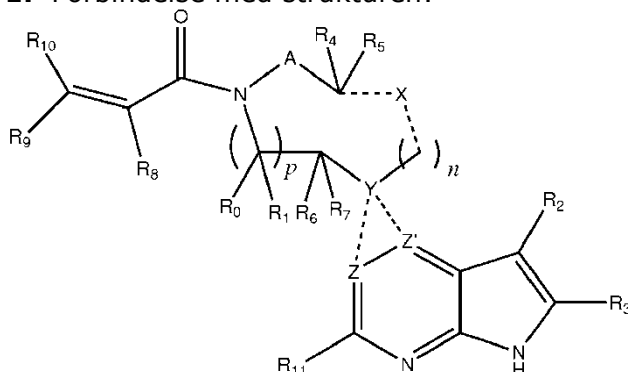
(54) Title **PYRROLO[2,3-D]PYRIMIDINYL, PYRROLO[2,3-B]PYRAZINYL AND PYRROLO[2,3-D]PYRIDINYL ACRYLAMIDES**

(56) References
Cited: WO-A1-99/65909, WO-A1-02/00661

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 strukturen:



5 eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav, eller en enantiomer eller diastereomer derav, og hvori

10 R_2 er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, deuterium, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_3 - C_6 -sykloalkyl, C_6 - C_{10} aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, (aryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heterosyklus) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkoksy, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkoksy, halogen, cyano, hydroksyl, amino, karboksy, aminokarbonyl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aminokarbonylamino, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aminokarbonyl, - SOR_{12} , - SO_2R_{12} , - $NR_{13}SO_2R_{12}$, - $SO_2NR_{13}R_{14}$ og - $NR_{13}SO_2NR_{14}R_{15}$; hvor alkylet, arylet og heteroarylet eventuelt er uavhengig substituert med én eller flere substituenter valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, cyano, alkylamino, dialkylamino, CF_3 , aminokarbonyl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aminokarbonyl og C_3 - C_6 sykloalkyl;

R_3 er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, deuterium, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, halogen og cyano;

25 A er --(CR_aR_b) $_q$ -(CR_cR_d) $_r$ --, hvori R_a , R_b , R_c og R_d er uavhengig valgt fra hydrogen, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C_6 - C_{10} aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, alkylaryl, (aryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, halogen, cyano, hydroksyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkoksy, amino, karboksy, aminokarbonyl, (heterosyklus) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl, and (C_1 - C_6 lineært eller

forgrenet alkyl)heterosyklus, hvor videre alkylet eventuelt er substituert med én eller flere substituentter valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, alkylamino, dialkylamino, CF₃ og C₃-C₆ sykloalkyl;

5 R₀, R₁, R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, R₉ og R₁₀ er uavhengig valgt fra hydrogen, C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, C₁-C₆ lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C₆-C₁₀ aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, (aryl)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, heteroaryl, halogen, cyano, hydroksyl, C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, heteroaryl, halogen, cyano, hydroksyl, C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, heteroaryl, halogen, cyano, hydroksyl, C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, (heterosyklus)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl og (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, hvor videre alkylet eventuelt er substituert med én eller flere substituentter valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, alkylamino, dialkylamino, CF₃ og C₃-C₆ sykloalkyl; hvor alternativt R₀ eller R₁, og/eller R₆ eller R₇, henholdsvis sammen med én av R₄, R₅, R_a, R_b, R_c eller R_d, uavhengig kan danne en binding eller en lineær C₁-C₆-alkylkjede; og/eller alternativt kan R₄ eller R₅, henholdsvis sammen med én av R_a, R_b, R_c eller R_d, uavhengig danne en binding eller en lineær C₁-C₆-alkylkjede; og/eller alternativt kan R₈ og R₉ sammen danne en 3-6-leddet ring som eventuelt inneholder ett eller to O- eller N-atomer;

R₁₁ er hydrogen eller deuterium;

R₁₂, R₁₃, R₁₄ og R₁₅ er uavhengig valgt fra hydrogen, C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, C₁-C₆ lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C₆-C₁₀ aryl, alkylaryl og (aryl)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl;

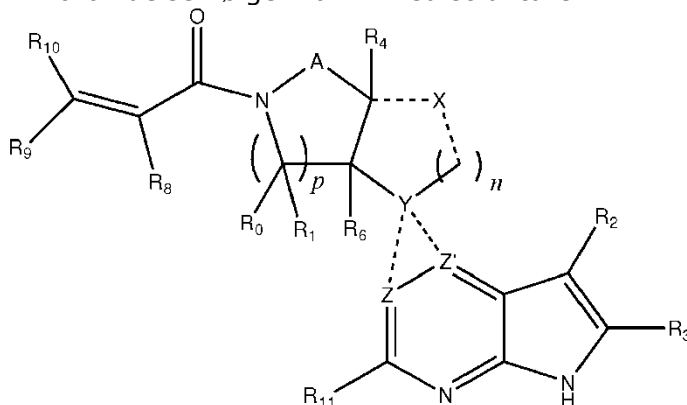
25 Y er O eller N, hvor når Y er O, er $n \geq 0$;

én, og kun én, av de stiplede bindingene til Z og Z' danner en enkeltbinding, der den andre er fraværende, og enten er Z C når den stiplede bindingen til Z er en enkeltbinding, og Z' er N eller CR₁₆; eller Z er CR₁₆ eller N når den stiplede bindingen til Z' er en enkeltbinding, og Z' er C; hvor R₁₆ er C₁-C₄ alkyl, C₆-C₁₀ aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, (aryl)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, (heterosyklus)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl eller (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, hvor videre alkylet eventuelt er substituert med én eller flere substituentter valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, CF₃ og C₃-C₆ sykloalkyl;

X og de stiplede bindingene dertil, kan være til stede eller fraværende, hvorved (a) hvis X er til stede, er Y N, og X er O eller $--(CR_eR_f)_s--$, hvor R_e og R_f er uavhengig hydrogen, deuterium, halo, hydroksoy, C_1-C_4 alkoksy, amino, CF_3 , C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_3-C_6 sykloalkyl, C_6-C_{10} aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, (aryl) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl, (heteroaryl) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl eller (heterosyklus) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, og de stiplede bindingene er til stede og er enkeltbindinger, hvorved når n er 0 og X er O, er O bundet til H, og den stiplede bindingen mellom X og $--(CH_2)_n--$ er fraværende, og når X er $--(CR_eR_f)_s--$ og X er direkte bundet til Y; og (b) hvis X er fraværende, er de stiplede bindingene fraværende og n er 0, hvorved når Y er N, er enten (i) N-atomet substituert med H, (ii) Z er C, Z' er C eller N, den stiplede bindingen til Z er en enkeltbinding, den stiplede bindingen til Z' er fraværende, eller (iii) Z er C eller N, Z' er C, den stiplede bindingen til Z' er en enkeltbinding, den stiplede bindingen til Z er fraværende, hvor Y, som er et N-atom, kan sammen med R_2 og de mellomliggende atomene danne en 6-leddet ring eventuelt substituert med C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl eller C_3-C_6 sykloalkyl; og n, p, q, r og s er uavhengig 0, 1 eller 2.

