



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3150578 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

<i>C07D 207/16 (2006.01)</i>	<i>C07D 401/12 (2006.01)</i>	<i>C07D 403/14 (2006.01)</i>
<i>A61P 25/00 (2006.01)</i>	<i>C07D 401/14 (2006.01)</i>	<i>C07D 405/14 (2006.01)</i>
<i>A61P 29/00 (2006.01)</i>	<i>C07D 403/04 (2006.01)</i>	<i>C07D 413/14 (2006.01)</i>
<i>C07D 401/06 (2006.01)</i>	<i>C07D 403/06 (2006.01)</i>	<i>C07D 417/14 (2006.01)</i>
<i>C07D 401/10 (2006.01)</i>	<i>C07D 403/10 (2006.01)</i>	<i>C07D 487/04 (2006.01)</i>

Norwegian Industrial Property Office

- (45) Translation Published 2021.03.22
- (80) Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent 2020.10.14
- (86) European Application Nr. 15799731.3
- (86) European Filing Date 2015.05.28
- (87) The European Application's Publication Date 2017.04.05
- (30) Priority 2014.05.29, JP, 2014111378
- (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 Mitsubishi Tanabe Pharma Corporation, 3-2-10, Dosho-machi, Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka 541-8505, Japan
- (72) Inventor YAMAMOTO, Yasuo, c/o Mitsubishi Tanabe Pharma Corporation 3-2-10 Dosho-machi Chuo-ku, Osaka-shi Osaka 541-8505, Japan
SATO, Atsushi, c/o Mitsubishi Tanabe Pharma Corporation 3-2-10 Dosho-machi Chuo-ku, Osaka-shi Osaka 541-8505, Japan
MOROKUMA, Kenji, c/o Mitsubishi Tanabe Pharma Corporation 3-2-10 Dosho-machi Chuo-ku, Osaka-shi Osaka 541-8505, Japan
SHITAMA, Hiroaki, c/o Mitsubishi Tanabe Pharma Corporation 3-2-10 Dosho-machi Chuo-ku, Osaka-shi Osaka 541-8505, Japan
ADACHI, Takashi, c/o Mitsubishi Tanabe Pharma Corporation 3-2-10 Dosho-machi Chuo-ku, Osaka-shi Osaka 541-8505, Japan
MIYASHIRO, Masahiko, c/o Mitsubishi Tanabe Pharma Corporation 3-2-10 Dosho-machi Chuo-ku, Osaka-shi Osaka 541-8505, Japan
- (74) Agent or Attorney TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge
-

(54) Title **NOVEL PYRROLIDINE COMPOUND AND APPLICATION AS MELANOCORTIN RECEPTOR AGONIST**

(56) References Cited: WO-A1-2005/040109, WO-A2-02/068388, JP-A- 2010 512 304, WO-A1-01/47879, JP-A- 2009 543 774, WO-A1-2005/077935, WO-A1-01/47914, JP-A- 2003 519 139, JP-A- 2003 519 135, WO-A1-2004/078717

TIAN, X. ET AL.: 'Design, Synthesis, and Evaluation of Proline and Pyrrolidine Based Melanocortin Receptor Agonists. A Conformationally Restricted Dipeptide Mimic Approach' JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY vol. 49, no. 15, 2006, ISSN 0022-2623 pages 4745 - 4761, XP055241673

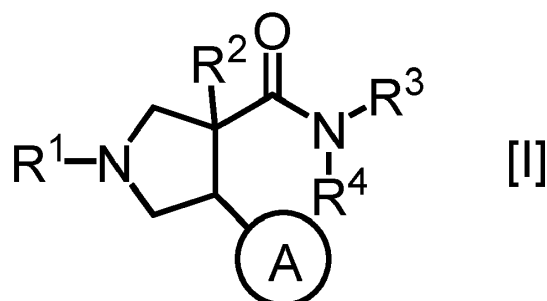
NICHOLS P J ET AL: "Preparation of pyrrolidine-based PDE4 inhibitors via enantioselective conjugate addition of alpha-substituted malonates to aromatic nitroalkenes", ORGANIC LETTERS , 14(23), 6012-6015 CODEN: ORLEF7; ISSN: 1523-7052,, vol. 8, no. 7, 30 March 2006 (2006-03-30), pages 1495-1498, XP002747953, ISSN: 1523-7060, DOI: 10.1021/OL060398P [retrieved on 2006-03-04]

HERPIN, T. F. ET AL.: 'Discovery of Tyrosine- Based Potent and Selective Melanocortin-1 Receptor Small-Molecule Agonists with Anti- inflammatory Properties' JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY vol. 46, no. 7, 2003, ISSN 0022-2623 pages 1123 - 1126, XP001182772

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. Et pyrrolidin-derivat representert med formel [I]:



5

hvor

ring A er en eventuelt substituert fenyl-gruppe

hvor substituent(er) på den eventuelt substituerte fenyl-gruppen er ett til tre gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et halogenatom, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), en C₃-C₇ sykloalkyl-gruppe, en C₁-C₆ alkoksy-gruppe, en C₁-C₆ haloalkoksy-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), og en C₁-C₆ alkilenoksy-gruppe;

R¹ er en eventuelt substituert C₁-C₆ alkyl-gruppe, en eventuelt substituert C₃-C₇ sykloalkyl-gruppe, en eventuelt substituert adamantyl-gruppe, en eventuelt substituert 4- til 8-leddet alifatisk heterosyklisk gruppe som inneholder ett til tre heteroatom(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av oksygen-, svovel-, og nitrogenatomer, en eventuelt substituert 6- til 10-leddet aryl-gruppe som kan være delvis hydrogenert, en eventuelt substituert 5- til 10-leddet heteroaryl-gruppe som inneholder ett til fire heteroatomer(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av svovel-, oksygen-, og nitrogenatomer, eller en karbamoyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r),

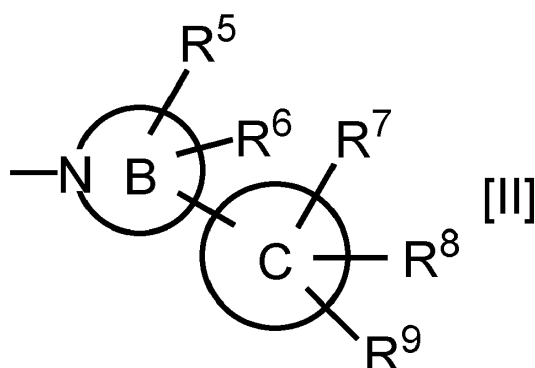
hvor substituent(er) på den eventuelt substituerte C₁-C₆ alkyl-gruppen er ett til tre gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et halogenatom; en hydroksy-gruppe; en okso-gruppe; en cyano-gruppe; en C₃-C₇ sykloalkyl-gruppe; en C₁-C₆ alkoksy-gruppe; en C₁-C₆ alkanoyl-gruppe; en karbamoyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r); en 4- til 8-leddet alifatisk heterosyklisk gruppe som inneholder ett til tre heteroatom(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av oksygen-, svovel-, og nitrogenatomer; en 4- til 8-leddet alifatisk heterosyklisk karbonyl-gruppe som inneholder ett til tre heteroatom(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av oksygen-, svovel-, og

nitrogenatomer eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et halogenatom, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), og en C₁-C₆ alkoksyalkyl-gruppe; en C₁-C₆ alkylsulfonyl-gruppe; en 4- til 8-leddet alifatisk heterosyklisk sulfonyl-gruppe som inneholder ett til tre heteroatom(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av oksygen-, svovel-, og nitrogenatomer; og en C₁-C₆ alkyleneoksy-gruppe, og

substituent(er) på hver av den eventuelt substituerte C₃-C₇ sykloalkyl-gruppen, den eventuelt substituert 4- til 8-leddet alifatisk heterosyklisk gruppe som inneholder ett til tre heteroatom(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av oksygen-, svovel-, og nitrogenatomer, den eventuelt substituerte 6- til 10-leddede aryl-gruppen som kan være delvis hydrogenert, og den eventuelt substituerte 5- til 10-leddede aryl-gruppen som inneholder ett til fire hetero-atomer(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av svovel-, oksygen-, og nitrogenatomer er ett til tre gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et halogenatom; en hydroksy-gruppe; en okso-gruppe; en cyano-gruppe; en C₁-C₆ alkyl-gruppe; en C₁-C₆ halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er); en C₃-C₇ sykloalkyl-gruppe; en C₁-C₆ alkoksy-gruppe; en C₁-C₆ hydroksyalkyl-gruppe; en C₁-C₆ alkoksyalkyl-gruppe; en C₁-C₆ alkanoyl-gruppe; en karbamoyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r); en 4- til 8-leddet alifatisk heterosyklisk gruppe som inneholder ett til tre heteroatom(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av oksygen-, svovel-, og nitrogenatomer; en 4- til 8-leddet alifatisk heterosyklisk karbonyl-gruppe som inneholder ett til tre heteroatom(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av oksygen-, svovel-, og nitrogenatomer eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et halogenatom, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), og en C₁-C₆ alkoksyalkyl-gruppe; en C₁-C₆ alkylsulfonyl-gruppe; en 4- til 8-leddet alifatisk heterosyklisk sulfonyl-gruppe som inneholder ett til tre heteroatom(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av oksygen-, svovel-, og nitrogenatomer; og en C₁-C₆ alkyleneoksy-gruppe;

R² er et halogenatom, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, eller en C₁-C₆ alkoksy-gruppe;

R³ og R⁴ er terminalt bundet til hverandre, og sammen med nitrogenatomet til hvilket de er bundet, danner en gruppe representert med formel [II]:



5 hvor ring B representerer en nitrogen-inneholdende 4-to 8-leddet alifatisk hetero-
syklisk gruppe som kan delvis inneholde en dobbeltbinding;

ring C representerer en 6- til 10-leddet aryl-gruppe eller en 5- til 10-leddet
heteroaryl-gruppe som inneholder ett til fire heteroatom(er) uavhengig valgt fra
gruppen bestående av svovel-, oksygen-, og nitrogenatomer;

10 R^5 og R^6 hver uavhengig representerer en gruppe valgt fra gruppen bestående av
et hydrogenatom, et halogenatom, en cyano-gruppe, en C_1 - C_6 alkyl-gruppe, en
 C_1 - C_6 halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), en C_1 - C_6
cyanoalkyl-gruppe, en C_1 - C_6 hydroksyalkyl-gruppe, en C_1 - C_6 alkoksyalkyl-gruppe,
en karboksyl-gruppe, en karbamoyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to
 C_1 - C_6 alkyl-gruppe(r), og en C_1 - C_6 alkoksy-gruppe;

