



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 3110418 B1

NORWAY

(19) NO  
(51) Int Cl.  
*C07D 401/14 (2006.01)*  
*A61K 31/401 (2006.01)*  
*A61K 31/416 (2006.01)*  
*A61P 37/00 (2006.01)*  
*C07D 405/14 (2006.01)*  
*C07D 413/14 (2006.01)*

**Norwegian Industrial Property Office**

---

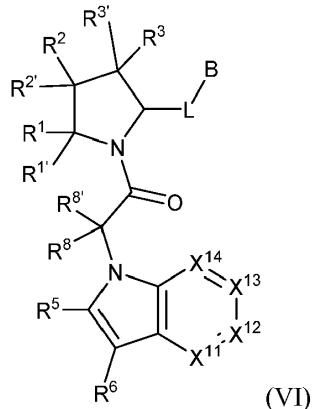
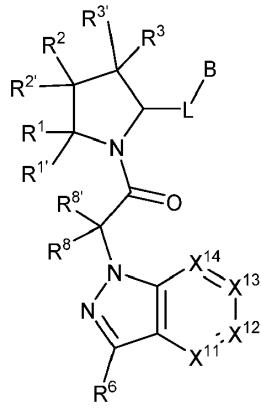
(45)	Translation Published	2020.02.17
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.11.06
(86)	European Application Nr.	15755617.6
(86)	European Filing Date	2015.02.25
(87)	The European Application's Publication Date	2017.01.04
(30)	Priority	2014.02.25, US, 201461944189 P 2014.07.10, US, 201462022916 P 2014.09.05, US, 201462046783 P
(84)	Designated Contracting States:	AL ; AT ; BE ; BG ; CH ; CY ; CZ ; DE ; DK ; EE ; ES ; FI ; FR ; GB ; GR ; HR ; HU ; IE ; IS ; IT ; LI ; LT ; LU ; LV ; MC ; MK ; MT ; NL ; NO ; PL ; PT ; RO ; RS ; SE ; SI ; SK ; SM ; TR
(73)	Proprietor	Achillion Pharmaceuticals, Inc., 300 George Street, New Haven, CT 06511, USA
(72)	Inventor	GADHACHANDA, Venkat, Rao, 39 Ives Street Unit 104, Hamden, CT 06518, USA WANG, Qiuping, 79 Carriage Drive, Bethany, CT 06524, USA PAIS, Godwin, 370 West Todd Street, Hamden, CT 06518, USA HASHIMOTO, Akihiro, 47 Laurel Street, Branford, CT 06405, USA CHEN, Dawei, 1117 Durham Road, Guilford, CT 06437, USA WANG, Xiangzhu, 147 Foxbridge Village Road, Branford, CT 06405, USA AGARWAL, Atul, 75 Nicholas Court, Hamden, CT 06518, USA DESHPANDE, Milind, 44 Field Brook Road, Madison, CT 06443, USA WILES, Jason, Allan, 116 Blinnshed Road, Madison, CT 06443, USA PHADKE, Avinash, S., 51 Gilbert Lane, Branford, CT 06405, USA
(74)	Agent or Attorney	PLOUGMANN VINGTOFT, Postboks 1003 Sentrum, 0104 OSLO, Norge
(54)	Title	<b>ARYL, HETEROARYL, AND HETEROCYCLIC COMPOUNDS FOR TREATMENT OF COMPLEMENT MEDIATED DISORDERS</b>
(56)	References Cited:	WO-A1-2012/093101 WO-A1-2014/002057

US-A1- 2013 296 377  
US-A1- 2010 041 628  
WO-A2-2014/009833

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

**Patentkrav**

## 1. En forbindelse med formel



og det farmasøytisk akseptable saltet derav, hvor:

$R^1$ ,  $R^{1'}$ ,  $R^2$ ,  $R^{2'}$ ,  $R^3$  og  $R^{3'}$  er uavhengig valgt fra hydrogen, halogen, hydroksyl, nitro, cyano, amino,  $C_1$ - $C_6$ alkyl,  $C_2$ - $C_6$ alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ alkynyl,  $C_1$ - $C_6$ alkoxy,  $C_2$ - $C_6$ alkynyl,  $C_2$ - $C_6$ alkanoyl,  $C_1$ - $C_6$ tioalkyl, hydroksy $C_1$ - $C_6$ alkyl, amino $C_1$ - $C_6$ alkyl, - $C_0$ - $C_4$ alkylNR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>, -C(O)OR<sup>9</sup>, -OC(O)R<sup>9</sup>, -NR<sup>9</sup>C(O)R<sup>10</sup>, -C(O)NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>, -OC(O)NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>, -NR<sup>9</sup>C(O)OR<sup>10</sup>,  $C_1$ - $C_2$ haloalkyl og  $C_1$ - $C_2$ haloalkoksy, hvor  $R^9$  og  $R^{10}$  er uavhengig valgt ved hver forekomst fra hydrogen,  $C_1$ - $C_6$ alkyl, ( $C_3$ - $C_7$ sykloalkyl) $C_0$ - $C_4$ alkyl, - $C_0$ - $C_4$ alkyl( $C_3$ - $C_7$ sykloalkyl) og -O- $C_0$ - $C_4$ alkyl( $C_3$ - $C_7$ sykloalkyl);

eller  $R^1$  og  $R^2$  kan tas sammen for å danne en 3-leddet karbosyklig ring, eller en 4- til 6-leddet karbosyklig eller aryrling eller en 4- til 6-leddet heterosyklig eller heteroaryl ring inneholdende 1 eller 2 heteroatomer uavhengig valgt fra N, O, eller S;

eller  $R^2$  og  $R^3$  danner en 3- til 6-leddet karbosyklig eller aryrling eller en 3- til 6-leddet heterosyklig eller heteroaryl ring;

eller  $R^1$  og  $R^{1'}$  eller  $R^2$  og  $R^{2'}$  eller  $R^3$  og  $R^{3'}$  danner en 3- til 6-leddet karbosyklig spiro ring;

eller  $R^1$  og  $R^{1'}$  eller  $R^3$  og  $R^{3'}$  danner en 3- til 6-leddet heterosyklig spiro ring inneholdende 1 eller 2 heteroatomer uavhengig valgt fra N, O eller S; eller  $R^2$  og  $R^{2'}$  danner en 3- til 6-leddet heterosyklig spiro ring,

hver ring er usubstituert eller substituert med 1 eller flere substituenter uavhengig valgt fra halogen, hydroksyl, cyano, -COOH,  $C_1$ - $C_4$ alkyl,  $C_2$ - $C_4$ alkenyl,  $C_2$ - $C_4$ alkynyl,  $C_1$ - $C_4$ alkoxy,  $C_2$ - $C_4$ alkanoyl, hydroxy $C_1$ - $C_4$ alkyl, (mono- og di- $C_1$ - $C_4$ alkylamino) $C_0$ -

$C_4$ alkyl, - $C_0-C_4$ alkyl( $C_3-C_7$ sykloalkyl), -O- $C_0-C_4$ alkyl( $C_3-C_7$ sykloalkyl),  $C_1-C_2$ haloalkyl og  $C_1-C_2$ haloalkoksy;

eller  $R^1$  og  $R^{1'}$ ,  $R^2$  og  $R^{2'}$ eller  $R^3$  og  $R^{3'}$  danner en karbonylgruppe;

eller  $R^1$  og  $R^2$  eller  $R^2$  og  $R^3$  danner en karbon-karbon dobbeltbinding;

$R^5$  og  $R^6$  er uavhengig valgt fra -CHO, -C(O)NH<sub>2</sub>, -C(O)NH(CH<sub>3</sub>),  $C_2-C_6$ alkanoyl, hydrogen, hydroksyl, halogen, cyano, nitro, -COOH, -SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, vinyl,  $C_1-C_6$ alkyl,  $C_2-C_6$ alkenyl,  $C_1-C_6$ alkoxy, - $C_0-C_4$ alkyl( $C_3-C_7$ sykloalkyl), -C(O) $C_0-C_4$ alkyl( $C_3-C_7$ sykloalkyl), -P(O)(OR<sup>9</sup>)<sub>2</sub>, -OC(O)R<sup>9</sup>, -C(O)OR<sup>9</sup>, -C(O)N(CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>R<sup>9</sup>)(R<sup>10</sup>), -NR<sup>9</sup>C(O)R<sup>10</sup>, fenyl eller 5- til 6-leddet heteroaryl; og hvor hver  $R^5$  og  $R^6$  annet enn hydrogen, hydroksyl, cyano og -COOH er usubstituert eller eventuelt substituert;

$R^8$  og  $R^{8'}$  er uavhengig valgt fra hydrogen, halogen, hydroksyl,  $C_1-C_6$ alkyl, - $C_0-C_4$ alkyl( $C_3-C_7$ sykloalkyl),  $C_1-C_6$ alkoxy, og ( $C_1-C_4$ alkylamino) $C_0-C_2$ alkyl; eller  $R^8$  og  $R^{8'}$  blir tatt sammen for å danne en oksogruppe; eller  $R^8$  og  $R^{8'}$  kan tas sammen med karbonet som de er bundet til for å danne en 3-leddet karbosyklig ring;