20

2. Forbindelse ifølge krav 1 med strukturen:



25

eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav, eller en enantiomer eller diastereomer derav, og hvori

30

R_2 er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, deuterium, C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_3-C_6 -sykloalkyl, C_6-C_{10} aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, (aryl) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heterosyklus) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C_1-C_6

lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, C₁-C₆ lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkoksy, C₁-C₆ lineært eller forgrenet perfluoralkoksy, halogen, cyano, hydroksyl, amino, karboksy, aminokarbonyl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)aminokarbonylamino, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)aminokarbonyl, -SOR₁₂, -SO₂R₁₂, -NR₁₃SO₂R₁₂, -SO₂NR₁₃R₁₄ og -NR₁₃SO₂NR₁₄R₁₅; hvor alkylet, arylet og heteroarylet eventuelt er uavhengig substituert med én eller flere substituenten valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, cyano, alkylamino, dialkylamino, CF₃, aminokarbonyl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)aminokarbonyl og C₃-C₆ sykloalkyl;

R₃ er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, deuterium, C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, C₁-C₆ lineært eller forgrenet perfluoralkyl, halogen og cyano;

A er --(CR_aR_b)_q-(CR_cR_d)_r--, hvori R_a, R_b, R_c og R_d er uavhengig valgt fra hydrogen, C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, C₁-C₆ lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C₆-C₁₀ aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, alkylaryl, (aryl)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, halogen, cyano, hydroksyl, C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkoksy, amino, karboksy, aminokarbonyl, (heterosyklus)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl, and (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, hvor videre alkylet eventuelt er substituert med én eller flere substituenten valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, alkylamino, dialkylamino, CF₃ og C₃-C₆ sykloalkyl;

R₀, R₁, R₄, R₆, R₈, R₉ og R₁₀ er uavhengig valgt fra hydrogen, C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, C₁-C₆ lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C₆-C₁₀ aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, (aryl)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, heteroaryl, halogen, cyano, hydroksyl, C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkoksy, amino, karboksy, aminokarbonyl, (heterosyklus)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl og (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, hvor videre alkylet eventuelt er substituert med én eller flere substituenten valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, alkylamino, dialkylamino, CF₃ og C₃-C₆ sykloalkyl; hvor alternativt R₀ eller R₁, og/eller R₆, henholdsvis sammen med én av R₄, R_a, R_b, R_c eller R_d, kan uavhengig danne en binding eller en lineær C₁-C₆-alkylkjede; og/eller alternativt kan R₄, henholdsvis med én av R_a, R_b, R_c eller R_d, uavhengig danne en binding eller en lineær C₁-C₆-

alkylkjede; og/eller alternativt kan R_8 og R_9 sammen danne en 3-6-leddet ring som eventuelt inneholder ett eller to O- eller N-atomer;

R_{11} er hydrogen eller deuterium;

5 R_{12} , R_{13} , R_{14} og R_{15} er uavhengig valgt fra hydrogen, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C_6 - C_{10} aryl, alkylaryl og (aryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl;

Y er O eller N, hvor når Y er O, er $n \geq 0$;

10 én, og kun én, av de stiplede bindingene til Z og Z' danner en enkeltbinding, der den andre er fraværende, og enten er Z C når den stiplede bindingen til Z er en enkeltbinding, og Z' er N eller CR_{16} ; eller Z er CR_{16} eller N når den stiplede bindingen til Z' er en enkeltbinding, og Z' er C; hvor R_{16} er C_1 - C_4 alkyl, C_6 - C_{10} aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, (aryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heterosyklus) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl eller (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, hvor videre alkylet eventuelt er substituert med én eller flere substituenten valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, CF_3 og C_3 - C_6 sykloalkyl;

20 X og de stiplede bindingene dertil, kan være til stede eller fraværende, hvorved (a) hvis X er til stede, er Y N, og X er O eller $--(CR_eR_f)_s--$, hvor R_e og R_f er uavhengig hydrogen, deuterium, halo, hydroksy, C_1 - C_4 alkoksy, amino, CF_3 , C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_3 - C_6 sykloalkyl, C_6 - C_{10} aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, (aryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl, (heteroaryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl eller (heterosyklus) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, og de stiplede bindingene er til stede og er enkeltbindinger, hvorved når n er 0 og X er O, er O bundet til H, og den stiplede bindingen mellom X og $--(CH_2)_n--$ er fraværende, og når X er $--(CR_eR_f)_s--$ og X er direkte bundet til Y; og (b) hvis X er fraværende, er de stiplede bindingene fraværende

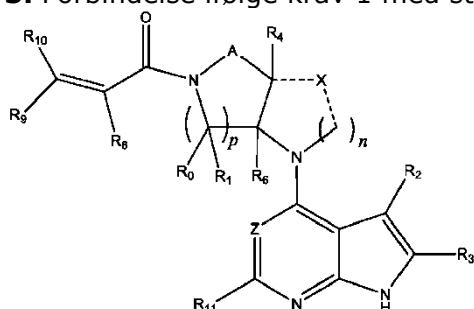
25 og n er 0, hvorved når Y er N, er enten (i) N-atomet substituert med H, (ii) Z er C, Z' er C eller N, den stiplede bindingen til Z er en enkeltbinding, den stiplede bindingen til Z' er fraværende, eller (iii) Z er C eller N, Z' er C, den stiplede bindingen til Z' er en enkeltbinding, den stiplede bindingen til Z er fraværende, hvor Y, som er et N-atom, kan sammen med R_2 og de mellomliggende atomene danne en 6-leddet ring eventuelt substituert med C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl eller C_3 - C_6 sykloalkyl; og

30

35

n , p , q , r og s er uavhengig 0, 1 eller 2.

3. Forbindelse ifølge krav 1 med strukturen:



- 5 eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav, eller en enantiomer eller diastereomer derav, og hvori
- R_2 er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, deuterium, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_3 - C_6 -sykloalkyl, C_6 - C_{10} aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, (aryl) C_1 - C_6 lineært eller
- 10 forgrenet alkyl, (heteroaryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heterosyklus) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkoksy, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkoksy, halogen, cyano,
- 15 hydroksyl, amino, karboksy, aminokarbonyl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aminokarbonylamino, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aminokarbonyl, - SOR_{12} , - SO_2R_{12} , - $NR_{13}SO_2R_{12}$, - $SO_2NR_{13}R_{14}$ og - $NR_{13}SO_2NR_{14}R_{15}$; hvor alkylet, arylet og heteroarylet eventuelt er uavhengig substituert med én eller flere
- 20 substituenten valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, cyano, alkylamino, dialkylamino, CF_3 , aminokarbonyl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aminokarbonyl og C_3 - C_6 sykloalkyl;
- R_3 er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, deuterium, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, halogen og cyano;
- 25 A er $--(CR_aR_b)_q-(CR_cR_d)_r--$, hvori R_a , R_b , R_c og R_d er uavhengig valgt fra hydrogen, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C_6 - C_{10} aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, alkylaryl, (aryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, halogen, cyano, hydroksyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkoksy, amino, karboksy, aminokarbonyl,
- 30 (heterosyklus) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl, and (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, hvor videre alkylet eventuelt er substituert med én

eller flere substituenten valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, alkylamino, dialkylamino, CF₃ og C₃-C₆ sykloalkyl;