15 R^7 representerer en eventuelt substituert C_1 - C_6 alkyl-gruppe, en eventuelt
substituert C_2 - C_6 alkenyl-gruppe, en eventuelt substituert C_3 - C_7 sykloalkyl-gruppe,
en eventuelt substituert C_3 - C_7 sykloalkenyl-gruppe, en eventuelt substituert 6- til
10-leddet aryl-gruppe, en eventuelt substituert 5- til 10-leddet heteroaryl-gruppe
som inneholder ett til fire heteroatom(er) uavhengig valgt fra gruppen
20 bestående av svovel-, oksygen-, og nitrogenatomer, en eventuelt substituert 4- til
8-leddet alifatisk heterosyklisk gruppe som inneholder ett til tre heteroatom(er)
uavhengig valgt fra gruppen bestående av oksygen-, svovel-, og nitrogenatomer,
en eventuelt substituert C_1 - C_6 alkoksy-gruppe, en amino-gruppe eventuelt
substituert med én eller to C_1 - C_6 alkyl-gruppe(r) eventuelt substituert med en
25 karboksyl-gruppe, eller en karbamoyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to
 C_1 - C_6 alkyl-gruppe(r) eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe,

30 hvor substituent(er) på den eventuelt substituerte C_1 - C_6 alkyl-gruppen er én eller
to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av en hydroksy-gruppe; en
okso-gruppe; en cyano-gruppe; en C_1 - C_6 alkoksy-gruppe; en C_1 - C_6 alkanoyl-
gruppe; en karboksyl-gruppe; en C_1 - C_6 alkoksykarbonyl-gruppe; en 4- til 8-leddet

alifatisk heterosyklisk karbonyl-gruppe som inneholder ett til tre heteroatom(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av oksygen-, svovel-, og nitrogenatomer eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe; en 5- til 10-leddet heteroaryl-gruppe som inneholder ett til fire heteroatom(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av svovel-, oksygen-, og nitrogenatomer eventuelt substituert med en hydroksy- eller en okso-gruppe; en 4- til 8-leddet alifatisk heterosyklisk gruppe som inneholder ett til tre heteroatom(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av oksygen-, svovel-, og nitrogenatomer eventuelt substituert med én eller to okso-gruppe(r); en karbamoyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av en C₁-C₆ alkyl-gruppe (C₁-C₆ alkyl-delen er eventuelt substituert med en hydroksyl-gruppe, en C₁-C₆ alkoksy-gruppe, eller en karboksyl-gruppe) og en hydroksy-gruppe; en C₁-C₆ alkylsulfonyl-gruppe; en aminosulfonyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r); en aminosulfonylaminokarbonyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r); en C₁-C₆ alkylsulfonyl-aminokarbonyl-gruppe; og en amino-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ alkanoyl-gruppe, og en C₁-C₆ alkylsulfonyl-gruppe, og

substituent(er) på hver av den eventuelt substituerte C₂-C₆ alkenyl-gruppen, den eventuelt substituert C₃-C₇ sykloalkyl-gruppen, den eventuelt substituert C₃-C₇ sykloalkenyl-gruppen, den eventuelt substituerte 6- til 10-leddede aryl-gruppen, den eventuelt substituert 5- til 10-leddet heteroaryl-gruppe som inneholder ett til fire heteroatom(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av svovel-, oksygen-, og nitrogenatomer, den eventuelt substituerte 4- til 8-leddede alifatiske heterosykliske gruppen som inneholder ett til tre heteroatom(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av oksygen-, svovel-, og nitrogenatomer, og den eventuelt substituerte C₁-C₆ alkoksy-gruppen er én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av en hydroksy-gruppe; en okso-gruppe; en cyano-gruppe; en C₁-C₆ alkyl-gruppe eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe; en C₁-C₆ alkoksy-gruppe; en C₁-C₆ alkanoyl-gruppe; en karboksyl-gruppe; en C₁-C₆ alkoksykarbonyl-gruppe; en 4- til 8-leddet alifatisk heterosyklisk karbonyl-gruppe som inneholder ett til tre heteroatom(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av oksygen-, svovel-, og nitrogenatomer eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe; en 5- til 10-leddet heteroaryl-gruppe som inneholder ett til fire heteroatom(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av svovel-, oksygen-, og nitrogenatomer eventuelt substituert med en hydroksy- eller en okso-gruppe; en 4- til 8-leddet alifatisk heterosyklisk gruppe som inneholder ett til tre heteroatom(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av oksygen-, svovel-, og nitrogenatomer eventuelt substituert med én eller to okso-gruppe(r); en

karbamoyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av en C₁-C₆ alkyl-gruppe (C₁-C₆ alkyl-delen er eventuelt substituert med en hydroksy-gruppe, en C₁-C₆ alkoksy-gruppe, eller en karboksyl-gruppe) og en hydroksy-gruppe; en C₁-C₆ alkylsulfonyl-gruppe; en aminosulfonyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r); en aminosulfonylaminokarbonyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r); en C₁-C₆ alkylsulfonylaminokarbonyl-gruppe; og en amino-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ alkanoyl-gruppe, og en C₁-C₆ alkylsulfonyl-gruppe; og

R⁸ og R⁹ hver uavhengig representerer en gruppe valgt fra gruppen bestående av et hydrogenatom, et halogenatom, en cyano-gruppe, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), og en C₁-C₆ haloalkoksy-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er).

2. Forbindelsen eller farmasøytisk akseptabelt salt derav i henhold til krav 1, hvor ring A er en eventuelt substituert fenyl-gruppe,

hvor substituent(er) på den eventuelt substituerte fenyl-gruppen er ett til tre gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et halogenatom, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), en C₃-C₇ sykloalkyl-gruppe, en C₁-C₆ alkoksy-gruppe, en C₁-C₆ haloalkoksy-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), og en C₁-C₆ alkylenoksy-gruppe;

R¹ er en eventuelt substituert C₁-C₆ alkyl-gruppe, en eventuelt substituert C₃-C₇ sykloalkyl-gruppe, en eventuelt substituert adamantyl-gruppe, en eventuelt substituert alifatisk heterosyklisk gruppe, en eventuelt substituert 6- til 10-leddet aryl-gruppe som kan være delvis hydrogenert, en eventuelt substituert heteroaryl-gruppe, eller en karbamoyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r),

hvor substituent(er) på den eventuelt substituerte C₁-C₆ alkyl-gruppen er ett til tre gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et halogenatom; en hydroksy-gruppe; en okso-gruppe; en cyano-gruppe; en C₃-C₇ sykloalkyl-gruppe; en C₁-C₆ alkoksy-gruppe; en C₁-C₆ alkanoyl-gruppe; en karbamoyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r); en 4- til 7-leddet monosyklisk alifatisk heterosyklisk gruppe som inneholder ett eller to heteroatom(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et oksygenatom, et svovelatom, og et nitrogenatom; en alifatisk heterosyklisk karbonyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et halogenatom, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), og en C₁-C₆ alkoksyalkyl-gruppe; en C₁-C₆

alkylsulfonyl-gruppe; en alifatisk heterosyklisk sulfonyl-gruppe; og en C₁-C₆ alkyleneoksy-gruppe,

substituent(er) på hver av den eventuelt substituerte C₃-C₇ sykloalkyl-gruppen, den eventuelt substituerte alifatiske heterosykliske gruppen, den eventuelt substituerte 6- til 10-leddede aryl-gruppen som kan være delvis hydrogenert, og den eventuelt substituerte heteroaryl-gruppen er ett til tre gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et halogenatom; en hydrokso-gruppe; en okso-gruppe; en cyano-gruppe; en C₁-C₆ alkyl-gruppe; en C₁-C₆ halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er); en C₃-C₇ sykloalkyl-gruppe; en C₁-C₆ alkoksy-gruppe; en C₁-C₆ hydroksyalkyl-gruppe; en C₁-C₆ alkoksyalyl-gruppe; en C₁-C₆ alkanoyl-gruppe; en karbamoyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r); en 4- til 7-leddet monosyklisk alifatisk heterosyklisk gruppe som inneholder ett eller to heteroatom(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et oksygenatom, et svovelatom, og et nitrogenatom; en alifatisk heterosyklisk karbonyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et halogenatom, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), og en C₁-C₆ alkoksyalyl-gruppe; en C₁-C₆ alkylsulfonyl-gruppe; en alifatisk heterosyklisk sulfonyl-gruppe; og en C₁-C₆ alkyleneoksy-gruppe,

den alifatiske heterosykliske delen av hver av den alifatiske heterosykliske karbonyl-gruppen og den alifatiske heterosykliske sulfonyl-gruppen med hvilken R¹ er substituert er en 4- til 7-leddet monosyklisk alifatisk heterosyklisk ring som inneholder minst ett nitrogenatom, og en eventuelt videre inneholdende ett heteroatom valgt fra gruppen bestående av et oksygenatom, et svovelatom, og et nitrogenatom,

den alifatiske heterosykliske delen av den eventuelt substituerte alifatiske heterosykliske gruppen representert av R¹ er en 4- til 7-leddet monosyklisk alifatisk heterosyklisk ring som inneholder ett eller to heteroatom(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et oksygenatom, et svovelatom, og et nitrogenatom, og

heteroaryl-delen av den eventuelt substituerte heteroaryl-gruppen representert av R¹ er en 5- eller 6-leddet monosyklisk heteroaryl som inneholder ett til fire heteroatomer(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et oksygenatom, et svovelatom, og et nitrogenatom;

R² er et halogenatom, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, eller en C₁-C₆ alkoksy-gruppe;

R³ og R⁴ er terminalt bundet til hverandre, og sammen med nitrogenatomet til hvilket de er bundet, danner en gruppe representert med formel [II],

hvor ring B er en 4- til 8-leddet monosyklisk eller bisyklisk alifatisk heterosyklisk gruppe som videre kan inneholde, i tillegg til nitrogenatomet vist i formel [II], ett heteroatom

valgt fra gruppen bestående av et oksygenatom, et svovelatom, og et nitrogenatom, og kan delvis inneholde en dobbeltbinding;

ring C er en monosyklisk 6- til 10-leddet aryl-gruppe, eller en 5- eller 6-leddet monosyklisk heteroaryl-gruppe som inneholder ett til fire heteroatom(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et oksygenatom, et svovelatom, og et nitrogenatom;

R⁵ og R⁶ er hver uavhengig en gruppe valgt fra gruppen bestående av et hydrogenatom, et halogenatom, en cyano-gruppe, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), en C₁-C₆ cyanoalkyl-gruppe, en C₁-C₆ hydroksyalkyl-gruppe, en C₁-C₆ alkoksyalkyl-gruppe, en karboksyl-gruppe, en karbamoyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r), og en C₁-C₆ alkoksy-gruppe;