X<sup>11</sup> er N eller CR<sup>11</sup>;

X<sup>12</sup> er N eller CR<sup>12</sup>;

X<sup>13</sup> er N eller CR<sup>13</sup>;

X<sup>14</sup> er N eller CR<sup>14</sup>, og hvor ikke mer enn to av X<sup>11</sup>, X<sup>12</sup>, X<sup>13</sup>og X<sup>14</sup> er N;

en av R<sup>12</sup> og R<sup>13</sup> er H og den andre av R<sup>12</sup> og R<sup>13</sup> er R<sup>32</sup> hvor i det minste en av R<sup>12</sup> og R<sup>13</sup> er til stede og er valgt fra R<sup>32</sup>;

R<sup>32</sup> er valgt fra aryl; mettet eller umettet 5-6-leddet heterosyklus med 1, 2 eller 3 heteroatomer uavhengig valgt fra N, O og S, hvor heterosyklusen er bundet gjennom et karbonatom i den heterosyklike ringen til et karbonatom i R<sup>12</sup> eller R<sup>13</sup> posisjon; og 5-6-leddet heteroaryl med 1, 2 eller 3 heteroatomer uavhengig valgt fra N, O og S, hvor aryl-, heterosyklig- eller heteroaryl-ringen eventuelt kan være substituert;

R<sup>11</sup> og R<sup>14</sup> er uavhengig valgt ved hver forekomst fra hydrogen, halogen, hydroksyl, nitro, cyano, -O(PO)(OR<sup>9</sup>)<sub>2</sub>, -(PO)(OR<sup>9</sup>)<sub>2</sub>,  $C_1-C_6$ alkyl,  $C_2-C_6$ alkenyl,  $C_2-C_6$ alkynyl,  $C_2-C_6$ alkanoyl,  $C_1-C_6$ alkoxy,  $C_1-C_6$ tioalkyl, - $C_0-C_4$ alkyl(mono- og di- $C_1$ -

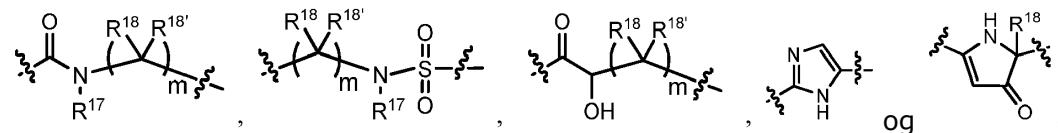
C<sub>6</sub>alkylamino), -C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>alkyl(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>sykloalkyl), -C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>alkoksy(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>sykloalkyl), C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>haloalkyl og C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>haloalkoksy;

R<sup>21</sup> og R<sup>22</sup> er uavhengig valgt ved hver forekomst fra hydrogen, hydroksyl, cyano, amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>haloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkoxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>sykloalkyl)C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>alkyl, (fenyl)C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>alkyl, -C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>alkyLOC(O)OC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkyl, -C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>alkyLOC(O)C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkyl, -C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>alkylC(O)OC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkyl, (4- til 7-leddet heterosykloalkyl)C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>alkyl med 1, 2 eller 3 heteroatomer uavhengig valgt fra N, O og S, og (5- eller 6-leddet umettet eller aromatisk heterosyklaus)C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>alkyl med 1, 2 eller 3 heteroatomer uavhengig valgt fra N, O og S, og hver R<sup>21</sup> og R<sup>22</sup> kan eventuelt være substituert;

R<sup>23</sup> er uavhengig valgt ved hver forekomst fra C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>haloalkyl, (aryl)C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>alkyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>sykloalkyl)C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>alkyl, (fenyl)C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>alkyl, (4- til 7-leddet heterosykloalkyl)C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>alkyl med 1, 2 eller 3 heteroatomer uavhengig valgt fra N, O og S, og (5- eller 6-leddet umettet eller aromatisk heterosyklaus)C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>alkyl med 1, 2 eller 3 heteroatomer uavhengig valgt fra N, O og S, og hver R<sup>23</sup> kan eventuelt være substituert;

R<sup>24</sup> og R<sup>25</sup> blir tatt sammen med nitrogenet som de er bundet til for å danne en 4- til 7-leddet monosyklistisk heterosykloalkylgruppe, eller en 6- til 10-leddet bisyklistisk heterosyklistisk gruppe med sammensatte, spiro eller brodannede ringer, og hver R<sup>24</sup> og R<sup>25</sup> kan eventuelt være substituert;

L er valgt fra formlene



og

eller er en binding, hvor R<sup>17</sup> er hydrogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkyl eller -C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>alkyl(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>sykloalkyl) og R<sup>18</sup> og R<sup>18'</sup> er uavhengig valgt fra hydrogen, halogen, hydroksymetyl og methyl; og m er 0, 1, 2 eller 3;

B er en monosyklistisk eller bisyklistisk karbosyklistisk; en monosyklistisk eller bisyklistisk karbosyklistisk-oksigruppe; en monosyklistisk, bisyklistisk eller trisyklistisk heterosyklistisk gruppe med 1, 2, 3 eller 4 heteroatomer uavhengig valgt fra N, O og S og fra 4 til 7 ringatomer per ring; C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>alkenyl; C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>alkynyl; -(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>alkyl)(aryl); -(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>alkyl)(heteroaryl); eller -(C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>alkyl)(bifenyl) som hver B er usubstituert eller substituert med en eller flere substituerter uavhengig valgt fra R<sup>33</sup> og R<sup>34</sup>, og 0 eller 1 substituerter valgt fra R<sup>35</sup> og R<sup>36</sup>;

R<sup>33</sup> er uavhengig valgt fra halogen, hydroksyl, -COOH, cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>alkanoyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkoxy, -C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>alkylNR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>, -SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>haloalkyl og C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>haloalkoksy;

R<sup>34</sup> er uavhengig valgt fra nitro, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>alkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>tioalkyl, -JC<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>sykloalkyl, -B(OH)<sub>2</sub>, -JC(O)NR<sup>9</sup>R<sup>23</sup>, -JOSO<sub>2</sub>OR<sup>21</sup>, -C(O)(CH<sub>2</sub>)<sub>1-4</sub>S(O)R<sup>21</sup>, -O(CH<sub>2</sub>)<sub>1-4</sub>S(O)NR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>, -JOP(O)(OR<sup>21</sup>)(OR<sup>22</sup>), -JP(O)(OR<sup>21</sup>)(OR<sup>22</sup>), -JOP(O)(OR<sup>21</sup>)R<sup>22</sup>, -JP(O)(OR<sup>21</sup>)R<sup>22</sup>, -JOP(O)R<sup>21</sup>R<sup>22</sup>, -JP(O)R<sup>21</sup>R<sup>22</sup>, -JSP(O)(OR<sup>21</sup>)(OR<sup>22</sup>), -JSP(O)(OR<sup>21</sup>)(R<sup>22</sup>), -JNR<sup>9</sup>P(O)(NHR<sup>21</sup>)(NHR<sup>22</sup>), -JNR<sup>9</sup>P(O)(OR<sup>21</sup>)(NHR<sup>22</sup>), -JNR<sup>9</sup>P(O)(OR<sup>21</sup>)(OR<sup>22</sup>), -JC(S)R<sup>21</sup>, -JNR<sup>21</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>22</sup>, -JNR<sup>9</sup>S(O)NR<sup>10</sup>R<sup>22</sup>, -JNR<sup>9</sup>SO<sub>2</sub>NR<sup>10</sup>R<sup>22</sup>, -JSO<sub>2</sub>NR<sup>9</sup>COR<sup>22</sup>, -JSO<sub>2</sub>NR<sup>9</sup>CONR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>, -JNR<sup>21</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>22</sup>, -JC(O)NR<sup>21</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>22</sup>, -JC(NH<sub>2</sub>)NR<sup>22</sup>, -JC(NH<sub>2</sub>)NR<sup>9</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>22</sup>, -JOC(O)NR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>, -JNR<sup>21</sup>C(O)OR<sup>22</sup>, -JNR<sup>21</sup>OC(O)R<sup>22</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>1-4</sub>C(O)NR<sup>21</sup>R<sup>22</sup>, -JC(O)R<sup>24</sup>R<sup>25</sup>, -JNR<sup>9</sup>C(O)R<sup>21</sup>, -JC(O)R<sup>21</sup>, -JNR<sup>9</sup>C(O)NR<sup>10</sup>R<sup>22</sup>, -CCR<sup>21</sup>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>1-4</sub>OC(O)R<sup>21</sup>, og -JC(O)OR<sup>23</sup>; hvorav hver R<sup>34</sup> kan være usubstituert eller substituert med en eller flere substituenter uavhengig valgt fra halogen, hydroksyl, nitro, cyano, amino, okso, -B(OH)<sub>2</sub>, -Si(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -COOH, -CONH<sub>2</sub>, -P(O)(OH)<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkyl, -C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>alkyl(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>sykloalkyl), C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkoxy, -C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>alkyl(mono- og di-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>alkylamino), C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkylester, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>alkylamino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>hydroksylalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>haloalkyl og C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>haloalkoksy;