5 R₀, R₁, R₄, R₆, R₈, R₉ og R₁₀ er uavhengig valgt fra hydrogen, C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, C₁-C₆ lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C₆-C₁₀ aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, (aryl)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, heteroaryl, halogen, cyano, hydroksyl, C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkoksy, amino, karboksy, aminokarbonyl, (heterosyklus)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl og (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, hvor videre alkylet eventuelt er substituert med én eller flere substituenten valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, alkylamino, dialkylamino, CF₃ og C₃-C₆ sykloalkyl; hvor alternativt R₀ eller R₁, og/eller R₆, henholdsvis sammen med én av R₄, R_a, R_b, R_c eller R_d, kan uavhengig danne en binding eller en lineær C₁-C₆-alkylkjede; og/eller alternativt kan R₄, henholdsvis med én av R_a, R_b, R_c eller R_d, uavhengig danne en binding eller en lineær C₁-C₆-alkylkjede; og/eller alternativt kan R₈ og R₉ sammen danne en 3-6-leddet ring som eventuelt inneholder ett eller to O- eller N-atomer;

R₁₁ er hydrogen eller deuterium;

20 R₁₂, R₁₃, R₁₄ og R₁₅ er uavhengig valgt fra hydrogen, C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, C₁-C₆ lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C₆-C₁₀ aryl, alkylaryl og (aryl)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl;

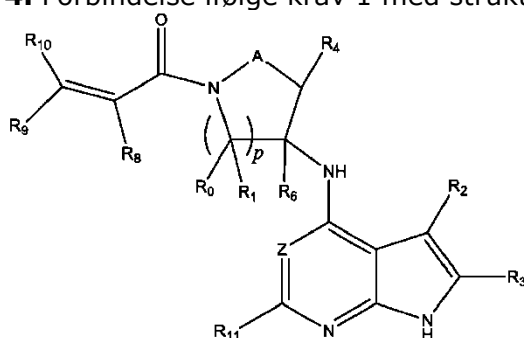
Z er CR₁₆ eller N, hvor R₁₆ er C₁-C₄ alkyl, C₆-C₁₀ aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, (aryl)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, (heterosyklus)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl eller (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, hvor videre alkylet eventuelt er substituert med én eller flere substituenten valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, CF₃ og C₃-C₆ sykloalkyl;

30 X og de stiplede bindingene dertil kan være til stede eller fraværende, hvorved (a) hvis X er til stede, er X O eller --(CR_eR_f)_s--, hvor R_e og R_f er uavhengig hydrogen, deuterium, halo, hydroksy, C₁-C₄ alkoksy, amino, CF₃, C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, C₃-C₆ sykloalkyl, C₆-C₁₀ aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, (aryl)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl, (heteroaryl)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl eller (heterosyklus)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl,

og de stiplede bindingene er til stede og er enkeltbindinger, hvorved når n er 0 og X er O, er O bundet til H, og den stiplede bindingen mellom X og $--(CH_2)_n--$ er fraværende; og (b) hvis X er fraværende, er de stiplede bindingene fraværende og n er 0, hvorved enten (i) er det inntilliggende N-atomet substituert med H, eller (ii) N-atomet kan sammen med R_2 og de mellomliggende atomene danne en 6-leddet ring eventuelt substituert med C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl eller C_3 - C_6 sykloalkyl; og n, p, q, r og s er uavhengig 0, 1 eller 2.

10

4. Forbindelse ifølge krav 1 med strukturen:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav, eller en enantiomer eller diastereomer derav, og hvori

15

R_2 er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, deuterium, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_3 - C_6 -sykloalkyl, C_6 - C_{10} aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, (aryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heterosyklus) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkoksy, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkoksy, halogen, cyano, hydroksyl, amino, karboksy, aminokarbonyl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aminokarbonylamino, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aminokarbonyl, - SOR_{12} , - SO_2R_{12} , - $NR_{13}SO_2R_{12}$, - $SO_2NR_{13}R_{14}$ og - $NR_{13}SO_2NR_{14}R_{15}$; hvor alkylet, arylet og heteroarylet eventuelt er uavhengig substituert med én eller flere substituenten valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, cyano, alkylamino, dialkylamino, CF_3 , aminokarbonyl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aminokarbonyl og C_3 - C_6 sykloalkyl;

30

R_3 er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, deuterium, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, halogen og cyano;

A er $--(CR_aR_b)_q-(CR_cR_d)_r--$, hvori R_a , R_b , R_c og R_d er uavhengig valgt fra hydrogen, C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_1-C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C_6-C_{10} aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, alkylaryl, (aryl) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, halogen, cyano, hydroksyl, C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkoksy, amino, karboksy, aminokarbonyl, (heterosyklus) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl, and (C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, hvor videre alkylet eventuelt er substituert med én eller flere substituenten valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, alkylamino, dialkylamino, CF_3 og C_3-C_6 sykloalkyl;

R_0 , R_1 , R_4 , R_6 , R_8 , R_9 og R_{10} er uavhengig valgt fra hydrogen, C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_1-C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C_6-C_{10} aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, (aryl) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, heteroaryl, halogen, cyano, hydroksyl, C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkoksy, amino, karboksy, aminokarbonyl, (heterosyklus) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl og (C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, hvor videre alkylet eventuelt er substituert med én eller flere substituenten valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, alkylamino, dialkylamino, CF_3 og C_3-C_6 sykloalkyl; hvor alternativt R_0 eller R_1 , og/eller R_6 , henholdsvis sammen med én av R_4 , R_a , R_b , R_c eller R_d , kan uavhengig danne en binding eller en lineær C_1-C_6 -alkylkjede; og/eller alternativt kan R_4 , henholdsvis med én av R_a , R_b , R_c eller R_d , uavhengig danne en binding eller en lineær C_1-C_6 -alkylkjede; og/eller alternativt kan R_8 og R_9 sammen danne en 3-6-leddet ring som eventuelt inneholder ett eller to O- eller N-atomer;

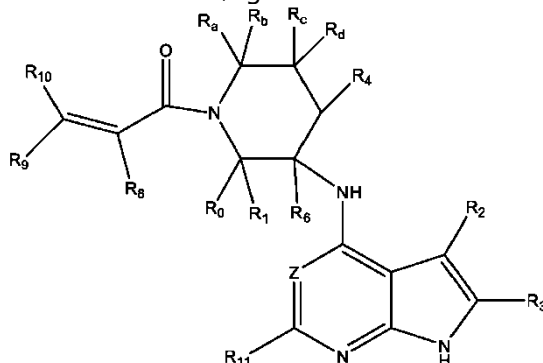
Z er CR_{16} eller N, hvor R_{16} er C_1-C_4 alkyl, C_6-C_{10} aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, (aryl) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heterosyklus) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl eller (C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, hvor videre alkylet eventuelt er substituert med én eller flere substituenten valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, CF_3 og C_3-C_6 sykloalkyl;

R_{11} er hydrogen eller deuterium;

R_{12} , R_{13} , R_{14} og R_{15} er uafhængig valgt fra hydrogen, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C_6 - C_{10} aryl, alkylaryl og (aryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl; og p , q og r er uafhængig 0, 1 eller 2.