R⁷ er en eventuelt substituert C₁-C₆ alkyl-gruppe, en eventuelt substituert C₂-C₆ alkenyl-gruppe, en eventuelt substituert C₃-C₇ sykloalkyl-gruppe, en eventuelt substituert C₃-C₇ sykloalkenyl-gruppe, en eventuelt substituert 6- til 10-leddet aryl-gruppe, en eventuelt substituert heteroaryl-gruppe, en eventuelt substituert alifatisk heterosyklisk gruppe, en eventuelt substituert C₁-C₆ alkoksy-gruppe, en amino-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r) eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe, eller en karbamoyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r) eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe,

hvor substituent(er) på den eventuelt substituerte C₁-C₆ alkyl-gruppen er én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av en hydroksy-gruppe; en okso-gruppe; en cyano-gruppe; en C₁-C₆ alkoksy-gruppe; en C₁-C₆ alkanoyl-gruppe; en karboksyl-gruppe; en C₁-C₆ alkoksykarbonyl-gruppe; en 4- til 8-leddet alifatisk heterosyklisk karbonyl-gruppe som inneholder ett til tre heteroatom(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av oksygen-, svovel-, og nitrogenatomer eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe; en 5- til 10-leddet heteroaryl-gruppe som inneholder ett til fire heteroatom(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av svovel-, oksygen-, og nitrogenatomer eventuelt substituert med en hydroksy- eller en okso-gruppe; en 4- til 7-leddet monosyklisk alifatisk heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med én eller to okso-gruppe(r), og som inneholder ett eller to heteroatom(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et oksygenatom, et svovelatom, og et nitrogenatom; en karbamoyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av en C₁-C₆ alkyl-gruppe (C₁-C₆ alkyl-gruppen er eventuelt substituert med en hydroksy-, en C₁-C₆ alkoksy-, eller en karboksyl-gruppe) og en hydroksy-gruppe; en C₁-C₆ alkylsulfonyl-gruppe; en aminosulfonyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r); en aminosulfonylaminokarbonyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r); en C₁-C₆ alkylsulfonyl-aminokarbonyl-gruppe; og en amino-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra

gruppen bestående av en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ alkanoyl-gruppe, og en C₁-C₆ alkylsulfonyl-gruppe,

substituent(er) på hver av den eventuelt substituerte C₂-C₆ alkenyl-gruppen, den eventuelt substituert C₃-C₇ sykloalkyl-gruppen, den eventuelt substituert C₃-C₇ syklo-alkenyl-gruppen, den eventuelt substituerte 6- til 10-leddede aryl-gruppen, den eventuelt substituert heteroaryl-gruppen, den eventuelt substituert alifatisk heterosyklisk gruppe, og den eventuelt substituerte C₁-C₆ alkoksyl-gruppen er én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av en hydroksyl-gruppe; en okso-gruppe; en cyano-gruppe; en C₁-C₆ alkyl-gruppe eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe; en C₁-C₆ alkoksyl-gruppe; en C₁-C₆ alkanoyl-gruppe; en karboksyl-gruppe; en C₁-C₆ alkoksylkarbonyl-gruppe; en 4- til 8-leddet alifatisk heterosyklisk karbonyl-gruppe som inneholder ett til tre heteroatom(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av oksygen-, svovel-, og nitrogenatomer eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe; en 5- til 10-leddet heteroaryl-gruppe som inneholder ett til fire heteroatomer(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av svovel-, oksygen-, og nitrogenatomer eventuelt substituert med en hydroksyl- eller en okso-gruppe; en 4- til 7-leddet monosyklisk alifatisk heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med én eller to okso-gruppe(r), og som inneholder ett eller to heteroatom(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et oksygenatom, et svovelatom, og et nitrogenatom; en karbamoyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av en C₁-C₆ alkyl-gruppe (C₁-C₆ alkyl-gruppen er eventuelt substituert med en hydroksyl-gruppe, en C₁-C₆ alkoksyl-gruppe, eller en karboksyl-gruppe) og en hydroksyl-gruppe; en C₁-C₆ alkylsulfonyl-gruppe; en aminosulfonyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r); en aminosulfonylaminokarbonyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r); en C₁-C₆ alkylsulfonylaminokarbonyl-gruppe; og en amino-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ alkanoyl-gruppe, og en C₁-C₆ alkylsulfonyl-gruppe, den alifatiske heterosykliske delen av den alifatiske heterosykliske karbonyl-gruppen med hvilken R⁷ er substituert er en 4- til 7-leddet monosyklisk alifatisk heterosyklisk ring som inneholder minst ett nitrogenatom, og eventuelt videre inneholdende ett heteroatom valgt fra gruppen bestående av et oksygenatom, et svovelatom, og et nitrogenatom,

heteroaryl-gruppen med hvilken R⁷ er substituert er en 5- eller 6-leddet monosyklisk heteroaryl-gruppe som inneholder ett til fire heteroatomer(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et oksygenatom, et svovelatom, og et nitrogenatom,

heteroaryl-delen av den eventuelt substituerte heteroaryl-gruppen representert av R⁷ er en 5- eller 6-leddet monosyklisk heteroaryl som inneholder ett til fire heteroatomer(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et oksygenatom, et svovelatom, og et nitrogenatom, og

den alifatiske heterosykliske delen av den eventuelt substituerte alifatiske heterosykliske gruppen representert av R^7 er en 4- til 8-leddet monosyklisk eller bisyklisk alifatisk heterosyklisk ring som inneholder ett eller to heteroatom(er) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et oksygenatom, et svovelatom, og et nitrogenatom; og

- 5 R^8 og R^9 er hver uavhengig en gruppe valgt fra gruppen bestående av et hydrogenatom, et halogenatom, en cyano-gruppe, en C_1 - C_6 alkyl-gruppe, en C_1 - C_6 halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), og en C_1 - C_6 haloalkoksy-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er).

- 10 **3.** Forbindelsen eller farmasøytisk akseptabelt salt derav i henhold til et hvilket som helst av kravene 1 til 2, hvor

ring A er en eventuelt substituert fenyl-gruppe,

- hvor substituent(er) på den eventuelt substituerte fenyl-gruppen er én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et halogenatom, en C_1 - C_6 alkyl-gruppe, en C_1 - C_6 halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), en C_3 - C_7 sykloalkyl-gruppe, en C_1 - C_6 alkoksy-gruppe, en C_1 - C_6 haloalkoksy-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), og en C_1 - C_6 alkylenoksy-gruppe,

- R^1 er en eventuelt substituert C_1 - C_6 alkyl-gruppe, en eventuelt substituert C_3 - C_7 sykloalkyl-gruppe, en eventuelt substituert adamantyl-gruppe, en eventuelt substituert alifatisk heterosyklisk gruppe, en eventuelt substituerte aryl-gruppen som kan være delvis hydrogenert, en eventuelt substituert heteroaryl-gruppe, eller en karbamoyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C_1 - C_6 alkyl-gruppe(r),

- hvor substituent(er) på den eventuelt substituerte C_1 - C_6 alkyl-gruppen er én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et halogenatom; en hydroksy-gruppe; en okso-gruppe; en cyano-gruppe; en C_3 - C_7 sykloalkyl-gruppe; en C_1 - C_6 alkoksy-gruppe; en C_1 - C_6 alkanoyl-gruppe; en karbamoyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C_1 - C_6 alkyl-gruppe(r); en alifatisk heterosyklisk gruppe; en alifatisk heterosyklisk karbonyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et halogenatom, en C_1 - C_6 alkyl-gruppe, en C_1 - C_6 halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), og en C_1 - C_6 alkoksy-alkyl-gruppe; en C_1 - C_6 alkylsulfonfyl-gruppe; en alifatisk heterosyklisk sulfonfyl-gruppe; og en C_1 - C_6 alkylenoksy-gruppe,

- substituent(er) på hver av den eventuelt substituerte C_3 - C_7 sykloalkyl-gruppen, den eventuelt substituerte alifatiske heterosykliske gruppen, den eventuelt substituerte aryl-gruppen som kan være delvis hydrogenert, og den eventuelt substituerte heteroaryl-gruppen er én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et

halogenatom; en hydroksy-gruppe; en okso-gruppe; en cyano-gruppe; en C₁-C₆ alkyl-gruppe; en C₁-C₆ halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er); en C₃-C₇ sykloalkyl-gruppe; en C₁-C₆ alkoksy-gruppe; en C₁-C₆ hydroksyalkyl-gruppe; en C₁-C₆ alkoksyalkyl-gruppe; en C₁-C₆ alkanoyl-gruppe; en karbamoyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r); en alifatisk heterosyklisk gruppe; en alifatisk heterosyklisk karbonyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et halogenatom, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), og en C₁-C₆ alkoksyalkyl-gruppe; en C₁-C₆ alkylsulfonyl-gruppe; en alifatisk heterosyklisk sulfonyl-gruppe; og en C₁-C₆ alkylenoksy-gruppe,

den alifatiske heterosykliske gruppen med hvilken R¹ er substituert er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en azetidinyI-gruppe, en pyrrolidinyI-gruppe, en tetrahydro-furanyI-gruppe, en imidazolinyl-gruppe, en tiazolidinyI-gruppe, en isotiazolidinyI-gruppe, en piperidinyI-gruppe, en piperazinyI-gruppe, en morfolinyI-gruppe, en tiomorfolinyI-gruppe, en tetrahydropyranyI-gruppe, en homopiperazinyI-gruppe, og en homomorfolinyI-gruppe,

den alifatiske heterosykliske delen av hver av den alifatiske heterosykliske karbonyl-gruppen og den alifatiske heterosykliske sulfonyl-gruppen med hvilken R¹ er substituert er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en azetidinyI-gruppe, en pyrrolidinyI-gruppe, en imidazolinyl-gruppe, en tiazolidinyI-gruppe, en isotiazolidinyI-gruppe, en piperidinyI-gruppe, en piperazinyI-gruppe, en morfolinyI-gruppe, en tiomorfolinyI-gruppe, en homopiperazinyI-gruppe, og en homomorfolinyI-gruppe,

aryl-delen av den eventuelt substituerte aryl-gruppen som kan være delvis hydrogenert representert av R¹ er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en fenyl-gruppe, en naftyl-gruppe, en dihydrofenyl-gruppe, en indanyl-gruppe, og en tetrahydronaftyl-gruppe,

den alifatiske heterosykliske delen av den eventuelt substituerte alifatiske heterosykliske gruppen representert av R¹ er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en azetidinyI-gruppe, en pyrrolidinyI-gruppe, en tetrahydrofuranyI-gruppe, en imidazolinyl-gruppe, en tiazolidinyI-gruppe, en isotiazolidinyI-gruppe, en piperidinyI-gruppe, en piperazinyI-gruppe, en morfolinyI-gruppe, en tiomorfolinyI-gruppe, en tetrahydropyranyI-gruppe, en homopiperazinyI-gruppe, og en homomorfolinyI-gruppe, og

heteroaryl-delen av den eventuelt substituerte heteroaryl-gruppen representert av R¹ er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en pyrrolyl-gruppe, en furanyl-gruppe, en tienyl-gruppe, en imidazolyl-gruppe, en pyrazolyl-gruppe, en oksazolyl-gruppe, en isoksazolyl-gruppe, en tiazolyl, tetrazolyl, oksadiazolyl, pyridinyI, pyrazinyI-gruppe, en pyrimidinyI-gruppe, en pyridazinyI-gruppe, en tiazinyI-gruppe, og en triazinyI-gruppe;

R² er et halogenatom, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, eller en C₁-C₆ alkoksy-gruppe;