R<sup>35</sup> er uavhengig valgt fra naftyl, naftyloksy, indanyl, (4- til 7-leddet heterosykloalkyl)C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>alkyl som inneholder 1 eller 2 heteroatomer valgt fra N, O og S, og bisyklistisk heterosykklus som inneholder 1, 2 eller 3 heteroatomer uavhengig valgt fra N, O og S, og inneholder 4- til 7 ringatomer i hver ring; hvorav hver R<sup>35</sup> er usubstituert eller substituert med en eller flere substituenter uavhengig valgt fra halogen, hydroksyl, nitro, cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>alkanoyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkoxy, (mono- og di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkylamino)C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkylester, -C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>alkyl(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>sykloalkyl), -SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>halogenalkyl og C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>haloalkoksy; og

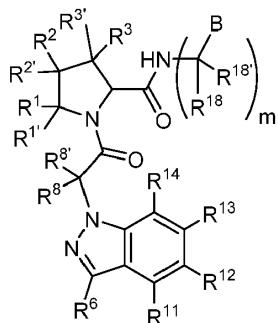
R<sup>36</sup> er uavhengig valgt fra tetrazolyl, (fenyl)C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>alkyl, (fenyl)C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>alkoksy, fenoksy og 5- eller 6-leddet heteroaryl med 1, 2 eller 3 heteroatomer uavhengig valgt fra N, O, B og S, hvorav hver R<sup>36</sup> er usubstituert eller substituert med en eller flere substituenter uavhengig valgt fra halogen, hydroksyl, nitro, cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>alkanoyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkoxy, (mono- og di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkylamino)C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkylester, -C<sub>0</sub>-C<sub>4</sub>alkyl(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>sykloalkyl), -SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>, -OSi(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, -Si(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)<sub>3</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>haloalkyl og C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>haloalkoksy; og

J er uavhengig valgt ved hver forekomst fra en kovalent binding, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>alkylen, -OC<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>alkylen, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>alkenylen og C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>alkynylen;

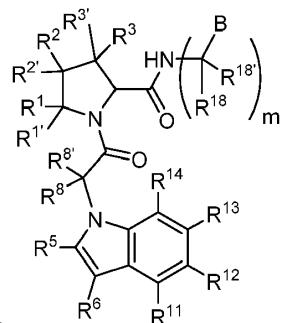
hvor, med mindre annet er spesifisert, enhver gruppe som eventuelt er substituert kan være uavhengig substituert med en eller flere av følgende halogen; cyano; hydroksyl; nitro; azido; alkanoyl; karboksamid; alkyl, sykloalkyl, alkenyl, alkynyl, alkoxyl, aryloxyl så som fenoksy; alkyltio inkludert de som har en eller flere tioeterbindinger; alkylsulfmyl; alkylsulfonylgrupper inkludert de som har en eller flere sulfonylbindinger; aminoalkylgrupper inkludert grupper som har ett eller flere N-atomer; aryl; arylalkyl med 1 til 3 separate eller sammensatte ringer og fra 6 til omrent 14 eller 18 ringkarbonatomer; arylalkoxy med 1 til 3 separate eller sammensatte ringer; eller en mettet, umettet eller aromatisk heterosyklig gruppe med 1 til 3 separate eller sammensatte ringer med ett eller flere N-, O- eller S-atomer; amino, -CHO, -COOH, -CONH<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkylester, (mono- og di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkylamino)C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>haloalkyl, hydroksyC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkyl, ester, karbamat, urea, sulfonamid, -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkyl(heterosyclo), C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkyl (heteroaryl), -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>sykloalkyl), -O-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>sykloalkyl), B(OH)<sub>2</sub>, fosfat, fosfonat og C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>haloalkoxyl.

2. Forbindelse ifølge krav 1, hvor X<sup>12</sup> er CR<sup>12</sup> og X<sup>13</sup> er CR<sup>13</sup>.

3. Forbindelse ifølge krav 1 med formel:



(XXI) eller

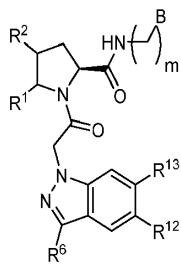


(XIX)

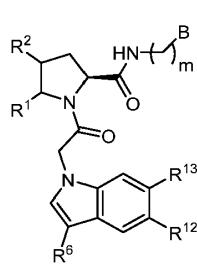
hvor m er 0 eller 1;

eller et farmasøyttisk akseptabelt salt derav.

4. Forbindelse ifølge krav 1 med formel:



(IC) eller



(IB)

eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

5. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-4, hvor:

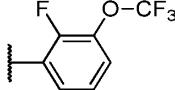
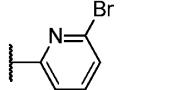
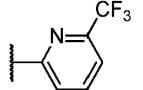
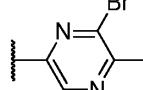
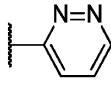
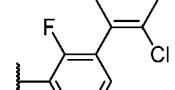
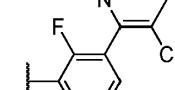
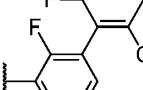
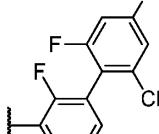
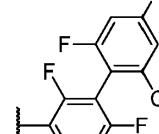
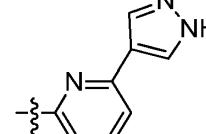
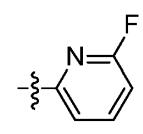
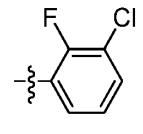
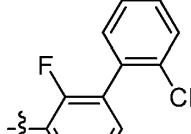
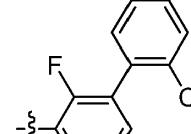
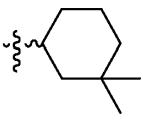
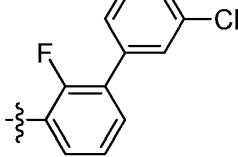
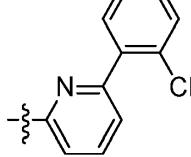
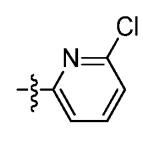
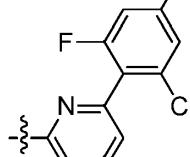
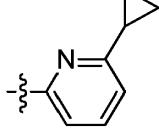
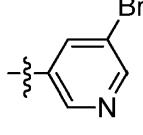
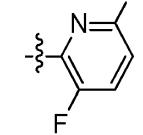
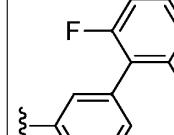
- a) R<sup>1</sup>, R<sup>1'</sup>, R<sup>2'</sup>, R<sup>3</sup> og R<sup>3'</sup>, hvis de er til stede, er alle hydrogen og R<sup>2</sup> er fluor; eller
- b) R<sup>1</sup> og R<sup>2</sup> blir tatt sammen for å danne en 3- til 6-leddet sykloalkylgruppe og R<sup>1'</sup>, R<sup>2'</sup>, R<sup>3</sup> og R<sup>3'</sup> der de er til stede, er alle hydrogen.

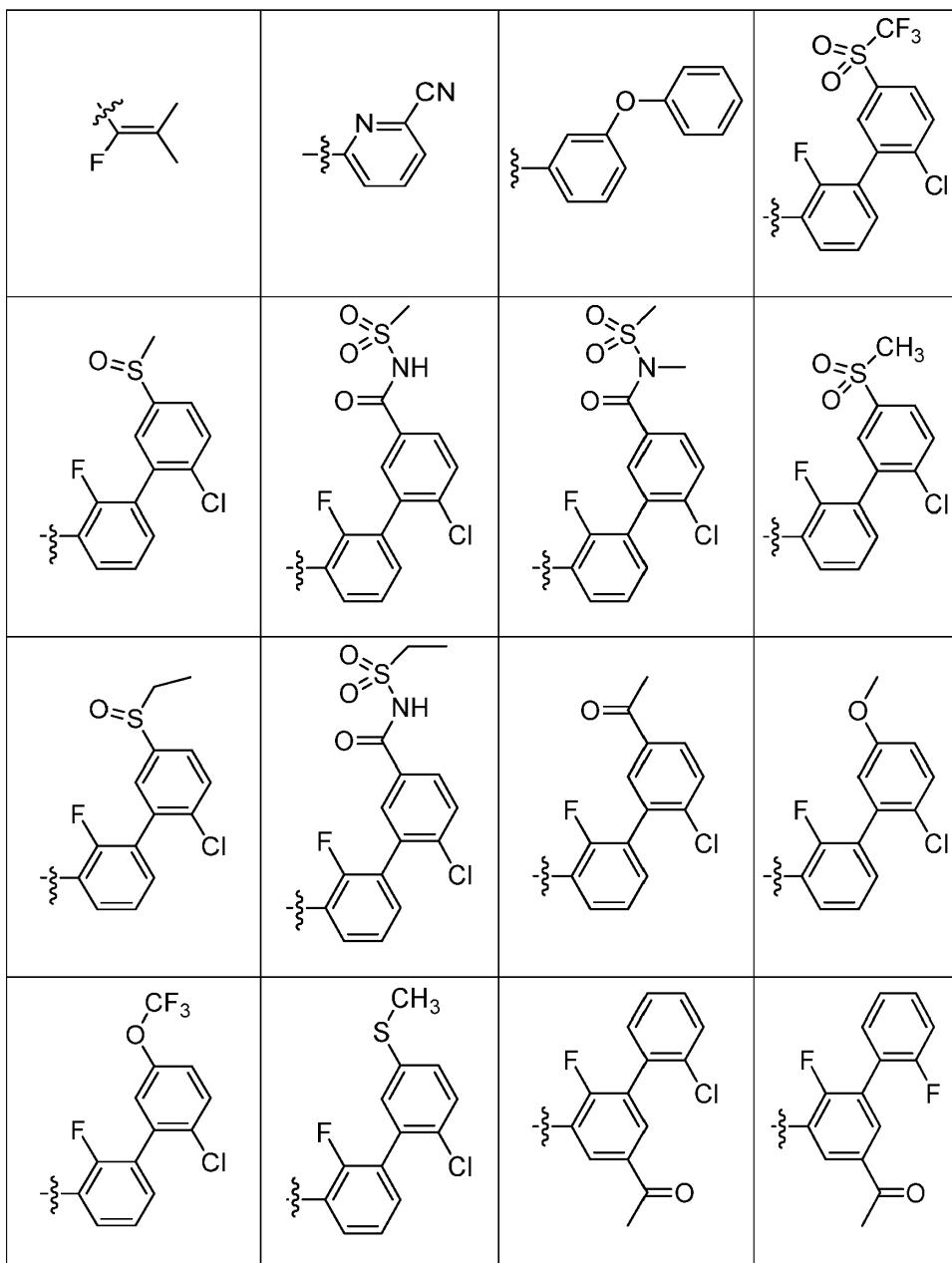
6. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-5, hvor R<sup>12</sup> er eventuelt substituert heteroaryl.