5

5. Forbindelse ifølge krav 1 med strukturen:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav, eller en enantiomer eller diastereomer derav, og hvori

10

R_2 er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, deuterium, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_3 - C_6 -sykloalkyl, C_6 - C_{10} aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, (aryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkoksy, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkoksy, halogen, cyano, hydroksyl, amino, karboksy, aminokarbonyl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aminokarbonylamino, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aminokarbonyl, - SOR_{12} , - SO_2R_{12} , - $NR_{13}SO_2R_{12}$, - $SO_2NR_{13}R_{14}$ og - $NR_{13}SO_2NR_{14}R_{15}$; hvor alkylet, arylet og heteroarylet eventuelt er uafhængig substituert med én eller flere substituentter valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, cyano, alkylamino, dialkylamino, CF_3 , aminokarbonyl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aminokarbonyl og C_3 - C_6 sykloalkyl;

15

20

25

R_3 er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, deuterium, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, halogen og cyano;

R_a , R_b , R_c og R_d er uafhængig valgt fra hydrogen, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, aryl, alkylaryl, (aryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, heteroaryl, halogen, cyano, hydroksyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkoksy,

30

amino, karboksy, aminokarbonyl, (heterosyklus) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl og (C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, hvor videre alkylet eventuelt er substituert med én eller flere substituentter valgt fra gruppen

5

bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, alkylamino, dialkylamino, CF_3 og C_3-C_6 sykloalkyl;
 R_0 , R_1 , R_4 , R_6 , R_8 , R_9 og R_{10} er uavhengig valgt fra hydrogen, C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_1-C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C_6-C_{10} aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, (aryl) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, heteroaryl, halogen, cyano, hydroksyl, C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkoksy, amino, karboksy, aminokarbonyl, (heterosyklus) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl og (C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, hvor videre alkylet eventuelt er substituert med én eller flere substituentter valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, alkylamino, dialkylamino, CF_3 og C_3-C_6 sykloalkyl; hvor alternativt R_0 eller R_1 , og/eller R_6 , henholdsvis sammen med én av R_4 , R_a , R_b , R_c eller R_d , kan uavhengig danne en binding eller en lineær C_1-C_6 -alkylkjede; og/eller alternativt kan R_4 , henholdsvis med én av R_a , R_b , R_c eller R_d , uavhengig danne en binding eller en lineær C_1-C_6 -alkylkjede; og/eller alternativt kan R_8 og R_9 sammen danne en 3-6-leddet ring som eventuelt inneholder ett eller to O- eller N-atomer;

10

15

20

Z er CR_{16} eller N, hvor R_{16} er C_1-C_4 alkyl, C_6-C_{10} aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, (aryl) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heterosyklus) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl eller (C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, hvor videre alkylet eventuelt er substituert med én eller flere substituentter valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, CF_3 og C_3-C_6 sykloalkyl;

25

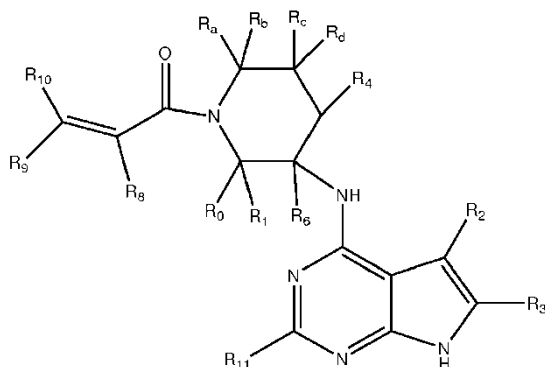
30

R_{11} er hydrogen eller deuterium; og

R_{12} , R_{13} , R_{14} og R_{15} er uavhengig valgt fra hydrogen, C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_1-C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C_6-C_{10} aryl, alkylaryl og (aryl) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl.

35

6. Forbindelse ifølge krav 1 med strukturen:

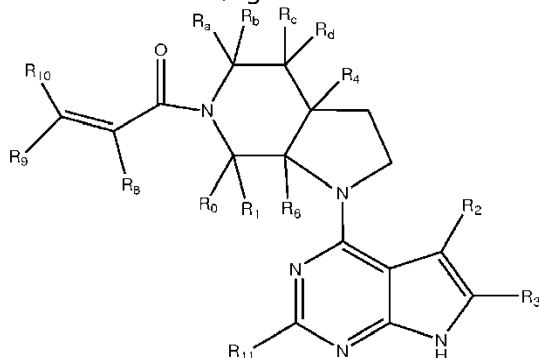


eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav, eller en enantiomer eller diastereomer derav, og hvori

- 5 R₂ er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, deuterium, C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, C₃-C₆-sykloalkyl, C₆-C₁₀ aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, (aryl)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, (heterosyklus)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, C₁-C₆ lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkoksy, C₁-C₆ lineært eller forgrenet perfluoralkoksy, halogen, cyano, hydroksyl, amino, karboksy, aminokarbonyl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)aminokarbonylamino, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)aminokarbonyl, -SOR₁₂, -SO₂R₁₂, -NR₁₃SO₂R₁₂, -SO₂NR₁₃R₁₄ og -NR₁₃SO₂NR₁₄R₁₅; hvor alkylet, arylet og heteroarylet eventuelt er uavhengig substituert med én eller flere substituenter valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, cyano, alkylamino, dialkylamino, CF₃, aminokarbonyl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)aminokarbonyl og C₃-C₆ sykloalkyl;
- 10 R₃ er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, deuterium, C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, C₁-C₆ lineært eller forgrenet perfluoralkyl, halogen og cyano;
- 15 R_a, R_b, R_c og R_d er uavhengig valgt fra hydrogen, C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, C₁-C₆ lineært eller forgrenet perfluoralkyl, aryl, alkylaryl, (aryl)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, heteroaryl, halogen, cyano, hydroksyl, C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkoksy, amino, karboksy, aminokarbonyl, (heterosyklus)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl og (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, hvor videre alkylet eventuelt er substituert med én eller flere substituenter valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, alkylamino, dialkylamino, CF₃ og C₃-C₆ sykloalkyl;
- 20
- 25
- 30

R_0 , R_1 , R_4 , R_6 , R_8 , R_9 og R_{10} er uavhengig valgt fra hydrogen, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C_6 - C_{10} aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, (aryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, heteroaryl, halogen, cyano, hydroksyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkoksy, amino, karboksy, aminokarbonyl, (heterosyklus) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl og (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, hvor videre alkylet eventuelt er substituert med én eller flere substituenten valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, alkylamino, dialkylamino, CF_3 og C_3 - C_6 sykloalkyl; hvor alternativt R_0 eller R_1 , og/eller R_6 , henholdsvis sammen med én av R_4 , R_a , R_b , R_c eller R_d , kan uavhengig danne en binding eller en lineær C_1 - C_6 -alkylkjede; og/eller alternativt kan R_4 , henholdsvis med én av R_a , R_b , R_c eller R_d , uavhengig danne en binding eller en lineær C_1 - C_6 -alkylkjede; og/eller alternativt kan R_8 og R_9 sammen danne en 3-6-leddet ring som eventuelt inneholder ett eller to O- eller N-atomer; R_{11} er hydrogen eller deuterium; og R_{12} , R_{13} , R_{14} og R_{15} er uavhengig valgt fra hydrogen, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C_6 - C_{10} aryl, alkylaryl og (aryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl.