R³ og R⁴ er terminalt bundet til hverandre, og sammen med nitrogenatomet til hvilket de er bundet, danner en gruppe representert med formel [II],

hvor ring B er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en azetidinyI-gruppe, en pyrrolidinyl-gruppe, en imidazolinyI-gruppe, en tiazolidinyI-gruppe, en isotiazolidinyI-gruppe, en piperidinyl-gruppe, en piperazinyl-gruppe, en morfolinyI-gruppe, en tiomorfolinyI-gruppe, en tetrahydropyridinyI-gruppe, en homopiperazinyl-gruppe, en homomorfolinyI-gruppe, en 3-azabisyklo-[3.1.0]-heksyl-gruppe, og en oktahydropyrrolo-[3,4-c]-pyrrolyl-gruppe;

ring C er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en fenyl-gruppe, en pyrrolyl-gruppe, en furanyl-gruppe, en tienyl-gruppe, en imidazolyl-gruppe, en pyrazolyl-gruppe, en oksazolyl-gruppe, en isoksazolyl-gruppe, en tiazolyl-gruppe, en tetrazolyl-gruppe, en oksadiazolyl-gruppe, en pyridinyI-gruppe, en pyrazinyI-gruppe, en pyrimidinyl-gruppe, en pyridazinyl-gruppe, en tiazinyI-gruppe, og en triazinyl-gruppe;

R⁵ og R⁶ er hver uavhengig en gruppe valgt fra gruppen bestående av et hydrogenatom, et halogenatom, en cyano-gruppe, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), en C₁-C₆ cyanoalkyl-gruppe, en C₁-C₆ hydroksyalkyl-gruppe, en C₁-C₆ alkoksyalkyl-gruppe, en karboksyl-gruppe, en karbamoyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r), og en C₁-C₆ alkoksy-gruppe;

R⁷ er en eventuelt substituert C₁-C₆ alkyl-gruppe, en eventuelt substituert C₂-C₆ alkenyl-gruppe, en eventuelt substituert C₃-C₇ sykloalkyl-gruppe, en eventuelt substituert C₃-C₇ sykloalkenyl-gruppe, en eventuelt substituert 6- til 10-leddet aryl-gruppe, en eventuelt substituert heteroaryl-gruppe, en eventuelt substituert alifatisk heterosyklisk gruppe, en eventuelt substituert C₁-C₆ alkoksy-gruppe, en amino-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r) eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe, eller en karbamoyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r) eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe,

hvor substituent(er) på den eventuelt substituerte C₁-C₆ alkyl-gruppen er én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av en hydroksy-gruppe; en okso-gruppe; en cyano-gruppe; en C₁-C₆ alkoksy-gruppe; en C₁-C₆ alkanoyl-gruppe; en karboksyl-gruppe; en C₁-C₆ alkoksykarbonyl-gruppe; en alifatisk heterosyklisk karbonyl-gruppe eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe; en heteroaryl-gruppe eventuelt substituert med en hydroksy-gruppe eller en okso-gruppe; en alifatisk heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med én eller to okso-gruppe(r); en karbamoyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av en C₁-C₆ alkyl-gruppe (C₁-C₆ alkyl-gruppen er eventuelt substituert med en hydroksy-gruppe, en C₁-C₆ alkoksy-gruppe, eller en karboksyl-gruppe) og en hydroksy-gruppe; en

C₁-C₆ alkylsulfonyl-gruppe; en aminosulfonyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r); en aminosulfonylaminokarbonyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r); en C₁-C₆ alkylsulfonylaminokarbonyl-gruppe; og en amino-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ alkanoyl-gruppe, og en C₁-C₆ alkylsulfonyl-gruppe,

substituent(er) på hver av den eventuelt substituerte C₂-C₆ alkenyl-gruppen, den eventuelt substituert C₃-C₇ sykloalkyl-gruppen, den eventuelt substituert C₃-C₇ sykloalkenyl-gruppen, den eventuelt substituert 6- til 10-leddet aryl-gruppen, den eventuelt substituert heteroaryl-gruppen, den eventuelt substituert alifatisk heterosyklisk gruppe, og den eventuelt substituerte C₁-C₆ alkoksy-gruppen er én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av en hydroksy-gruppe; en okso-gruppe; en cyano-gruppe; en C₁-C₆ alkyl-gruppe eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe; en C₁-C₆ alkoksy-gruppe; en C₁-C₆ alkanoyl-gruppe; en karboksyl-gruppe; en C₁-C₆ alkoksykarbonyl-gruppe; en alifatisk heterosyklisk karbonyl-gruppe eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe; en heteroaryl-gruppe eventuelt substituert med en hydroksy-gruppe eller en okso-gruppe; en alifatisk heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med én eller to okso-gruppe(r); en karbamoyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av en C₁-C₆ alkyl-gruppe (C₁-C₆ alkyl-gruppen er eventuelt substituert med en hydroksy-gruppe, en C₁-C₆ alkoksy-gruppe, eller en karboksyl-gruppe) og en hydroksy-gruppe; en C₁-C₆ alkylsulfonyl-gruppe; en aminosulfonyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r); en aminosulfonylaminokarbonyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r); en C₁-C₆ alkylsulfonylaminokarbonyl-gruppe; og en amino-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ alkanoyl-gruppe, og en C₁-C₆ alkylsulfonyl-gruppe,

den alifatiske heterosykliske delen av den alifatiske heterosykliske karbonyl-gruppen med hvilken R⁷ er substituert er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en azetidinyll-gruppe, en pyrrolidinyll-gruppe, en imidazolinyll-gruppe, en tiazolidinyll-gruppe, en isotiazolidinyll-gruppe, en piperidinyll-gruppe, en piperazinyll-gruppe, en morfolinyll-gruppe, en tiomorfolinyll-gruppe, en homopiperazinyll-gruppe, og en homomorfolinyll-gruppe,

heteroaryl-gruppen med hvilken R⁷ er substituert er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en pyrrolyll-gruppe, en furanyll-gruppe, en tienyll-gruppe, en imidazolyl-gruppe, en pyrazolyl-gruppe, en oksazolyl-gruppe, en isoksazolyl-gruppe, en tiazolyl-gruppe, en tetrazolyl-gruppe, en oksadiazolyl-gruppe, en pyridinyll-gruppe, en pyrazinyll-gruppe, en pyrimidinyll-gruppe, en pyridazinyll-gruppe, en tiazinyll-gruppe, og en triazinyll-gruppe,

den alifatiske heterosykliske gruppen med hvilken R^7 er substituert er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en azetidinyll-gruppe, en pyrrolidinyll-gruppe, en tetrahydro-furanyll-gruppe, en imidazolinyll-gruppe, en tiazolidinyll-gruppe, en isotiazolidinyll-gruppe, en piperidinyll-gruppe, en piperazinyll-gruppe, en morfolinyll-gruppe, en tiomorfolinyll-gruppe, en tetrahydropyranyll-gruppe, en homopiperazinyll-gruppe, og en homomorfolinyll-gruppe,

heteroaryl-delen av den eventuelt substituerte heteroaryl-gruppen representert av R^7 er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en pyrrolyll-gruppe, en furanyll-gruppe, en tienyll-gruppe, en imidazolyl-gruppe, en pyrazolyl-gruppe, en oksazolyl-gruppe, en isoksazolyl-gruppe, en tiazolyl-gruppe, en tetrazolyl-gruppe, en oksadiazolyl-gruppe, en pyridinyll-gruppe, en pyrazinyll-gruppe, en pyrimidinyll-gruppe, en pyridazinyll-gruppe, en tiazinyll-gruppe, og en triazinyll-gruppe, og

den alifatiske heterosykliske delen av den eventuelt substituerte alifatiske heterosykliske gruppen representert av R^7 er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en azetidinyll-gruppe, en pyrrolidinyll-gruppe, en tetrahydrofuranyll-gruppe, en imidazolinyll-gruppe, en tiazolidinyll-gruppe, en isotiazolidinyll-gruppe, en piperidinyll-gruppe, en piperazinyll-gruppe, en morfolinyll-gruppe, en tiomorfolinyll-gruppe, en tetrahydropyranyll-gruppe, en homopiperazinyll-gruppe, en homomorfolinyll-gruppe, en 3-azabisyklo-[3.1.0]-heksyll-gruppe, og en oktahydropyrrolo-[3,4-c]-pyrrolyll-gruppe; og

R^8 og R^9 er hver uavhengig en gruppe valgt fra gruppen bestående av et hydrogenatom, et halogenatom, en cyano-gruppe, en C_1 - C_6 alkyl-gruppe, en C_1 - C_6 halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), og en C_1 - C_6 haloalkoksy-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er).

4. Forbindelsen eller farmasøytisk akseptabelt salt derav i henhold til et hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvor

ring A er en fenyl-gruppe hver eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et halogenatom, en C_1 - C_6 alkyl-gruppe, en C_1 - C_6 halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), en C_3 - C_7 sykloalkyl-gruppe, en C_1 - C_6 alkoksy-gruppe, en C_1 - C_6 haloalkoksy-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), og en C_1 - C_6 alkyleneoksy-gruppe;

R^1 er

(1) en C_1 - C_6 alkyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et halogenatom; en hydroksy-gruppe; en C_3 - C_7 sykloalkyl-gruppe; en C_1 - C_6 alkoksy-gruppe; en alifatisk heterosyklisk gruppe; en alifatisk heterosyklisk karbonyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et halogenatom, en

C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), og en C₁-C₆ alkoksyalkyl-gruppe; en alifatisk heterosyklisk sulfonyl-gruppe; og en karbamoyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r)

(hvor den alifatiske heterosykliske gruppen er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en azetidinyI-gruppe, en pyrrolidinyl-gruppe, en tetrahydrofuranyl-gruppe, en imidazolinyI-gruppe, en tiazolidinyI-gruppe, en isotiazolidinyI-gruppe, en piperidinyl-gruppe, en piperazinyl-gruppe, en morfolinyI-gruppe, en tiomorfolinyI-gruppe, en tetrahydropyranyl-gruppe, en homopiperazinyl-gruppe, og en homomorfolinyI-gruppe, og

den alifatiske heterosykliske delen av hver av den alifatiske heterosykliske karbonyl-gruppen og den alifatiske heterosykliske sulfonyl-gruppen er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en azetidinyI-gruppe, en pyrrolidinyl-gruppe, en imidazolinyI-gruppe, en tiazolidinyI-gruppe, en isotiazolidinyI-gruppe, en piperidinyl-gruppe, en piperazinyl-gruppe, en morfolinyI-gruppe, en tiomorfolinyI-gruppe, en homopiperazinyl-gruppe, og en homomorfolinyI-gruppe),

(2) en monosyklisk C₃-C₇ sykloalkyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et halogenatom, en hydroksy-gruppe, en okso-gruppe, en cyano-gruppe, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ alkoksy-gruppe, en C₁-C₆ alkoksyalkyl-gruppe, og en C₁-C₆ alkyleneoksy-gruppe,

(3) en adamantyl-gruppe eventuelt substituert med en hydroksy-gruppe,

(4) en alifatisk heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med en gruppe valgt fra gruppen bestående av en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ hydroksyalkyl-gruppe, en C₁-C₆ halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), en C₁-C₆ alkanoyl-gruppe, og en C₁-C₆ alkylsulfonyl-gruppe