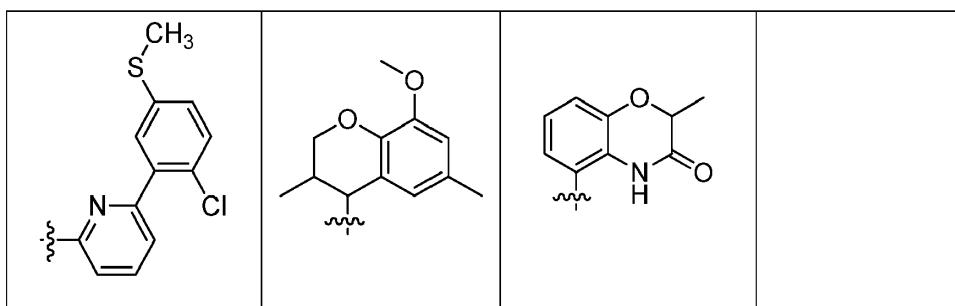
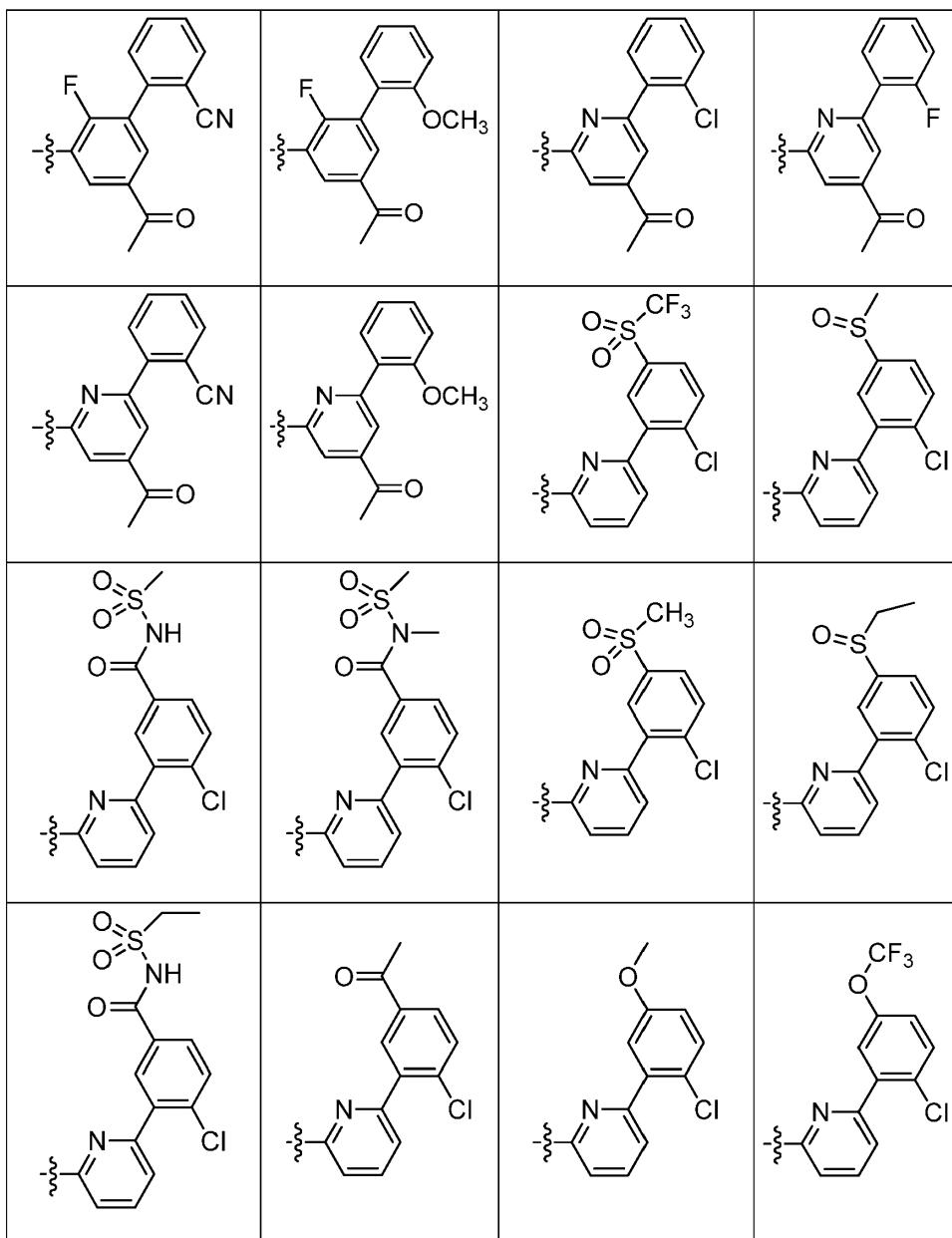
7. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-6, hvor hver gruppe som eventuelt er substituert, med mindre annet er spesifisert, uavhengig kan være substituert med en eller flere av følgende halogen, hydroksyl, amino, cyano, -CHO, -COOH, -CONH<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>alkynyl, -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkoxy, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>alkanoyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkylester, (mono- og di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkylamino)C<sub>0</sub>-C<sub>2</sub>alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>haloalkyl, hydroksyC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkyl, ester, karbamat, urea, sulfonamid, -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkyl(heterosyclo), C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkyl (heteroaryl), -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>sykloalkyl), -O-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>sykloalkyl), B(OH)<sub>2</sub>, fosfat, fosfonat og C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>haloalkoksy.

8. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-7, hvor B er fenyл eller pyridinyl substituert med 1, 2 eller 3 substituenter valgt fra klor, brom, hydroksyl, -SCF<sub>3</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>alkoksy, trifluormetyl, fenyл og trifluormetoksy.