7. Forbindelse ifølge krav 1 med strukturen:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav, eller en enantiomer eller diastereomer derav, og hvori R_2 er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, deuterium, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_3 - C_6 -sykloalkyl, C_6 - C_{10} aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, (aryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heterosyklus) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C_1 - C_6

lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, C₁-C₆ lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkoksy, C₁-C₆ lineært eller forgrenet perfluoralkoksy, halogen, cyano, hydroksyl, amino, karboksy, aminokarbonyl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)aminokarbonylamino, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)aminokarbonyl, -SOR₁₂, -SO₂R₁₂, -NR₁₃SO₂R₁₂, -SO₂NR₁₃R₁₄ og -NR₁₃SO₂NR₁₄R₁₅; hvor alkylet, arylet og heteroarylet eventuelt er uavhengig substituert med én eller flere substituenten valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, cyano, alkylamino, dialkylamino, CF₃, aminokarbonyl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)aminokarbonyl og C₃-C₆ sykloalkyl;

R₃ er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, deuterium, C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, C₁-C₆ lineært eller forgrenet perfluoralkyl, halogen og cyano;

R_a, R_b, R_c og R_d er uavhengig valgt fra hydrogen, C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, C₁-C₆ lineært eller forgrenet perfluoralkyl, aryl, alkylaryl, (aryl)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, heteroaryl, halogen, cyano, hydroksyl, C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkoksy, amino, karboksy, aminokarbonyl, (heterosyklus)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl og (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, hvor videre alkylet eventuelt er substituert med én eller flere substituenten valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, alkylamino, dialkylamino, CF₃ og C₃-C₆ sykloalkyl;

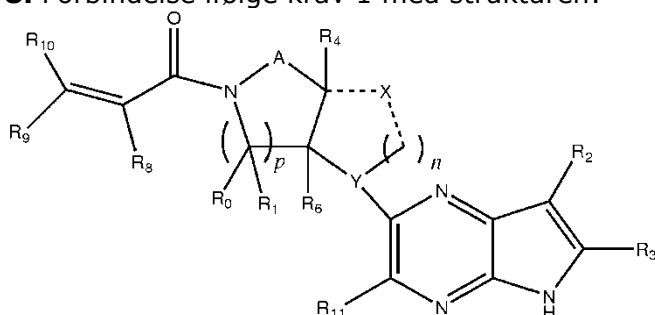
R₀, R₁, R₄, R₆, R₈, R₉ og R₁₀ er uavhengig valgt fra hydrogen, C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, C₁-C₆ lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C₆-C₁₀ aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, (aryl)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, heteroaryl, halogen, cyano, hydroksyl, C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkoksy, amino, karboksy, aminokarbonyl, (heterosyklus)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl og (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, hvor videre alkylet eventuelt er substituert med én eller flere substituenten valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, alkylamino, dialkylamino, CF₃ og C₃-C₆ sykloalkyl; hvor alternativt R₀ eller R₁, og/eller R₆, henholdsvis sammen med én av R₄, R_a, R_b, R_c eller R_d, kan uavhengig danne en binding eller en lineær C₁-C₆-alkylkjede; og/eller alternativt kan R₄, henholdsvis med én av R_a, R_b, R_c eller R_d, uavhengig danne en binding eller en lineær C₁-C₆-

alkylkjede; og/eller alternativt kan R_8 og R_9 sammen danne en 3-6-leddet ring som eventuelt inneholder ett eller to O- eller N-atomer;

R_{11} er hydrogen eller deuterium; og

- 5 R_{12} , R_{13} , R_{14} og R_{15} er uavhengig valgt fra hydrogen, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C_6 - C_{10} aryl, alkylaryl og (aryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl.

8. Forbindelse ifølge krav 1 med strukturen:



10

eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav, eller en enantiomer eller diastereomer derav, og hvori

- 15 R_2 er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, deuterium, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_3 - C_6 -sykloalkyl, C_6 - C_{10} aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, (aryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heterosyklus) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkoksy, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkoksy, halogen, cyano, hydroksyl, amino, karboksy, aminokarbonyl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aminokarbonylamino, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aminokarbonyl, - SOR_{12} , - SO_2R_{12} , - $NR_{13}SO_2R_{12}$, - $SO_2NR_{13}R_{14}$ og - $NR_{13}SO_2NR_{14}R_{15}$; hvor alkylet, arylet og heteroarylet eventuelt er uavhengig substituert med én eller flere substituenter valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, cyano, alkylamino, dialkylamino, CF_3 , aminokarbonyl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aminokarbonyl og C_3 - C_6 sykloalkyl;

25

R_3 er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, deuterium, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, halogen og cyano;

30

A er $--(CR_aR_b)_q-(CR_cR_d)_r--$, hvori R_a , R_b , R_c og R_d er uavhengig valgt fra hydrogen, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C_6 - C_{10} aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5-

og/eller 6-leddete ringer, alkylaryl, (aryl) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, halogen, cyano, hydroksyl, C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkoksy, amino, karboksy, aminokarbonyl, (heterosyklus) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl, and (C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, hvor videre alkylet eventuelt er substituert med én eller flere substituenten valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, alkylamino, dialkylamino, CF_3 og C_3-C_6 sykloalkyl;

R_a , R_b , R_c og R_d er uavhengig valgt fra hydrogen, C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_1-C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, aryl, alkylaryl, (aryl) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, heteroaryl, halogen, cyano, hydroksyl, C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkoksy, amino, karboksy, aminokarbonyl, (heterosyklus) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl og (C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, hvori videre alkylet eventuelt er substituert med én eller flere substituenten valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, alkylamino, dialkylamino, CF_3 og C_3-C_6 sykloalkyl, hvor videre alkylet eventuelt er substituert med én eller flere substituenten valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, alkylamino, dialkylamino, CF_3 og C_3-C_6 sykloalkyl;

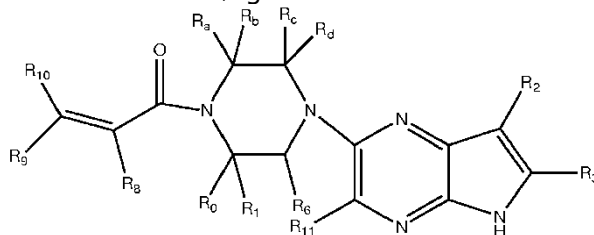
R_0 , R_1 , R_4 , R_6 , R_8 , R_9 og R_{10} er uavhengig valgt fra hydrogen, C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_1-C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C_6-C_{10} aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, (aryl) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, heteroaryl, halogen, cyano, hydroksyl, C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkoksy, amino, karboksy, aminokarbonyl, (heterosyklus) C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl og (C_1-C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, hvor videre alkylet eventuelt er substituert med én eller flere substituenten valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, alkylamino, dialkylamino, CF_3 og C_3-C_6 sykloalkyl; hvor alternativt R_0 eller R_1 , og/eller R_6 , henholdsvis sammen med én av R_4 , R_a , R_b , R_c eller R_d , kan uavhengig danne en binding eller en lineær C_1-C_6 -alkylkjede; og/eller alternativt kan R_4 , henholdsvis med én av R_a , R_b , R_c eller R_d , uavhengig danne en binding eller en lineær C_1-C_6 -alkylkjede; og/eller alternativt kan R_8 og R_9 sammen danne en 3-6-leddet ring som eventuelt inneholder ett eller to O- eller N-atomer; og R_{11} er hydrogen eller deuterium;