(hvor den alifatiske heterosykliske gruppen er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en azetidinyI-gruppe, en pyrrolidinyl-gruppe, en tetrahydrofuranyl-gruppe, en imidazolinyI-gruppe, en tiazolidinyI-gruppe, en isotiazolidinyI-gruppe, en piperidinyl-gruppe, en piperazinyl-gruppe, en morfolinyI-gruppe, en tiomorfolinyI-gruppe, en tetrahydropyranyl-gruppe, en homopiperazinyl-gruppe, og en homomorfolinyI-gruppe),

(5) en gruppe valgt fra gruppen bestående av en fenyl-gruppe, en naftyl-gruppe, en dihydrofenyl-gruppe, en indanyl-gruppe, og en tetrahydronaftyl-gruppe,

(6) en heteroaryl-gruppe som eventuelt er substituert med en gruppe valgt fra gruppen bestående av en cyano-gruppe, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ alkoksy-gruppe, og en karbamoyl-gruppe

(hvor heteroaryl-gruppen er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en pyrrolyl-gruppe, en furanyl-gruppe, en tienyl-gruppe, en imidazolyl-gruppe, en pyrazolyl-gruppe, en oksazolyl-gruppe, en isoksazolyl-gruppe, en tiazolyl-gruppe, en tetrazolyl-gruppe, en oksadiazolyl-gruppe, en pyridinyl-gruppe, en pyrazinyl-gruppe, en pyrimidinyl-gruppe, en pyridazinyl-gruppe, en tiazinyl-gruppe, og en triazinyl-gruppe),

(7) en karbamoyl-gruppe, eller

(8) en mono-C₁-C₆ alkylkarbamoyl-gruppe;

R² er en halogen atom, a C₁-C₆ alkyl-gruppe, eller an C₁-C₆ alkoksy-gruppe;

R³ og R⁴ er terminalt bundet til hverandre, og sammen med nitrogenatomet til hvilket de er bundet, danner en gruppe representert med formel [II],

hvor ring B er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en azetidinyll-gruppe, en imidazolinyl-gruppe, en tiazolidinyl-gruppe, en isotiazolidinyl-gruppe, en piperazinyl-gruppe, en morfolinyl-gruppe, en tiomorfolinyl-gruppe, en tetrahydropyridinyl-gruppe, en homopiperazinyl-gruppe, en homomorfolinyl-gruppe, en 3-azabisyklo-[3.1.0]-heksyl-gruppe, og en oktahydropyrrolo-[3,4-c]-pyrrolyl-gruppe, og både R⁵ og R⁶ representerer hydrogenatomer, eller

ring B er en piperidinyl-gruppe, og R⁵ og R⁶ er hver en gruppe uavhengig valgt fra gruppen bestående av et hydrogenatom, en cyano-gruppe, og en C₁-C₆ alkoksyalkyl-gruppe, eller

ring B er en pyrrolidinyl-gruppe, og R⁵ og R⁶ er hver en gruppe uavhengig valgt fra gruppen bestående av et hydrogenatom, et halogenatom, en cyano-gruppe, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), en C₁-C₆ cyanoalkyl-gruppe, en C₁-C₆ hydroksyalkyl-gruppe, en C₁-C₆ alkoksyalkyl-gruppe, en karboksyl-gruppe, en karbamoyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r), og en C₁-C₆ alkoksy-gruppe;

ring C er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en fenyl-gruppe, en pyrrolyl-gruppe, en furanyl-gruppe, en tienyl-gruppe, en imidazolyl-gruppe, en pyrazolyl-gruppe, en oksazolyl-gruppe, en isoksazolyl-gruppe, en tiazolyl-gruppe, en tetrazolyl-gruppe, en oksadiazolyl-gruppe, en pyridinyl-gruppe, en pyrazinyl-gruppe, en pyrimidinyl-gruppe, en pyridazinyl-gruppe, en tiazinyl-gruppe, og en triazinyl-gruppe;

R⁷ er

(1) en C₁-C₆ alkyl-gruppe eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe,

(2) en C₂-C₆ alkenyl-gruppe eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe,

(3) en 3- til 7-leddet monosyklisk sykloalkyl-gruppe eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe,

(4) en 3- til 7-leddet monosyklisk sykloalkenyl-gruppe eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe,

5 (5) en fenyl-gruppe eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe,

(6) en heteroaryl-gruppe som eventuelt er substituert med en karboksyl-gruppe eller en C₁-C₆ alkyl-gruppe eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe (hvor heteroaryl-gruppen er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en pyrrolyl-gruppe, en furanyl-gruppe, en tienyl-gruppe, en imidazolyl-gruppe, en pyrazolyl-gruppe, en oksazolyl-gruppe, en isoksazolyl-gruppe, en tiazolyl-gruppe, en tetrazolyl-gruppe, en oksadiazolyl-gruppe, en pyridinyl-gruppe, en pyrazinyl-gruppe, en pyrimidinyl-gruppe, en pyridazinyl-gruppe, en tiazinyl-gruppe, og en triazinyl-gruppe),

15 (7) en alifatisk heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av en hydroksy-gruppe; en okso-gruppe; en cyano-gruppe; en C₁-C₆ alkyl-gruppe eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe; en C₁-C₆ alkoksy-gruppe; en C₁-C₆ alkanoyl-gruppe; en karboksyl-gruppe; en C₁-C₆ alkoksykarbonyl-gruppe; en karbamoyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen
20 bestående av en C₁-C₆ alkyl-gruppe (C₁-C₆ alkyl-gruppen er eventuelt substituert med en hydroksy-gruppe, en C₁-C₆ alkoksy-gruppe, eller en karboksyl-gruppe) og en hydroksy-gruppe; en C₁-C₆ alkylsulfonylaminokarbonyl-gruppe; en alifatisk heterosyklisk karbonyl-gruppe eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe (hvor den alifatiske heterosykliske ringen er en gruppe valgt fra gruppen
25 bestående av en azetidinyll-gruppe, en pyrrolidinyl-gruppe, en imidazolinyll-gruppe, en tiazolidinyll-gruppe, en isotiazolidinyll-gruppe, en piperidinyl-gruppe, en piperazinyl-gruppe, en morfolinyll-gruppe, en tiomorfolinyll-gruppe, en homopiperazinyl-gruppe, og en homomorfolinyll-gruppe); en amino-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen
30 bestående av en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ alkanoyl-gruppe, og en C₁-C₆ alkylsulfonyll-gruppe; en alifatisk heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med én eller to okso-gruppe(r) (hvor den alifatiske heterosykliske gruppen er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en azetidinyll-gruppe, en pyrrolidinyl-gruppe, en tetrahydrofuranlyll-gruppe, en imidazolinyll-gruppe, en tiazolidinyll-gruppe, en isotiazolidinyll-gruppe, en piperidinyl-gruppe, en piperazinyl-gruppe, en morfolinyll-gruppe, en tiomorfolinyll-gruppe, en tetrahydropyranlyll-gruppe, en homopiperazinyl-gruppe, og en homomorfolinyll-gruppe); en C₁-C₆ alkylsulfonyll-gruppe; en heteroaryl-gruppe (hvor heteroaryl-gruppen er en gruppe valgt fra

gruppen bestående av en pyrrolyl-gruppe, en furanyl-gruppe, en tienyl-gruppe, en imidazolyl-gruppe, en pyrazolyl-gruppe, en oksazolyl-gruppe, en isoksazolyl-gruppe, en tiazolyl-gruppe, en tetrazolyl-gruppe, en oksadiazolyl-gruppe, en pyridinyl-gruppe, en pyrazinyl-gruppe, en pyrimidinyl-gruppe, en pyridazinyl-gruppe, en tiazinyl-gruppe, og en triazinyl-gruppe); og an aminosulfonyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r)

(hvor den alifatiske heterosykliske gruppen er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en azetidinyll-gruppe, en pyrrolidinyl-gruppe, en tetrahydrofuranyl-gruppe, en imidazolinyl-gruppe, en tiazolidinyl-gruppe, en isotiazolidinyl-gruppe, en piperidinyl-gruppe, en piperazinyl-gruppe, en morfolinyl-gruppe, en tiomorfolinyl-gruppe, en tetrahydropyranyl-gruppe, en homopiperazinyl-gruppe, en homomorfolinyl-gruppe, en 3-azabisyklo-[3.1.0]-heksyl-gruppe, og en oktahydropyrrolo-[3,4-c]-pyrrolyl-gruppe),

(8) en C₁-C₆ alkoksy-gruppe eventuelt substituert med en gruppe valgt fra gruppen bestående av en cyano-gruppe; en karboksyl-gruppe; en heteroaryl-gruppe eventuelt substituert med en hydroksy-gruppe eller en okso-gruppe (hvor heteroaryl-gruppen er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en pyrrolyl-gruppe, en furanyl-gruppe, en tienyl-gruppe, en imidazolyl-gruppe, en pyrazolyl-gruppe, en oksazolyl-gruppe, en isoksazolyl-gruppe, en tiazolyl-gruppe, en tetrazolyl-gruppe, en oksadiazolyl-gruppe, en pyridinyl-gruppe, en pyrazinyl-gruppe, en pyrimidinyl-gruppe, en pyridazinyl-gruppe, en tiazinyl-gruppe, og en triazinyl-gruppe); en aminosulfonylaminokarbonyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r); og en C₁-C₆ alkylsulfonylaminokarbonyl-gruppe,

(9) en amino-gruppe som eventuelt er substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r) eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe, eller

(10) en karbamoyl-gruppe; og

R⁸ og R⁹ er hver uavhengig en gruppe valgt fra gruppen bestående av et hydrogenatom, et halogenatom, en cyano-gruppe, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), og en C₁-C₆ haloalkoksy-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er).