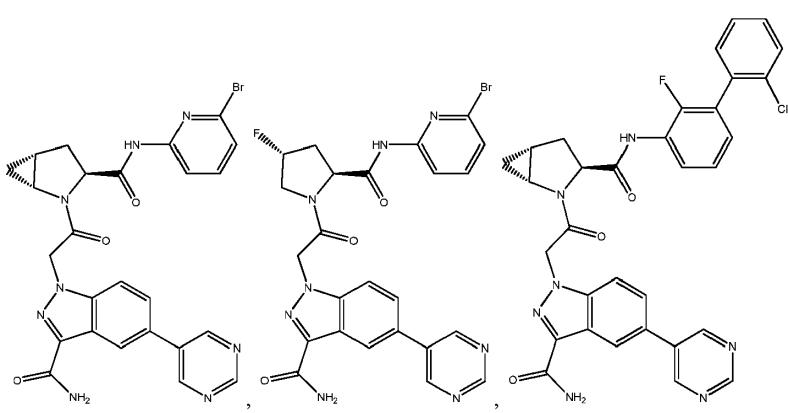
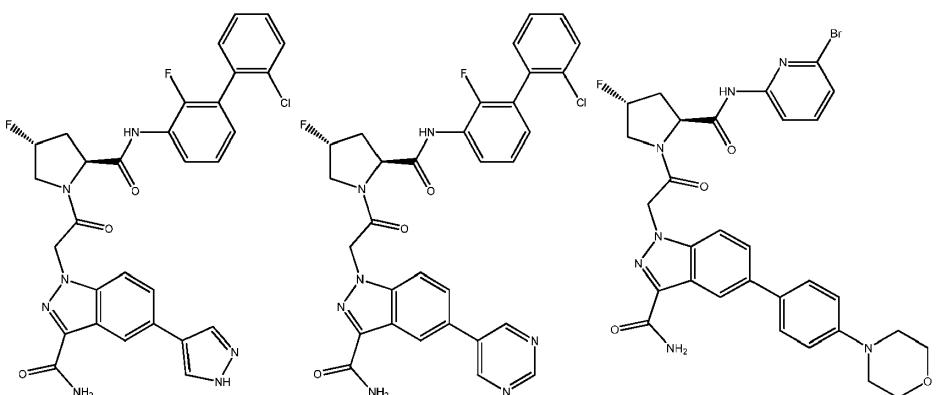
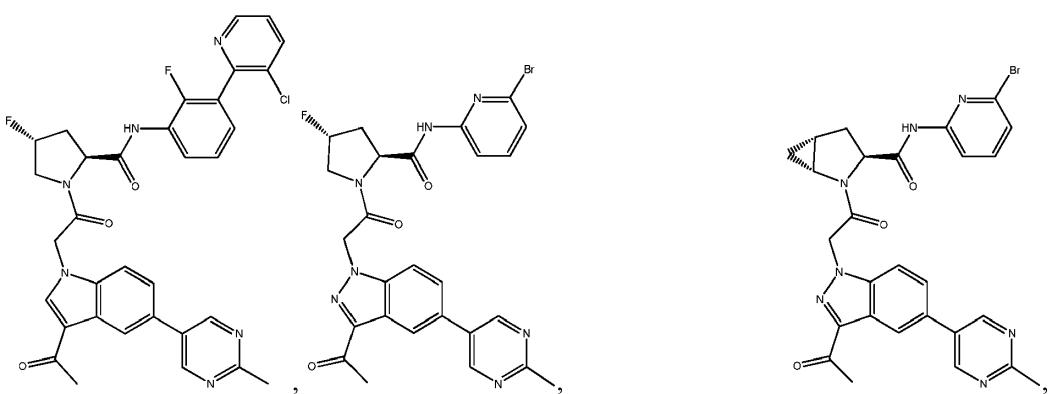
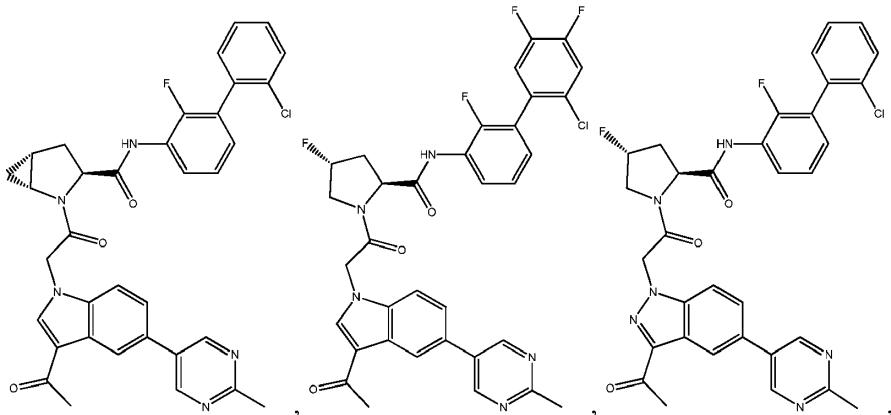
9. Forbindelse ifølge krav 1, hvor B er valgt fra:

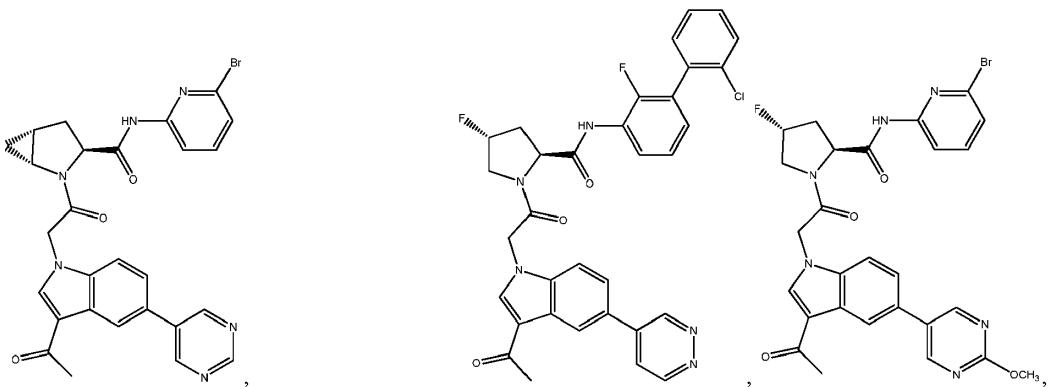
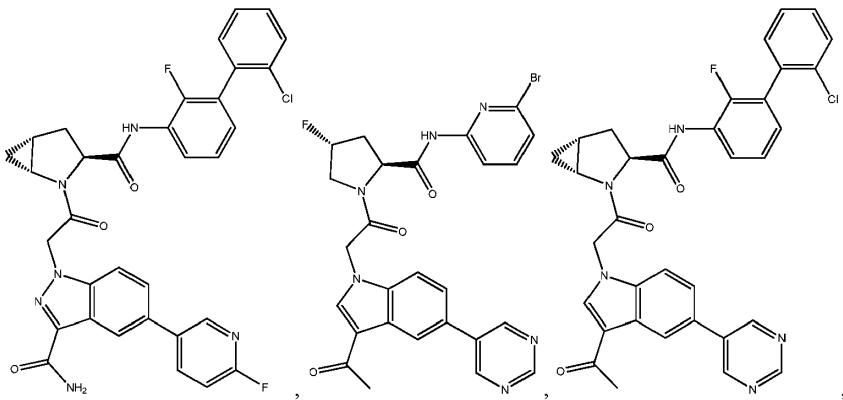
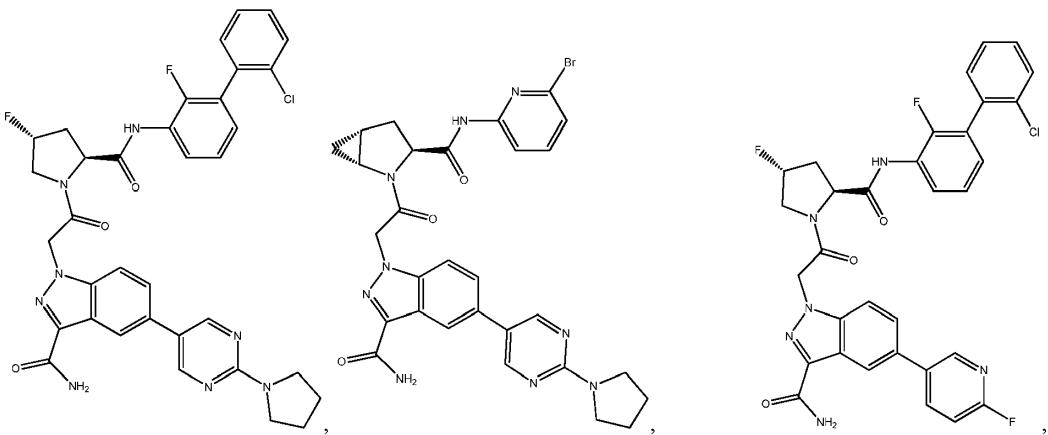
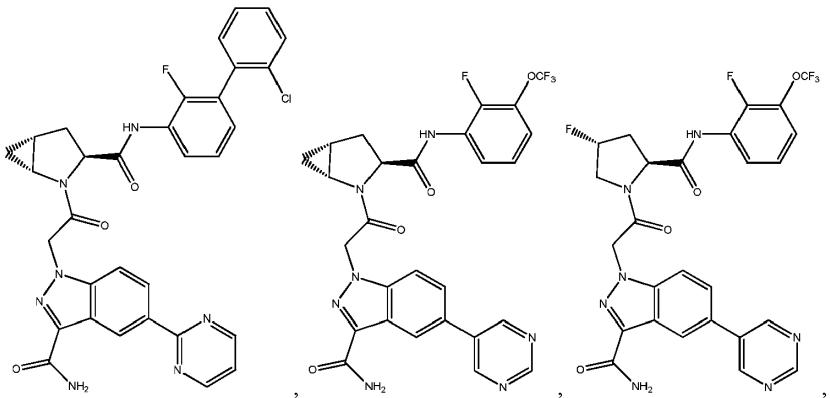
			
			
			
			
			
			