Y er O eller N, hvor når Y er O, er $n = 0$;

R_{12} , R_{13} , R_{14} og R_{15} er uafhængig valgt fra hydrogen, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C_6 - C_{10} aryl, alkylaryl og (aryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl;

- 5 X og de stiplede bindingene dertil, kan være til stede eller fraværende, hvorved (a) hvis X er til stede, er Y N, og X er O eller $--(CR_eR_f)_s--$, hvor R_e og R_f er uafhængig hydrogen, deuterium, halo, hydroksoy, C_1 - C_4 alkoksy, amino, CF_3 , C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_3 - C_6 sykloalkyl, C_6 - C_{10} aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, (aryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl, (heteroaryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl eller (heterosyklus) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, og de stiplede bindingene er til stede og er enkeltbindinger, hvorved når n er 0 og X er O, er O bundet til H, og den stiplede bindingen mellem X og $--(CH_2)_n--$ er fraværende, og når X er $--(CR_eR_f)_s--$ og X er direkte bundet til Y; og (b) hvis X er fraværende, er de stiplede bindingene fraværende og n er 0, hvorved når Y er N, er enten (i) N-atomet substitueret med H, eller (ii) N-atomet kan sammen med R_2 og de mellomliggende atomene danne en 6-leddet ring eventuelt substitueret med C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl eller C_3 - C_6 sykloalkyl; og
- 10
- 15
- 20 n , p , q , r og s er uafhængig 0, 1 eller 2.

9. Forbindelse ifølge krav 1 med strukturen:



- 25 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og hvori R_2 er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, deuterium, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_3 - C_6 -sykloalkyl, C_6 - C_{10} aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, (aryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heterosyklus) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkoksy, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkoksy, halogen, cyano,
- 30

hydroksyl, amino, karboksy, aminokarbonyl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)aminokarbonylamino, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)aminokarbonyl, -SOR₁₂, -SO₂R₁₂, -NR₁₃SO₂R₁₂, -SO₂NR₁₃R₁₄ og -NR₁₃SO₂NR₁₄R₁₅; hvor alkylet, arylet og heteroarylet eventuelt er uavhengig substituert med én eller flere substituenter valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, cyano, alkylamino, dialkylamino, CF₃, aminokarbonyl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)aminokarbonyl og C₃-C₆ sykloalkyl;

R₃ er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, deuterium, C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, C₁-C₆ lineært eller forgrenet perfluoralkyl, halogen og cyano;

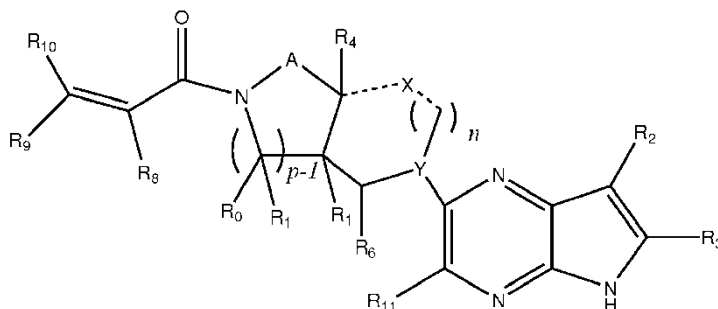
R₀, R₁, R₆, R₈, R₉ og R₁₀ er uavhengig valgt fra hydrogen, C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, C₁-C₆ lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C₆-C₁₀ aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, (aryl)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, heteroaryl, halogen, cyano, hydroksyl, C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkoksy, amino, karboksy, aminokarbonyl, (heterosyklus)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl og (C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, hvor videre alkylet eventuelt er substituert med én eller flere substituenter valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, alkylamino, dialkylamino, CF₃ og C₃-C₆ sykloalkyl; hvor alternativt R₀ eller R₁, og/eller R₆, henholdsvis sammen med én av R_a, R_b, R_c eller R_d, kan uavhengig danne en binding eller en lineær C₁-C₆-alkylkjede; og/eller alternativt kan R₄, henholdsvis sammen med én av R_a, R_b, R_c eller R_d, uavhengig danne en binding eller en lineær C₁-C₆-alkylkjede; og/eller alternativt kan R₈ og R₉ sammen danne en 3-6-leddet ring som eventuelt inneholder ett eller to O- eller N-atomer;

R₁₁ er hydrogen eller deuterium; og

R₁₂, R₁₃, R₁₄ og R₁₅ er uavhengig valgt fra hydrogen, C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl, C₁-C₆ lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C₆-C₁₀ aryl, alkylaryl og (aryl)C₁-C₆ lineært eller forgrenet alkyl.

30

10. Forbindelse ifølge krav 1 med strukturen:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav, eller en enantiomer eller diastereomer derav, og hvori

- 5 R_2 er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, deuterium, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_3 - C_6 -sykloalkyl, C_6 - C_{10} aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, (aryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heterosyklus) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet
- 10 alkyl)heterosyklus, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkoksy, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkoksy, halogen, cyano, hydroksyl, amino, karboksy, aminokarbonyl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aminokarbonylamino, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aminokarbonyl, - SOR_{12} , - SO_2R_{12} , - $NR_{13}SO_2R_{12}$, - $SO_2NR_{13}R_{14}$ og - $NR_{13}SO_2NR_{14}R_{15}$; hvor alkylet, arylet og heteroarylet eventuelt er uavhengig substituert med én eller flere
- 15 substituenten valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, cyano, alkylamino, dialkylamino, CF_3 , aminokarbonyl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aminokarbonyl og C_3 - C_6 sykloalkyl;
- 20 R_3 er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, deuterium, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, halogen og cyano;
- 25 A er $--(CR_aR_b)_q-(CR_cR_d)_r--$, hvori R_a , R_b , R_c og R_d er uavhengig valgt fra hydrogen, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C_6 - C_{10} aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, alkylaryl, (aryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, halogen, cyano, hydroksyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkoksy, amino, karboksy, aminokarbonyl, (heterosyklus) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl, and (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, hvor videre alkylet eventuelt er substituert med én
- 30 eller flere substituenten valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, alkylamino, dialkylamino, CF_3 og C_3 - C_6 sykloalkyl;

R_a , R_b , R_c og R_d er uavhengig valgt fra hydrogen, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, aryl, alkylaryl, (aryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, heteroaryl, halogen, cyano, hydroksyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkoksy, amino, karboksy, aminokarbonyl, (heterosyklus) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl og (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, hvori alkylet videre er eventuelt substituert med én eller flere substituenten valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, alkylamino, dialkylamino, CF_3 og C_3 - C_6 sykloalkyl; hvor videre alkylet eventuelt er substituert med én eller flere substituenten valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, alkylamino, dialkylamino, CF_3 og C_3 - C_6 sykloalkyl;