5. Forbindelsen eller farmasøytisk akseptabelt salt derav i henhold til et hvilket som helst av kravene 1 til 4, hvor

ring A er en fenyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppes uavhengig valgt fra gruppen bestående av et halogenatom, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ halogenalkyl-

gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), en C₃-C₇ sykloalkyl-gruppe, en C₁-C₆ alkoksy-gruppe, en C₁-C₆ haloalkoksy-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), og en C₁-C₆ alkyleneoksy-gruppe, R¹ er

(1) en C₁-C₆ alkyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et halogenatom; en hydroksy-gruppe; en 3- til 7-leddet monosyklisk sykloalkyl-gruppe; en C₁-C₆ alkoksy-gruppe; en tetrahydropyranyl-gruppe; en alifatisk heterosyklisk karbonyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et halogenatom, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), og en C₁-C₆ alkoksyalalkyl-gruppe (hvor den alifatiske heterosykliske ringen er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en pyrrolidinyl-gruppe, en piperidinyl-gruppe, og en morfolinyl-gruppe); en pyrrolidinylsulfonyl-gruppe; og en karbamoyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r),

(2) en 3- til 7-leddet monosyklisk sykloalkyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et halogenatom, en hydroksy-gruppe, en okso-gruppe, en cyano-gruppe, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ alkoksy-gruppe, en C₁-C₆ alkoksyalalkyl-gruppe, og en C₁-C₆ alkyleneoksy-gruppe,

(3) en adamantyl-gruppe eventuelt substituert med en hydroksy-gruppe,

(4) en alifatisk heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med en gruppe valgt fra gruppen bestående av en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ hydroksyalalkyl-gruppe, en C₁-C₆ halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), en C₁-C₆ alkanoyl-gruppe, og en C₁-C₆ alkylsulfonyl-gruppe

(hvor den alifatiske heterosykliske gruppen er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en tetrahydrofuranlyl-gruppe, en tetrahydropyranyl-gruppe, og en piperidinyl-gruppe),

(5) en indanyl-gruppe,

(6) en heteroaryl-gruppe som eventuelt er substituert med en gruppe valgt fra gruppen bestående av en cyano-gruppe, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ alkoksy-gruppe, og en karbamoyl-gruppe

(hvor heteroaryl-gruppen er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en pyridazinyl-gruppe, en pyridinyl-gruppe, og en pyrimidinyl-gruppe),

(7) en karbamoyl-gruppe, eller

(8) en mono-alkylkarbamoyl-gruppe;

R² er en halogen atom, a C₁₋₃ alkyl-gruppe, eller en C₁-C₆ alkoksy-gruppe;

R³ og R⁴ er terminalt bundet til hverandre, og sammen med nitrogenatomet til hvilket de er bundet, danner en gruppe representert med formel [II],

hvor ring B er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en azetidinyll-gruppe, en tetrahydropyridinyl-gruppe, en piperazinyl-gruppe, en homopiperazinyl-gruppe, og en
5 oktahydropyrrolo-[3,4-c]-pyrrolyl-gruppe, og både R⁵ og R⁶ representerer hydrogen-atomer, eller

ring B er en piperidinyl-gruppe, og R⁵ og R⁶ er hver en gruppe uavhengig valgt fra gruppen bestående av et hydrogenatom, en cyano-gruppe, og en C₁-C₆ alkoksyalkyl-gruppe, eller

10 ring B er en pyrrolidinyl-gruppe, og R⁵ og R⁶ er hver en gruppe uavhengig valgt fra gruppen bestående av et hydrogenatom, et halogenatom, en cyano-gruppe, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), en C₁-C₆ cyanoalkyl-gruppe, en C₁-C₆ hydroksyalkyl-gruppe, en C₁-C₆ alkoksyalkyl-gruppe, en karboksyl-gruppe, karbamoyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to
15 C₁-C₆ alkyl-gruppe(r), og en C₁-C₆ alkoksy-gruppe;

ring C er en fenyl-gruppe eller en pyridinyl-gruppe;

R⁷ er

(1) en C₁-C₆ alkyl-gruppe eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe,

(2) en C₂-C₆ alkenyl-gruppe eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe,

20 (3) en 3- til 7-leddet monosyklisk sykloalkyl-gruppe eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe,

(4) en 3- til 7-leddet monosyklisk sykloalkenyl-gruppe eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe,

(5) en fenyl-gruppe eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe,

25 (6) en heteroaryl-gruppe som eventuelt er substituert med en karboksyl-gruppe eller en C₁-C₆ alkyl-gruppe eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe (hvor heteroaryl-gruppen er en gruppe valgt fra gruppen bestående av an oksazolyl-gruppe og en pyrazolyl-gruppe),

30 (7) en alifatisk heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av en hydroksy-gruppe; en okso-gruppe; en cyano-gruppe; en C₁-C₆ alkyl-gruppe eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe; en C₁-C₆ alkoksy-gruppe; en C₁-C₆ alkanoyl-gruppe; en karboksyl-gruppe; en C₁-C₆ alkoksykarbonyl-gruppe; en karbamoyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen
35 bestående av en C₁-C₆ alkyl-gruppe (C₁-C₆ alkyl-gruppen er eventuelt substituert

med en hydroksy-gruppe, en C₁-C₆ alkoksy-gruppe, eller en karboksyl-gruppe) og en hydroksy-gruppe; en C₁-C₆ alkylsulfonylaminokarbonyl-gruppe; en pyrrolidinyl-karbonyl-gruppe eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe; en amino-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen

5 bestående av en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ alkanoyl-gruppe, og en C₁-C₆ alkylsulfonyl-gruppe; en pyrrolidinyl-gruppe og en isotiazolidinyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to okso-gruppe(r); en C₁-C₆ alkylsulfonyl-gruppe; en tetrazolyl-gruppe; og en aminosulfonyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r)

10 (hvor den alifatiske heterosykliske gruppen er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en azetidinyll-gruppe, en pyrrolidinyl-gruppe, en piperidinyl-gruppe, en morfolinyl-gruppe, en tiomorfolinyl-gruppe, en piperazinyl-gruppe, og en 3-azabisyklo-[3.1.0]heksyl-gruppe),

(8) en C₁-C₆ alkoksy-gruppe eventuelt substituert med en gruppe valgt fra

15 gruppen bestående av en cyano-gruppe; en karboksyl-gruppe; en heteroaryl-gruppe eventuelt substituert med en hydroksy-gruppe eller en okso-gruppe (hvor heteroaryl-gruppen er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en isoksazolyl-gruppe, en oksadiazolyl-gruppe, og en tetrazolyl-gruppe); en aminosulfonylaminokarbonyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r);

20 og en C₁-C₆ alkylsulfonylaminokarbonyl-gruppe,

(9) en amino-gruppe som eventuelt er substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r) eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe, eller

(10) en karbamoyl-gruppe; og

R⁸ og R⁹ er hver uavhengig en gruppe valgt fra gruppen bestående av et hydrogenatom,

25 et halogenatom, en cyano-gruppe, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), og en C₁-C₆ haloalkoksy-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er).

6. Forbindelsen eller farmasøytisk akseptabelt salt derav i henhold til et hvilket som

30 helst av kravene 1 til 5, hvor R¹ er

(1) en 3- til 7-leddet monosyklisk sykloalkyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et halogenatom, en hydroksy-gruppe, en okso-gruppe, en cyano-gruppe, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ alkoksy-gruppe, en C₁-C₆ alkoksyalkyl-gruppe, og en C₁-C₆ alkyleneoksy-gruppe;

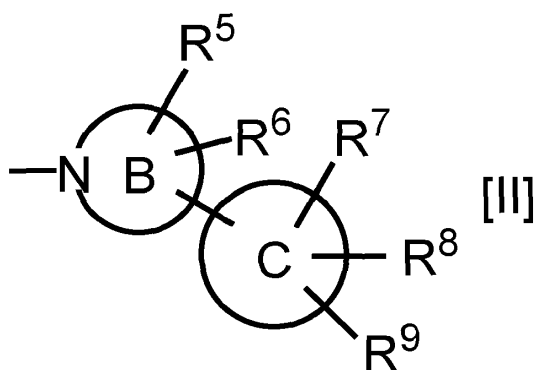
35 (2) en adamantyl-gruppe eventuelt substituert med en hydroksy-gruppe; or

(3) en alifatisk heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med en gruppe valgt fra gruppen bestående av en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ hydroksyalkyl-gruppe, en C₁-C₆ halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), en C₁-C₆ alkanoyl-gruppe, og en C₁-C₆ alkylsulfonyl-gruppe

- 5 (hvor den alifatiske heterosykliske gruppen er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en tetrahydrofuranyl-gruppe, en tetrahydropyranyl-gruppe, og en piperidinyI-gruppe).

7. Forbindelsen eller farmasøytisk akseptabelt salt derav i henhold til et hvilket som helst av kravene 1 til 6, hvor

- 10 R³ og R⁴ er terminalt bundet til hverandre, og sammen med nitrogenatomet til hvilket de er bundet, danner en gruppe representert med formel [II]



- 15 hvor ring B er en pyrrolidinyI-gruppe.

8. Forbindelsen eller farmasøytisk akseptabelt salt derav i henhold til et hvilket som helst av kravene 1 til 7, hvor

- R¹ er en 3- til 7-leddet monosyklisk sykloalkyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et halogenatom, en hydroksy-
 20 gruppe, en okso-gruppe, en cyano-gruppe, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ alkoksy-gruppe, en C₁-C₆ alkoksyalkyl-gruppe, og en C₁-C₆ alkylenoksy-gruppe.

9. Forbindelsen eller farmasøytisk akseptabelt salt derav i henhold til et hvilket som helst av kravene 1 til 8, hvor

- 25 ring A er en fenyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et halogenatom, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), en C₃-C₇ sykloalkyl-gruppe, en C₁-C₆

alkoksy-gruppe, en C₁-C₆ haloalkoksy-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), og en C₁-C₆ alkyleneoksy-gruppe;

5 R¹ er en 3- til 7-leddet monosyklisk sykloalkyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et halogenatom, en hydroksy-gruppe, en okso-gruppe, en cyano-gruppe, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ alkoksy-gruppe, en C₁-C₆ alkoksyalkyl-gruppe, og en C₁-C₆ alkyleneoksy-gruppe;

R² er et halogenatom eller en C₁-C₆ alkoksy-gruppe;

R³ og R⁴ er terminalt bundet til hverandre, og sammen med nitrogenometet til hvilket de er bundet, danner en gruppe representert med formel [II],

10 hvor ring B er en pyrrolidinyll-gruppe, og R⁵ og R⁶ er hver en gruppe uavhengig valgt fra gruppen bestående av et hydrogenatom, et halogenatom, en cyano-gruppe, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), en C₁-C₆ cyanoalkyl-gruppe, en C₁-C₆ hydroksyalkyl-gruppe, en C₁-C₆ alkoksyalkyl-gruppe, en karboksyl-gruppe, en karbamoyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to
15 C₁-C₆ alkyl-gruppe(r), og en C₁-C₆ alkoksy-gruppe;

ring C er en fenyl-gruppe;

R⁷ er

(1) en C₁-C₆ alkyl-gruppe eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe,

(2) en C₂-C₆ alkenyl-gruppe eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe,

20 (3) en 3- til 7-leddet monosyklisk sykloalkyl-gruppe eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe,

(4) en 3- til 7-leddet monosyklisk sykloalkenyl-gruppe eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe,

(5) en fenyl-gruppe eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe,

25 (6) en heteroaryl-gruppe som eventuelt er substituert med en karboksyl-gruppe eller en C₁-C₆ alkyl-gruppe eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe (hvor heteroaryl-gruppen er en gruppe valgt fra gruppen bestående av an oksazolyl-gruppe og en pyrazolyl-gruppe),