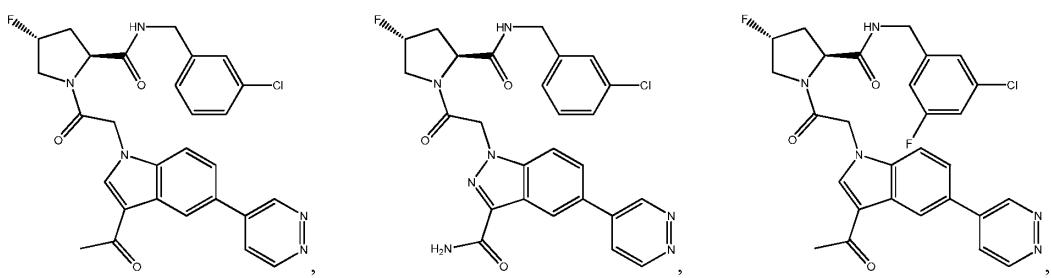
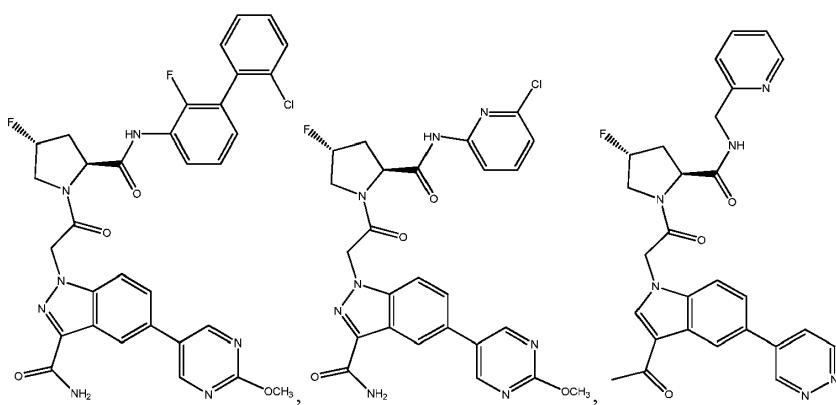
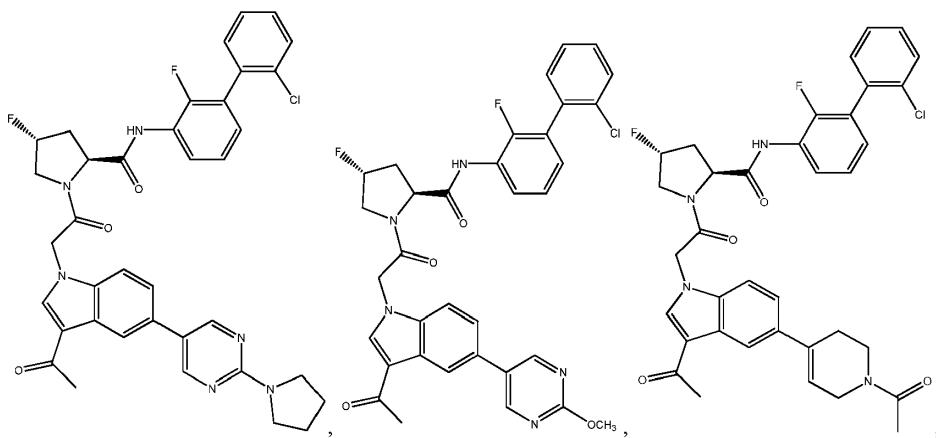
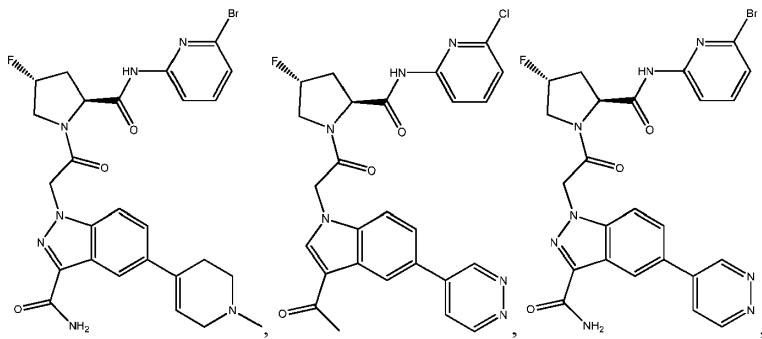