R_0 , R_1 , R_4 , R_6 , R_8 , R_9 og R_{10} er uavhengig valgt fra hydrogen, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C_6 - C_{10} aryl, monosyklisk eller bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, (aryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (heteroaryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, heteroaryl, halogen, cyano, hydroksyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkoksy, amino, karboksy, aminokarbonyl, (heterosyklus) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)aryl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl og (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heterosyklus, hvor videre alkylet eventuelt er substituert med én eller flere substituenten valgt fra gruppen bestående av halo, hydroksy, metoksy, amino, alkylamino, dialkylamino, CF_3 og C_3 - C_6 sykloalkyl; hvor alternativt R_0 eller R_1 , og/eller R_6 , henholdsvis sammen med én av R_4 , R_a , R_b , R_c eller R_d , kan uavhengig danne en binding eller en lineær C_1 - C_6 -alkylkjede; og/eller alternativt kan R_4 , henholdsvis med én av R_a , R_b , R_c eller R_d , uavhengig danne en binding eller en lineær C_1 - C_6 -alkylkjede; og/eller alternativt kan R_8 og R_9 sammen danne en 3-6-leddet ring som eventuelt inneholder ett eller to O- eller N-atomer; og

R_{11} er hydrogen eller deuterium;

Y er O eller N, hvor når Y er O, er $n \geq 0$;

R_{12} , R_{13} , R_{14} og R_{15} er uavhengig valgt fra hydrogen, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_1 - C_6 lineært eller forgrenet perfluoralkyl, C_6 - C_{10} aryl, alkylaryl og (aryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl;

X og de stiplede bindingene dertil, kan være til stede eller fraværende, hvorved (a) hvis X er til stede, er Y N, og X er O eller $--(CR_eR_f)_5--$, hvor R_e og R_f er uavhengig hydrogen, deuterium, halo, hydroksy, C_1 - C_4 alkoksy, amino, CF_3 , C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, C_3 - C_6 sykloalkyl, C_6 - C_{10} aryl, monosyklisk eller

bisyklisk heteroaryl, omfattende 5- og/eller 6-leddete ringer, (aryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, (C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl)heteroaryl, (heteroaryl) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl eller (heterosyklus) C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl, og de stiplede bindingene er til stede og er enkeltbindinger, hvorved når n er 0 og X er O, er O bundet til H, og den stiplede bindingen mellom X og $--(CH_2)_n--$ er fraværende, og når X er $--(CR_eR_f)_s--$ og X er direkte bundet til Y ; og (b) hvis X er fraværende, er de stiplede bindingene fraværende og n er 0, hvorved når Y er N, er enten (i) N-atomet substituert med H, eller (ii) N-atomet kan sammen med R_2 og de mellomliggende atomene danne en 6-leddet ring eventuelt substituert med C_1 - C_6 lineært eller forgrenet alkyl eller C_3 - C_6 sykloalkyl; og n, p, q, r og s er uavhengig 0, 1 eller 2.

11. Forbindelsen ifølge krav 1, valgt fra gruppen bestående av:

2-(1-akryloylpiperidin-4-ylamino)-N-isopropyl-5H-pyrrolo[2,3-b]pyrazin-7-karboksamid;

N-isopropyl-2-(3-(N-metylakrylamido)azetid-1-yl)-5H-pyrrolo[2,3-b]pyrazin-7-karboksamid;

2-((3R,4R)-1-akryloyl-3-hydroksypiperidin-4-ylamino)-N-isopropyl-5H-pyrrolo[2,3-b]pyrazin-7-karboksamid;

(S)-2-(1-akryloylpyrrolidin-3-ylamino)-N-isopropyl-5H-pyrrolo[2,3-b]pyrazin-7-karboksamid;

(S)-2-((1-akryloylpyrrolidin-2-yl)metylamino)-N-isopropyl-5H-pyrrolo[2,3-b]pyrazin-7-karboksamid;

2-((1R,3R)-3-akrylamidosyklobutylamino)-N-isopropyl-5H-pyrrolo[2,3-b]pyrazin-7-karboksamid; og

(S)-2-((1-akryloylpyrrolidin-3-yl)metylamino)-N-isopropyl-5H-pyrrolo[2,3-b]pyrazin-7-karboksamid;

(R)-4-(1-akryloylpiperidin-3-ylamino)-1H-pyrrolo[2,3-b]pyridin-3-karbonitril;

(R)-4-(1-akryloylpiperidin-3-ylamino)-1H-pyrrolo[2,3-b]pyridin-3-karbonitril;

(R)-1-(3-(5-klor-7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-ylamino)piperidin-1-yl)prop-2-en-1-on;

1-((2S,5R)-5-(7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-ylamino)-2-metylpiperidin-1-yl)prop-2-en-1-on;

1-((3R,5S)-3-(7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-ylamino)-5-hydroksypiperidin-1-yl)prop-2-en-1-on;

- (R)-1-(3-(5-(2-metoksyetyl)-7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-ylamino)piperidin-1-yl)prop-2-en-1-on;
1-(5-(7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-ylamino)-2-(hydroksymetyl)piperidin-1-yl)prop-2-en-1-on;
- 5 1-((3R,5S)-3-(7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-ylamino)-5-fluorpiperidin-1-yl)prop-2-en-1-on;
1-((3R,4S)-3-(7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-ylamino)-4-metylpiperidin-1-yl)prop-2-en-1-on;
1-((3S,4R)-3-(7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-ylamino)-4-fluorpiperidin-1-yl)prop-
- 10 2-en-1-on;
1-((2S,5R)-5-(7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-ylamino)-2-etyl)piperidin-1-yl)prop-2-en-1-on;
(R)-1-(3-(7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-ylamino)piperidin-1-yl)prop-2-en-1-on;
1-((3aS,7aS)-1-(7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-yl)tetrahydro-1H-pyrrolo[2,3-
- 15 c]pyridin-6(2H,7H,7aH)-yl)prop-2-en-1-on;
(R)-1-(3-(3-klor-1H-pyrrolo[2,3-b]pyridin-4-ylamino)piperidin-1-yl)prop-2-en-1-on;
1-((1R,2R,5R)-2-(7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-ylamino)-8-
- 20 azabisyklo[3.2.1]oktan-8-yl)prop-2-en-1-on;
1-((2R,5R)-5-(7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-ylamino)-2-(hydroksymetyl)piperidin-1-yl)prop-2-en-1-on;
1-((3R,5R)-3-(7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-ylamino)-5-fluorpiperidin-1-yl)prop-
- 25 2-en-1-on;
(R)-1-(3-(5-metyl-7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-ylamino)piperidin-1-yl)prop-2-en-1-on;
1-((3R,5S)-3-(7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-ylamino)-5-metylpiperidin-1-yl)prop-2-en-1-on;
- 30 1-((2S,5R)-5-(5-(2-metoksyetyl)-7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-ylamino)-2-metylpiperidin-1-yl)prop-2-en-1-on;
1-((3R,5S)-3-(7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-ylamino)-5-metylpiperidin-1-yl)prop-2-en-1-on;
1-((3R,4S)-3-(7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-ylamino)-4-metylpiperidin-1-yl)prop-2-en-1-on;
- 35 (R)-1-(3-(5-etyl-7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-ylamino)piperidin-1-yl)prop-2-en-1-on;
(R)-1-(3-(5-fluor-7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-ylamino)piperidin-1-yl)prop-2-en-1-on;

(R)-4-(1-akryloylpiperidin-3-ylamino)-7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-5-karbonitril;
og
(3R,5R)-5-(7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-ylamino)-1-akryloylpiperidin-3-
karbonitril; eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