30 (7) an alifatisk heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av en hydroksy-gruppe; en okso-gruppe; en cyano-gruppe; en C₁-C₆ alkyl-gruppe eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe; en C₁-C₆ alkoksy-gruppe; en C₁-C₆ alkanoyl-gruppe; en karboksyl-gruppe; en C₁-C₆ alkoksykarbonyl-gruppe; en karbamoyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen
35 bestående av en C₁-C₆ alkyl-gruppe (C₁-C₆ alkyl-gruppen er eventuelt substituert

med en hydroksy-gruppe, en C₁-C₆ alkoksy-gruppe, eller en karboksyl-gruppe) og en hydroksy-gruppe; en C₁-C₆ alkylsulfonylaminokarbonyl-gruppe; en pyrrolidinyllkarbonyl-gruppe eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe; en amino-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ alkanoyl-gruppe, og en C₁-C₆ alkylsulfonyl-gruppe; en alifatisk heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med én eller to okso-gruppe(r) (hvor den alifatiske heterosykliske gruppen er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en pyrrolidinyll-gruppe og en isotiazolidinyll-gruppe); en C₁-C₆ alkylsulfonyl-gruppe; en tetrazolyll-gruppe; og en aminosulfonyll-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r)

(hvor den alifatiske heterosykliske gruppen er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en azetidinyll-gruppe, en pyrrolidinyll-gruppe, en piperidinyll-gruppe, en morfolinyll-gruppe, en tiomorfolinyll-gruppe, en piperazinyll-gruppe, og en 3-azabisyklo-[3.1.0]-heksyl-gruppe),

(8) en C₁-C₆ alkoksy-gruppe eventuelt substituert med en gruppe valgt fra gruppen bestående av en cyano-gruppe; en karboksyl-gruppe; en heteroaryl-gruppe eventuelt substituert med en hydroksy-gruppe eller en okso-gruppe (hvor heteroaryl-gruppen er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en isoksazolyll-gruppe, en oksadiazolyll-gruppe, og en tetrazolyll-gruppe); en aminosulfonyll-aminokarbonyll-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r); og en C₁-C₆ alkylsulfonylaminokarbonyll-gruppe,

(9) en amino-gruppe som eventuelt er substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r) eventuelt substituert med en karboksyl-gruppe, eller

(10) en karbamoyll-gruppe; og

R⁸ og R⁹ er hver uavhengig en gruppe valgt fra gruppen bestående av et hydrogenatom, et halogenatom, en cyano-gruppe, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), og en C₁-C₆ haloalkoksy-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er).

10. Forbindelsen eller farmasøytisk akseptabelt salt derav i henhold til krav 9, hvor ring A er en fenyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et halogenatom, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ halogenalkylgruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), en C₃-C₇ sykloalkyl-gruppe, en C₁-C₆ alkoksy-gruppe, en C₁-C₆ haloalkoksy-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), og en C₁-C₆ alkylenoksy-gruppe;

R¹ er en 3- til 7-leddet monosyklisk sykloalkyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av et halogenatom, en hydroksy-gruppe, en okso-gruppe, en cyano-gruppe, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ alkoksy-gruppe, en C₁-C₆ alkoksyalkyl-gruppe, og en C₁-C₆ alkylenoksy-gruppe;

5 R² er et halogenatom eller en C₁-C₆ alkoksy-gruppe;

R³ og R⁴ er terminalt bundet til hverandre, og sammen med nitrogenatomet til hvilket de er bundet, danner en gruppe representert med formel [II],

hvor ring B er en pyrrolidinyll-gruppe, og

10 R⁵ og R⁶ er hver en gruppe uavhengig valgt fra gruppen bestående av et hydrogenatom, et halogenatom, en cyano-gruppe, en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), en C₁-C₆ cyanoalkyl-gruppe, en C₁-C₆ hydroksyalkyl-gruppe, en C₁-C₆ alkoksyalkyl-gruppe, en karboksylgruppe, en karbamoyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r), og en C₁-C₆ alkoksy-gruppe;

15 ring C er en fenyl-gruppe;

R⁷ er en alifatisk heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av en hydroksy-gruppe; en okso-gruppe; en cyano-gruppe; en C₁-C₆ alkyl-gruppe eventuelt substituert med en karboksylgruppe; en C₁-C₆ alkoksy-gruppe; en C₁-C₆ alkanoyl-gruppe; en karboksylgruppe; en C₁-C₆ alkoksy-
20 karbonyl-gruppe; en karbamoyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av en C₁-C₆ alkyl-gruppe (C₁-C₆ alkyl-gruppen er eventuelt substituert med en hydroksy-gruppe, en C₁-C₆ alkoksy-gruppe, eller en karboksyl-gruppe) og en hydroksy-gruppe; en C₁-C₆ alkylsulfonylaminokarbonyl-gruppe; en pyrrolidinyllkarbonyl-gruppe eventuelt substituert med en karboksylgruppe; en amino-
25 gruppe eventuelt substituert med én eller to gruppe(r) uavhengig valgt fra gruppen bestående av en C₁-C₆ alkyl-gruppe, en C₁-C₆ alkanoyl-gruppe, og en C₁-C₆ alkylsulfonyl-gruppe; en alifatisk heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med én eller to okso-gruppe(r) (hvor den alifatiske heterosykliske gruppen er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en pyrrolidinyll-gruppe og en isotiazolidinyll-gruppe); en C₁-C₆ alkylsulfonyl-
30 gruppe; en tetrazolyl-gruppe; og en aminosulfonyl-gruppe eventuelt substituert med én eller to C₁-C₆ alkyl-gruppe(r)

(hvor den alifatiske heterosykliske gruppen er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en azetidinyll-gruppe, en pyrrolidinyll-gruppe, en piperidinyll-gruppe, en morfolinyll-gruppe, en tiomorfolinyll-gruppe, en piperazinyll-gruppe, og en 3-azabisyklo-[3.1.0]-heksyl-
35 gruppe); og

R^8 og R^9 er hver uavhengig en gruppe valgt fra gruppen bestående av et hydrogenatom, et halogenatom, en cyano-gruppe, en C_1 - C_6 alkyl-gruppe, en C_1 - C_6 halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er), og en C_1 - C_6 haloalkoksy-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er).

5

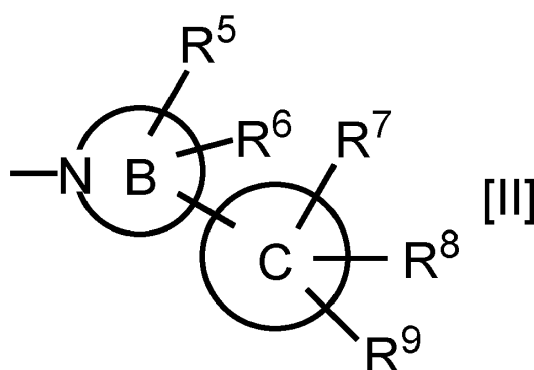
11. Forbindelsen eller farmasøytisk akseptabelt salt derav i henhold til et hvilket som helst av kravene 1 til 6, hvor

ring A er en fenyl-gruppe eventuelt substituert med en C_1 - C_6 alkoksy-gruppe;

R^1 er en C_1 - C_6 alkyl-gruppe; en tetrahydrofuranyl-gruppe, en tetrahydropyranyl-gruppe, og en piperidinyll-gruppe; en 3- til 7-leddet monosyklisk sykloalkyl-gruppe eventuelt substituert med en gruppe valgt fra gruppen bestående av en C_1 - C_6 alkoksy-gruppe og en cyano-gruppe; eller en heteroaryl-gruppe eventuelt substituert med en C_1 - C_6 alkyl-gruppe (hvor heteroaryl-gruppen er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en pyridazinyll-gruppe, en pyridinyll-gruppe, og en pyrimidinyll-gruppe);

R^2 er et halogenatom eller en C_1 - C_6 alkoksy-gruppe;

R^3 og R^4 er terminalt bundet til hverandre, og sammen med nitrogenomet til hvilket de er bundet, danner en gruppe representert med formel [II]:



20

hvor ring B er valgt fra gruppen bestående av en azetidinyll-gruppe, en pyrrolidinyll-gruppe, en piperidinyll-gruppe, en tetrahydropyridinyll-gruppe, og en piperazinyll-gruppe, og R^5 og R^6 er hydrogen atoms, eller

ring B er en pyrrolidinyll-gruppe, R^5 er en C_1 - C_6 alkoksyalkyl-gruppe, og R^6 er et hydrogenatom eller et halogenatom;

ring C er en fenyl-gruppe;

R^7 er en alifatisk heterosyklisk gruppe substituert med en karboksylgruppe (hvor den alifatiske heterosykliske gruppen er en gruppe valgt fra gruppen bestående av en

25

azetidinyl-gruppe, en pyrrolidinyl-gruppe, en piperidinyl-gruppe, en morfolinyl-gruppe, en tiomorfolinyl-gruppe, en piperazinyl-gruppe, og en 3-azabisyklo-[3.1.0]-heksyl-gruppe);

R⁸ er et halogenatom eller en C₁-C₆ halogenalkylgruppe substituert med ett til tre halogenatom(er); og

5 R⁹ er et hydrogenatom.

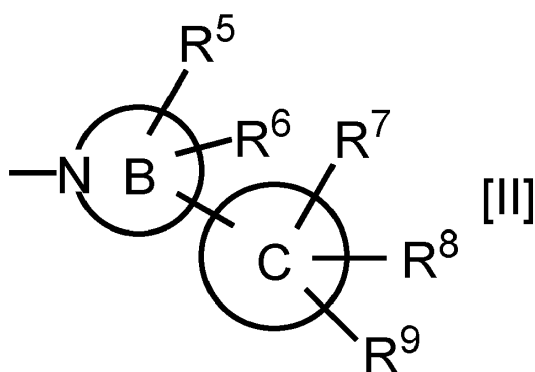
12. Forbindelsen eller farmasøytisk akseptabelt salt derav i henhold til krav 11, hvor ring A er en fenyl-gruppe eventuelt substituert med en C₁-C₆ alkoksy-gruppe;

10 R¹ er en tetrahydropyranyl-gruppe; eller en 5- eller 6-leddet monosyklisk sykloalkyl-gruppe eventuelt substituert med en gruppe valgt fra gruppen bestående av en C₁-C₆ alkoksy-gruppe og en cyano-gruppe;

R² er et halogenatom eller en C₁-C₆ alkoksy-gruppe;

R³ og R⁴ er terminalt bundet til hverandre, og sammen med nitrogenatomet til hvilket de er bundet, danner en gruppe representert med formel [II]:

15



hvor ring B er en pyrrolidinyl-gruppe, R⁵ er en C₁-C₆ alkoksyalkyl-gruppe, og R⁶ er et hydrogenatom eller et halogenatom;

20 ring C er en fenyl-gruppe;

R⁷ er en piperidinyl-gruppe substituert med en karboksylgruppe;

R⁸ er et halogenatom eller en C₁-C₆ halogenalkylgruppe substituert med ett til tre halogenatom(er); og

R⁹ er et hydrogenatom.