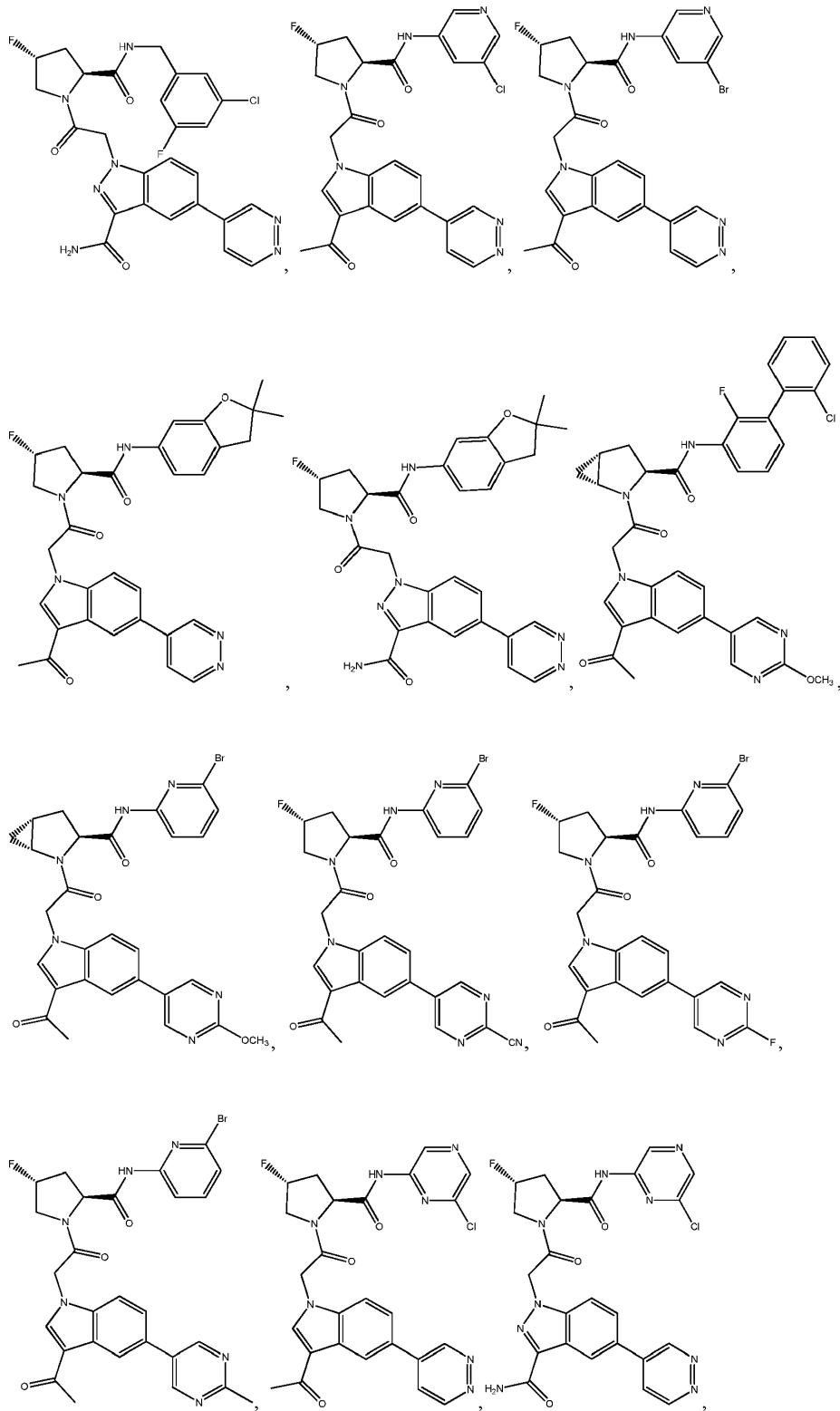


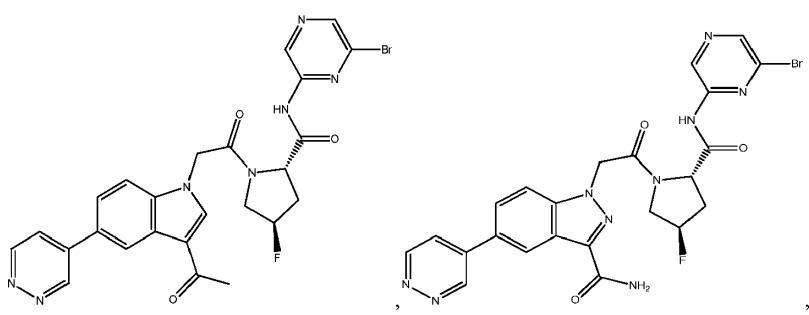
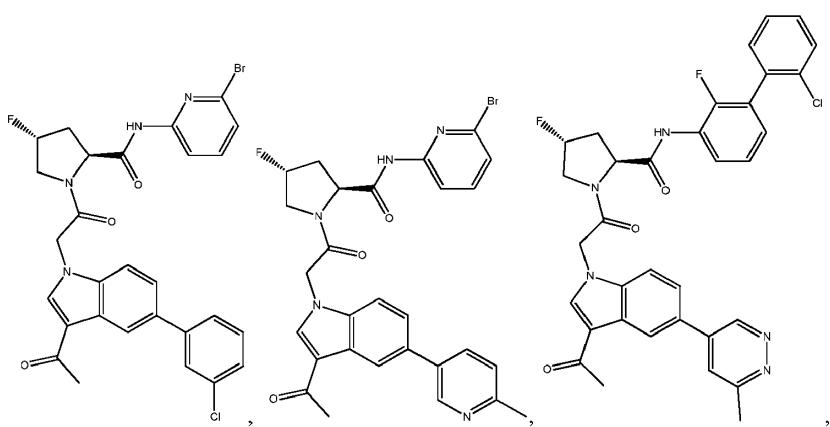
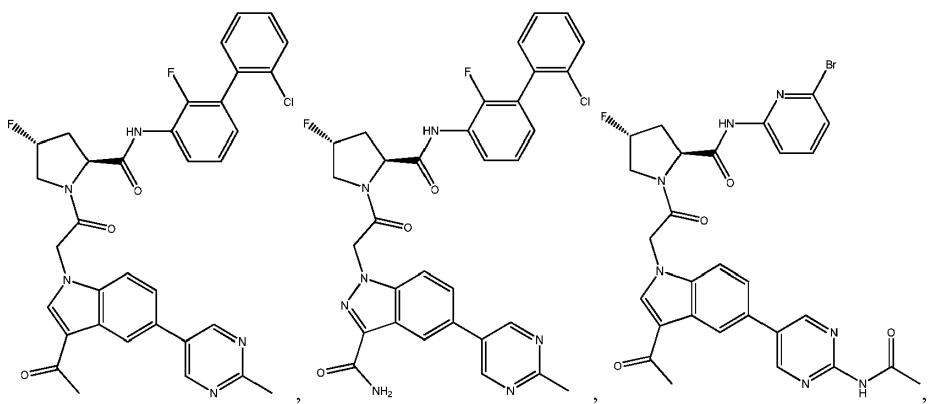
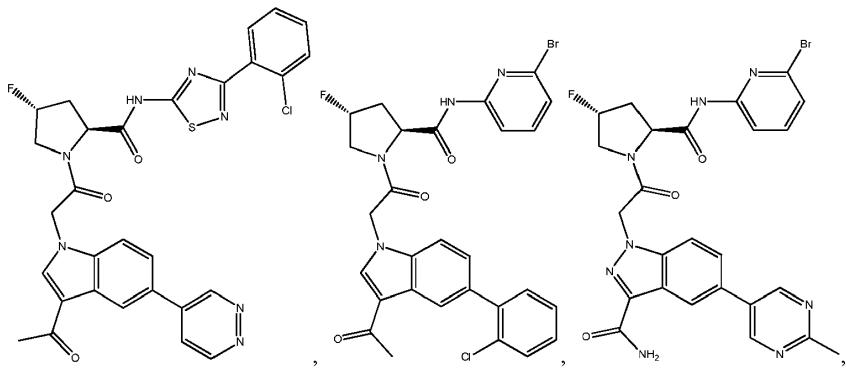
10. Forbindelse ifølge krav 1, hvor forbindelsen er valgt fra:

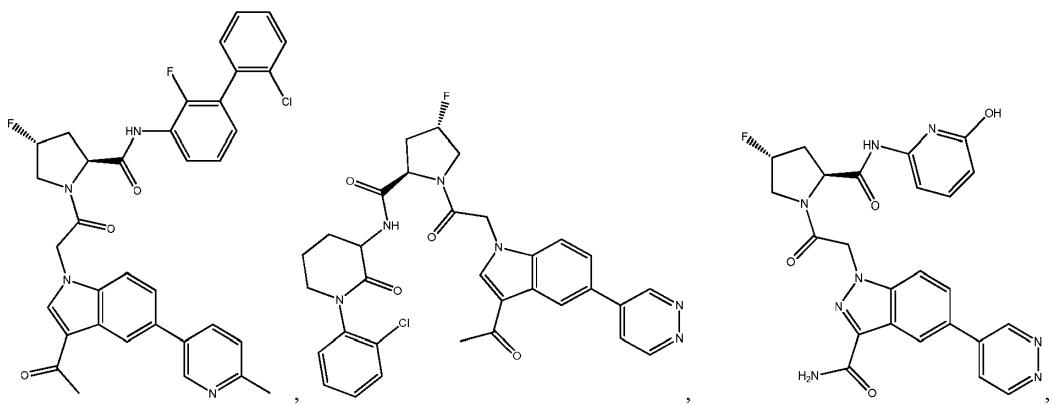
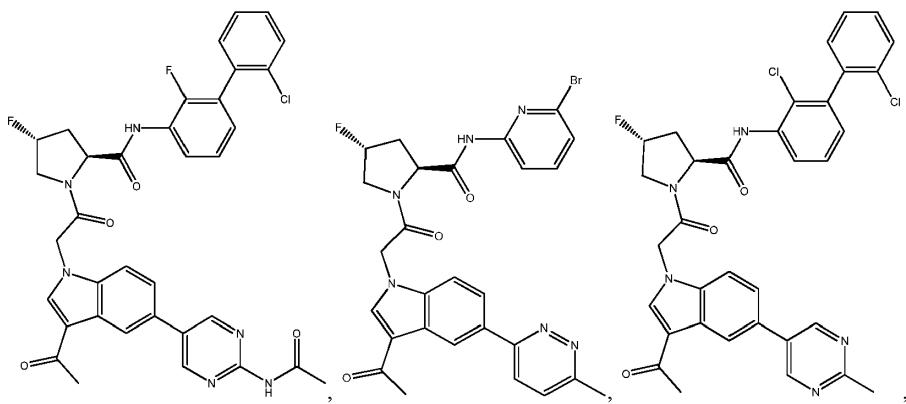
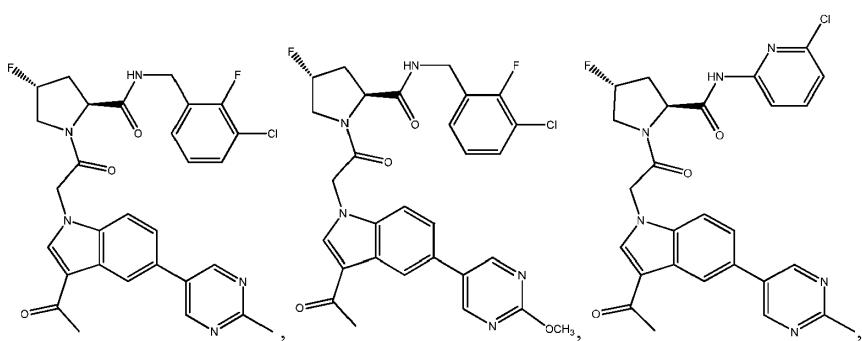
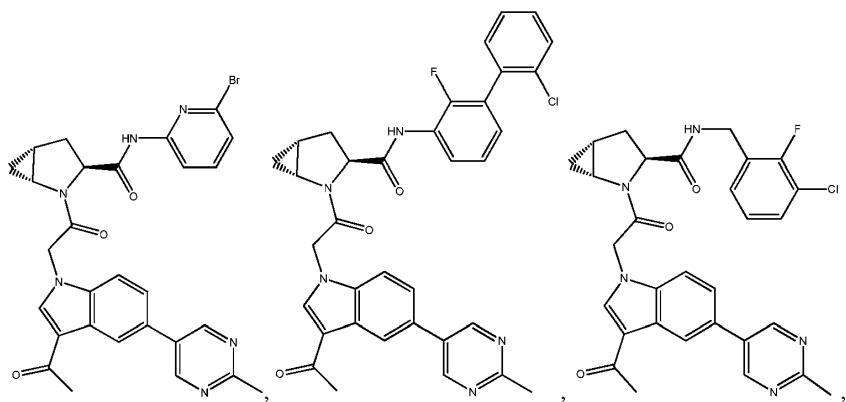