5

12. Forbindelse ifølge krav 1, hvori forbindelsen er valgt fra gruppen bestående av:

- 2-(1-akryloylpiperidin-4-ylamino)-N-isopropyl-5H-pyrrolo[2,3-b]pyrazin-7-
10 karboksamid;
N-isopropyl-2-(3-(N-metylakrylamido)azetidin-1-yl)-5H-pyrrolo[2,3-b]pyrazin-7-
karboksamid;
2-((3R,4R)-1-akryloyl-3-hydroksypiperidin-4-ylamino)-N-isopropyl-5H-
pyrrolo[2,3-b]pyrazin-7-karboksamid;
15 (S)-2-(1-akryloylpyrrolidin-3-ylamino)-N-isopropyl-5H-pyrrolo[2,3-b]pyrazin-7-
karboksamid;
(S)-2-((1-akryloylpyrrolidin-2-yl)metylamino)-N-isopropyl-5H-pyrrolo[2,3-
b]pyrazin-7-karboksamid;
1-((3aS,7aS)-1-(7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-yl)tetrahydro-1H-pyrrolo[2,3-
20 c]pyridin-6(2H,7H,7aH)-yl)prop-2-en-1-on;
1-((1R,2R,5R)-2-((7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-yl)amino)-8-
azabisyklo[3.2.1]oktan-8-yl)prop-2-en-1-on;
1-((3R,4S)-3-((7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-yl)amino)-4-metylpiperidin-1-
yl)prop-2-en-1-on;
25 1-((2S,5R)-5-(7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-ylamino)-2-metylpiperidin-1-
yl)prop-2-en-1-on; og
(R)-4-(1-akryloylpiperidin-3-ylamino)-1H-pyrrolo[2,3-b]pyridin-3-karbonitril;
eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

30

13. Farmasøytisk eller veterinærmedisinsk sammensetning, omfattende en forbindelse ifølge krav 1, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og en farmasøytisk akseptabel bærer.

35

14. Sammensetning, omfattende en forbindelse ifølge krav 1 for anvendelse i behandling eller forebygging av en lidelse eller tilstand valgt fra revmatoid artritt, myositt, vaskulitt, pemfigus, bulløs pemfigoid, inflammatorisk

tarmsykdom inkludert Crohns sykdom og ulcerøs kolitt, cøliaki, proktitt, eosinofil gastroenteritt eller mastocytose, Alzheimers sykdom, lupus, nefritt, systemisk lupus erythematosus, psoriasis, eksem-dermatitt, pruritus eller andre kløende tilstander, vitiligo, alopesi, autoimmune skjoldbruskkjertellidelser, multippel sklerose, depressiv lidelse, allergi, astma, Sjögrens syndrom, Reiters sykdom, 5 polymyositt-dermatomyositt, systemisk sklerose, polyarteritis nodosa, keratoconjunctivitis sicca, Hashimotos sykdom, autoimmun hemolytisk anemi, autoimmun atrofisk gastritt av pernisiøs anemi, autoimmun encefalomyelitt, autoimmun orkitt, Goodpastures syndrom, autoimmun trombocytopeni, 10 sympatisk oftalmi, myasthenia gravis, Graves' sykdom, primær biliær cirrhose, kronisk aggressiv hepatitt, membranøs glomerulopati, organtransplantatavstøtning, transplantat-mot-vert-sykdom, organ- og celletransplantatavstøtning så som benmarg, brusk, hornhinne, hjerte, mellomvirvelskive, celleøy, nyre, lem, lever, lunge, muskel, myoblast, nerve, 15 pankreas, hud, tynntarm eller luftrør, eller xenotransplantasjon, inkludert Cogans syndrom, ankyloserende spondylitt, Wegeners granulomatose, autoimmun alopesi, type I- eller juvenil diabetes og komplikasjoner fra diabetes eller tyreoiditt, kronisk obstruktiv lungelidelse, akutt respiratorisk sykdom, kakeksi, kreft, inkludert fordøyelseskanal-/mage-tarm-kanal-kreft, kolonkreft, 20 leverkreft, hudkreft inkludert mastcelletumor og plateepitelkarsinom, brystkreft og mammacancer, eggstokkreft, prostatakreft, leukemi, T-celle-leukemi hos voksne, aktivert B-celle lik, diffust storcellet B-cellelymfom, nyrekreft, lungekreft, muskelkreft, benkreft, blærekreft, hjernekreft, melanom inkludert oralt og metastatisk melanom, Kaposis sarkom septisk sjokk, kardiopulmonal 25 dysfunksjon, akutt myeloidleukemi, T-celle akutt lymfoblastisk leukemi, multippelt myelom, myeloproliferative lidelser, proliferativ diabetisk retinopati eller angiogenese-assosierte lidelser inkludert solide tumorer, pankreaskreft, hjernetumorer, gliomer inkludert astrocytom, oligodendrogliom og glioblastom, akutt CNS-traume inkludert traumatisk hjerneskade, encefalitt, slag og 30 ryggmargskade, epilepsi, anfall, kronisk nerveinflammasjon assosiert med nevrodegenerering inkludert Alzheimers sykdom, Parkinsons sykdom, amyotrofisk lateralsklerose, Huntingtons sykdom, cerebral iskemi, frontotemporallappsdemens, og med nevropsykiatriske lidelser inkludert schizofreni, bipolar lidelse, behandlingsresistent depresjon, posttraumatisk 35 stresslidelse, angst og autoantistoff-medierte encefalopatier, øyesykdommer, lidelser eller tilstander inkludert autoimmune øyesykdommer, keratokonjunktivitt, vernal konjunktivitt, uveitt inkludert uveitt assosiert med

Behcets sykdom og linseindusert uveitt, keratitt, herpeskeratitt, konisk keratitt, korneaepitel-dystrofi, keratoleukoma, okulær pemfigus, Mooresens ulcer, skleritt, Graves' oftalmopati, Vogt-Koyanagi-Haradas sykdom, keratoconjunctivitis sicca (tørt øye), flyktenule, iridosyklitt, sarkoidose, endokrin oftalmopati, sympatisk oftalmi, allergisk konjunktivitt og okulær neovaskularisering.

5

15. Forbindelse ifølge krav 1, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse i behandling eller forebygging av inflammatorisk tarmsykdom.

10

16. Forbindelse ifølge krav 1, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse ifølge krav 15, hvori den inflammatoriske tarmsykdommen er Crohns sykdom.

15

17. Forbindelse ifølge krav 1, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse ifølge krav 15, hvori den inflammatoriske tarmsykdommen er ulcerøs kolitt.

20

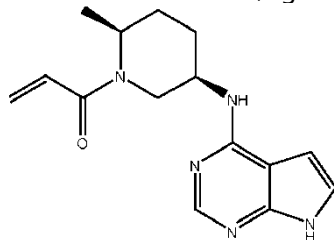
18. Sammensetning for anvendelse ifølge krav 14, hvori lidelsen eller tilstanden er revmatoid artritt.

19. Sammensetning for anvendelse ifølge krav 14, hvori lidelsen eller tilstanden er alopeci.

25

20. Forbindelsen ifølge krav 1, som er 1-((2S,5R)-5-(7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-ylamino)-2-metylpiperidin-1-yl)prop-2-en-1-on eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

21. Forbindelsen ifølge krav 20, som er



30