25

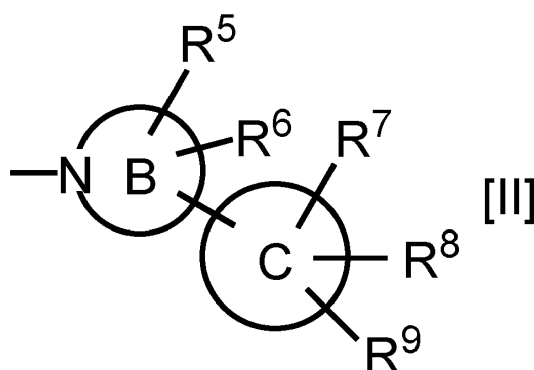
13. Forbindelsen eller farmasøytisk akseptabelt salt derav i henhold til krav 12, hvor

ring A er en fenyl-gruppe eventuelt substituert med en C₁-C₆ alkoksy-gruppe;

R¹ er en 5- eller 6-leddet monosyklisk sykloalkyl-gruppe eventuelt substituert med en gruppe valgt fra gruppen bestående av en C₁-C₆ alkoksy-gruppe og en cyano-gruppe;

R² er et halogenatom eller en C₁-C₆ alkoksy-gruppe;

- 5 R³ og R⁴ er terminalt bundet til hverandre, og sammen med nitrogenatomet til hvilket de er bundet, danner en gruppe representert med formel [II]:



- 10 hvor ring B er en pyrrolidinyI-gruppe, R⁵ er en C₁-C₆ alkoksyalkyl-gruppe, og R⁶ er et hydrogenatom eller et halogenatom;

ring C er en fenyl-gruppe;

R⁷ er en piperidinyI-gruppe substituert med en karboksyl-gruppe;

- 15 R⁸ er et halogenatom eller en C₁-C₆ halogenalkyl-gruppe substituert med ett til tre halogenatom(er); og

R⁹ er et hydrogenatom.

14. En forbindelse i henhold til krav 1 valgt fra gruppen bestående av:

- 20 1-{2-[(3S,5S)-1-{[(3R,4R)-1-(*trans*-4-etoksysykloheksyl)-3-metoksy-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-5-(etoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylsyre;

1-{2-[(3S,5S)-1-{[(3R,4R)-3-fluor-4-(4-metoksyfenyl)-1-(2-metylpyridin-4-yl)-pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-5-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)-fenyl}piperidin-4-karboksylsyre;

- 25 1-{2-[(3S,5S)-1-{[(3R,4R)-3-fluor-4-(4-metoksyfenyl)-1-(2-metylpyrimidin-4-yl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-5-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)-fenyl}piperidin-4-karboksylsyre;

1-{5-fluor-2-[(3S,5S)-1-{[(3R,4R)-3-fluor-1-(*trans*-4-metoksyykloheksyl)-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-5-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]fenyl}-piperidin-4-karboksylysyre;

1-{2-[(3S,5S)-1-{[(3R,4R)-1-(*trans*-4-etoksyykloheksyl)-3-metoksy-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-5-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylysyre;

1-{2-[(3S,5S)-1-{[(3R,4R)-1-(*trans*-4-cyanosykloheksyl)-3-fluor-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-5-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylysyre;

1-{2-[(3S,4S)-1-{[(3R,4R)-1-(*trans*-4-etoksyykloheksyl)-3-metoksy-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-4-fluor-4-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylysyre;

1-{2-[(3S,4R)-1-{[(3R,4R)-1-(*trans*-4-etoksyykloheksyl)-3-metoksy-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-4-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylysyre;

1-{2-[(3S,5S)-1-{[(3R,4R)-1-sykloheksyl-3-fluor-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-5-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylysyre;

1-{2-[(3S,5S)-1-{[(3R,4R)-3-fluor-4-(4-metoksyfenyl)-1-(tetrahydro-2H-pyran-4-yl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-5-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylysyre;

1-{2-[(3S,5S)-1-{[(3R,4R)-3-fluor-1-(*trans*-4-metoksyykloheksyl)-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-5-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylysyre;

1-{2-[(3S,5S)-1-{[(3R,4R)-1-syklopentyl-3-fluor-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-5-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylysyre;

1-{2-[(3S,4R)-1-{[(3R,4R)-3-fluor-4-(4-metoksyfenyl)-1-(2-metylpyridin-4-yl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-4-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylysyre;

1-{2-[(3S,4S)-4-fluor-1-{[(3R,4R)-3-fluor-1-(*trans*-4-metoksyykloheksyl)-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-4-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylysyre;

1-{5-klor-2-[(3S,4R)-1-{[(3R,4R)-3-fluor-1-(*trans*-4-metoksisykloheksyl)-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-4-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]fenyl}-piperidin-4-karboksylsyre;

1-{2-[(3S,4R)-4-(cyanometyl)-1-{[(3R,4R)-1-syklopentyl-3-fluor-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylsyre;

1-{2-[(3S,4R)-1-{[(3R,4R)-3-fluor-1-(*trans*-4-metoksisykloheksyl)-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-4-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylsyre;

1-[2-(1-{[(3R,4R)-3-fluor-1-(*trans*-4-metoksisykloheksyl)-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}piperidin-4-yl)-5-(trifluormetyl)fenyl]piperidin-4-karboksylsyre;

1-{2-[(3S,4R)-1-{[(3R,4R)-1-syklopentyl-3-fluor-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-4-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylsyre; og

1-{2-[(3S)-1-{[(3R,4R)-3-fluor-1-(*trans*-4-metoksisykloheksyl)-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylsyre;

eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

15. En forbindelse i henhold til krav 14 valgt fra gruppen bestående av:

1-{2-[(3S,5S)-1-{[(3R,4R)-1-(*trans*-4-etoksisykloheksyl)-3-metoksy-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-5-(etoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylsyre;

1-{5-fluor-2-[(3S,5S)-1-{[(3R,4R)-3-fluor-1-(*trans*-4-metoksisykloheksyl)-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-5-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]fenyl}-piperidin-4-karboksylsyre;

1-{2-[(3S,5S)-1-{[(3R,4R)-1-(*trans*-4-etoksisykloheksyl)-3-metoksy-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-5-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylsyre;

1-{2-[(3S,5S)-1-{[(3R,4R)-1-(*trans*-4-cyanosykloheksyl)-3-fluor-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-5-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylsyre;

1-{2-[(3S,4S)-1-{[(3R,4R)-1-(*trans*-4-etoksisykloheksyl)-3-metoksy-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-4-fluor-4-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylsyre;

1-{2-[(3S,4R)-1-{[(3R,4R)-1-(*trans*-4-etoksisykloheksyl)-3-metoksy-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-4-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylsyre;

1-{2-[(3S,5S)-1-{[(3R,4R)-1-sykloheksyl-3-fluor-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-5-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylsyre;

1-{2-[(3S,5S)-1-{[(3R,4R)-3-fluor-1-(*trans*-4-metoksisykloheksyl)-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-5-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylsyre;

1-{2-[(3S,5S)-1-{[(3R,4R)-1-syklopentyl-3-fluor-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-5-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylsyre;

1-{2-[(3S,4S)-4-fluor-1-{[(3R,4R)-3-fluor-1-(*trans*-4-metoksisykloheksyl)-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-4-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylsyre;

1-{5-klor-2-[(3S,4R)-1-{[(3R,4R)-3-fluor-1-(*trans*-4-metoksisykloheksyl)-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-4-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]fenyl}piperidin-4-karboksylsyre;

1-{2-[(3S,4R)-4-(cyanometyl)-1-{[(3R,4R)-1-syklopentyl-3-fluor-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylsyre;

1-{2-[(3S,4R)-1-{[(3R,4R)-3-fluor-1-(*trans*-4-metoksisykloheksyl)-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-4-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylsyre;

1-[2-(1-{[(3R,4R)-3-fluor-1-(*trans*-4-metoksisykloheksyl)-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}piperidin-4-yl)-5-(trifluormetyl)fenyl]piperidin-4-karboksylsyre;

1-{2-[(3S,4R)-1-{[(3R,4R)-1-syklopentyl-3-fluor-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-4-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylsyre; og

1-{2-[(3S)-1-{[(3R,4R)-3-fluor-1-(*trans*-4-metoksisykloheksyl)-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylsyre;

eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

5

16. En forbindelse i henhold til krav 15 valgt fra gruppen bestående av:

1-{5-fluor-2-[(3S,5S)-1-{[(3R,4R)-3-fluor-1-(*trans*-4-metoksisykloheksyl)-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-5-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-fenyl}-piperidin-4-karboksylsyre;

10

1-{2-[(3S,5S)-1-{[(3R,4R)-1-(*trans*-4-etoksisykloheksyl)-3-metoksy-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-5-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylsyre;

1-{2-[(3S,5S)-1-{[(3R,4R)-3-fluor-1-(*trans*-4-metoksisykloheksyl)-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-5-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylsyre;

15

1-{2-[(3S,5S)-1-{[(3R,4R)-1-syklopentyl-3-fluor-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]-karbonyl}-5-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylsyre;

1-{2-[(3S,4S)-4-fluor-1-{[(3R,4R)-3-fluor-1-(*trans*-4-metoksisykloheksyl)-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-4-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylsyre;

20

1-{5-klor-2-[(3S,4R)-1-{[(3R,4R)-3-fluor-1-(*trans*-4-metoksisykloheksyl)-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-4-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]fenyl}-piperidin-4-karboksylsyre;

1-{2-[(3S,4R)-1-{[(3R,4R)-3-fluor-1-(*trans*-4-metoksisykloheksyl)-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-4-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylsyre; og

25

1-{2-[(3S,4R)-1-{[(3R,4R)-1-syklopentyl-3-fluor-4-(4-metoksyfenyl)pyrrolidin-3-yl]karbonyl}-4-(metoksymetyl)pyrrolidin-3-yl]-5-(trifluormetyl)fenyl}piperidin-4-karboksylsyre;

30

eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

17. En farmasøytisk sammensetning som omfatter, som en aktiv ingrediens, forbindelsen i henhold til et hvilket som helst av kravene 1 til 16 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

35

18. Den farmasøytiske sammensetningen i henhold til krav 17 for anvendelse i forebyggelsen eller terapien av revmatoid artritt, urinsyregikt, slitasjegikt, inflammatorisk tarmsykdom, systemisk sklerose, psoriasis, fibrose, protoporfyri, systemisk lupus erythematosus, melanom, hudkreft, vitiligo, hårtap, smerte, iskemi/reperfusjonskade, cerebral inflammatorisk sykdom, hepatitt, septikemi/septisk sjokk, nefritt, transplantasjon, HIV-sykdomsforverring, vaskulitt, uveitt, retinitis pigmentosa, aldersrelatert makuladegenerasjon, mikrobiell infeksjon, cøliaki, nefrotisk syndrom, eller melanom-invasjon.

10

19. Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse i henhold til krav 18 for forebyggelsen eller behandlingen av systemisk sklerose, psoriasis, protoporfyri, melanom, hudkreft, vitiligo, hårtap, nefrotisk syndrom, retinitis pigmentosa, eller aldersrelatert makuladegenerasjon.

15

20. Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse i henhold til krav 19 for forebyggelsen eller behandlingen av systemisk sklerose, protoporfyri, melanom, vitiligo, nefrotisk syndrom, retinitis pigmentosa, eller aldersrelatert makuladegenerasjon.

20

21. Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse i henhold til krav 20, hvor protoporfyrien er erytropoietisk protoporfyri.