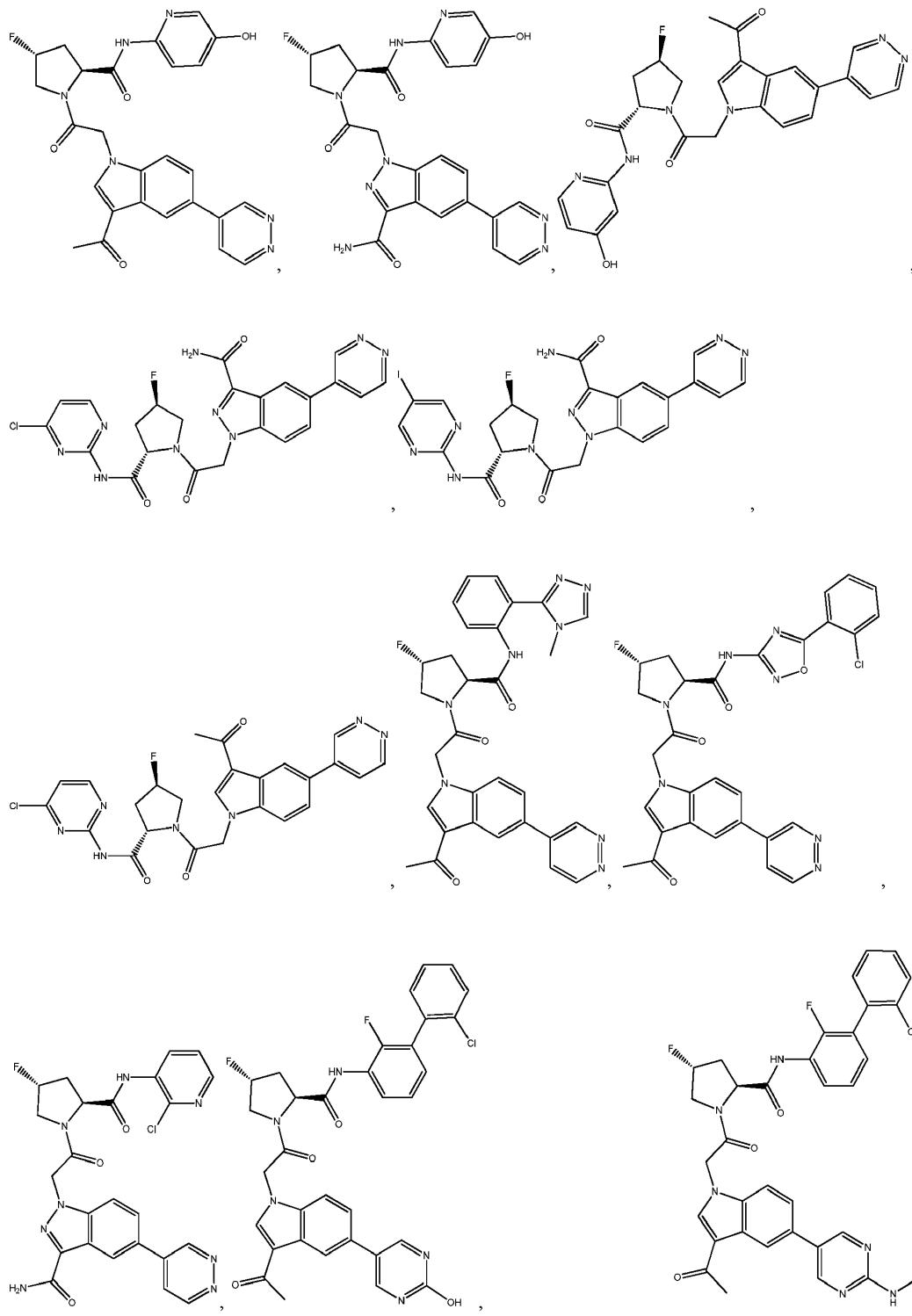


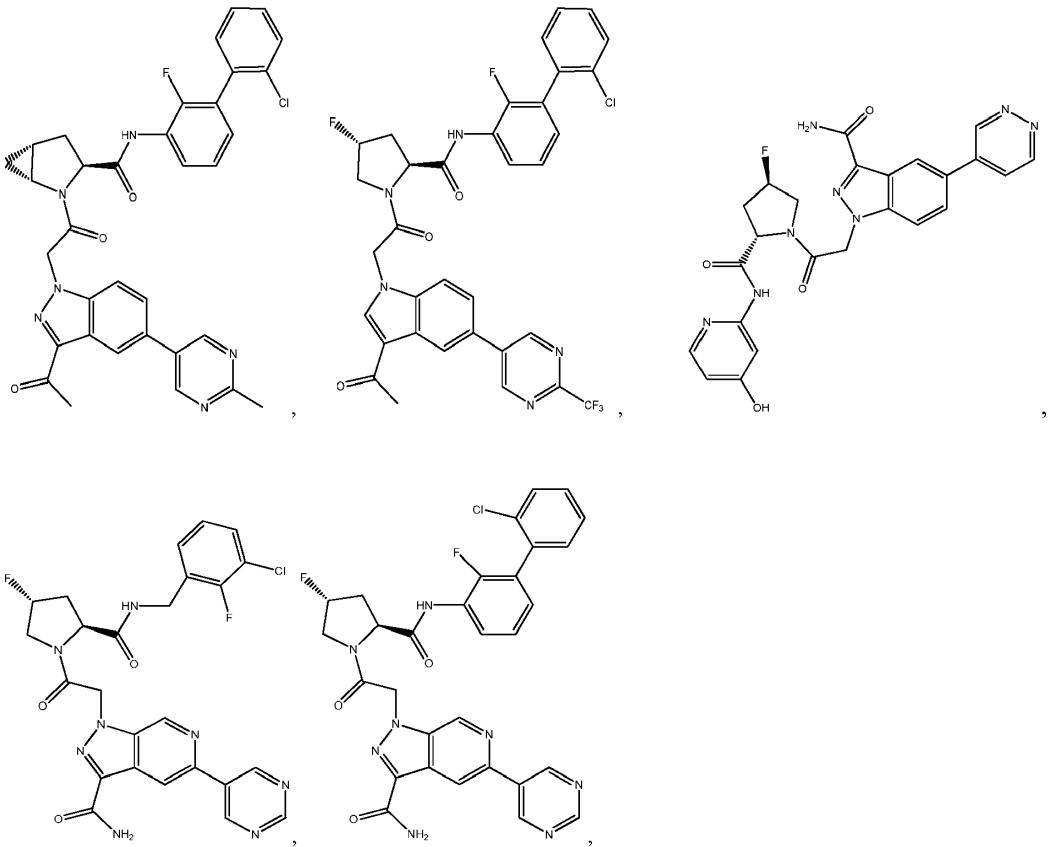




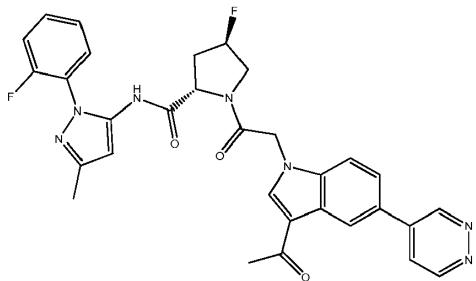






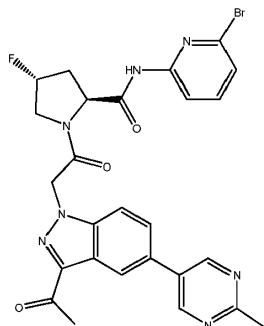


eller



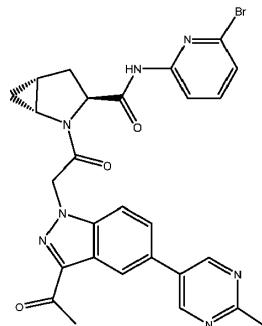
eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

11. Forbindelse ifølge krav 1 med formel:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

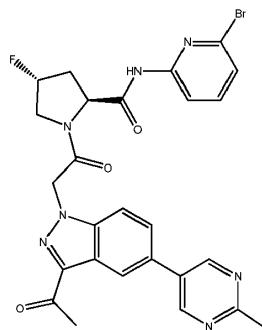
12. Forbindelse ifølge krav 1 med formel:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

13. Farmasøytisk sammensetning som omfatter en effektiv mengde av en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-12 i en farmasøytisk akseptabel bærer.

14. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 13, hvor forbindelsen er:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

15. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-12 eller en farmasøytisk sammensetning ifølge krav 13 for anvendelse i behandlingen av en forstyrrelse mediert av komplement faktor D hos et menneske.

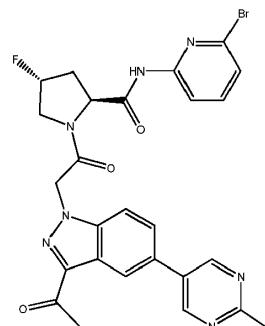
16. Forbindelse eller farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 15, hvor forstyrrelsen er aldersrelatert makuler degenerasjon (AMD), retinal degenerasjon, oftalmis sykdom, paroksysmal nattlig hemoglobinuri (PNH), multippel sklerose, artritt, reumatoid artritt, en respirasjonssykdom, en kardiovaskulær sykdom.

17. Forbindelse eller farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 15, hvor forstyrrelsen er C3 glomerulonefritt.

18. Forbindelse eller farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 15, hvor forstyrrelsen er atypisk hemolytisk uremisk syndrom.

19. Forbindelse eller farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 15, hvor forstyrrelsen er MPGN II.

20. Forbindelse eller farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 15, hvor forbindelsen er:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

21. Forbindelse eller farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 20, hvor forstyrrelsen er aldersrelatert makuler degenerasjon (AMD), retinal degenerasjon, oftalmis sykdom, paroksysmal nattlig hemoglobinuri (PNH), multippel sklerose, artritt, reumatoid artritt, en respirasjonssykdom eller en kardiovaskulær sykdom.

22. Forbindelse eller farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 20, hvor forstyrrelsen er C3 glomerulonefritt.

23. Forbindelse eller farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 20, hvor forstyrrelsen er atypisk hemolytisk uremisk syndrom.

24. Forbindelse eller farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 20, hvor forstyrrelsen er paroksysmal nattlig hemoglobinuri (PNH).

25. Forbindelse eller farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 20, hvor forstyrrelsen er MPGN II.