(12) **Translation of European patent specification**

(11) **NO/EP 3160948 B1**

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

C07D 265/36 (2006.01)
A61K 31/538 (2006.01)
A61P 9/12 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2019.04.01
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.10.24
(86)	European Application Nr.	15736015.7
(86)	European Filing Date	2015.06.26
(87)	The European Application's Publication Date	2017.05.03
(30)	Priority	2014.06.30, US, 201462018790 P
(84)	Designated Contracting States:	AL ; AT ; BE ; BG ; CH ; CY ; CZ ; DE ; DK ; EE ; ES ; FI ; FR ; GB ; GR ; HR ; HU ; IE ; IS ; IT ; LI ; LT ; LU ; LV ; MC ; MK ; MT ; NL ; NO ; PL ; PT ; RO ; RS ; SE ; SI ; SK ; SM ; TR
	Designated Extension States:	BA ME
(73)	Proprietor	Astrazeneca AB, 151 85 Södertälje, Sverige
(72)	Inventor	O'MAHONY, Gavin, AstraZenecaR&D Mölndal, SE-431 83 Mölndal, Sverige KOSSENJANS, Michael, AstraZenecaR&D Mölndal, SE-431 83 Mölndal, Sverige EDMAN, Karl, AstraZenecaR&D Mölndal, SE-431 83 Mölndal, Sverige KAJANUS, Johan, AstraZenecaR&D Mölndal, SE-431 83 Mölndal, Sverige HOGNER, Carl Anders, AstraZenecaR&D Mölndal, SE-431 83 Mölndal, Sverige CORNWALL, Philip, AstraZenecaCharter Way, MacclesfieldCheshire SK10 2NA, Storbritannia TURNER, Andrew, AstraZenecaCharter Way, MacclesfieldCheshire SK10 2NA, Storbritannia
(74)	Agent or Attorney	TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

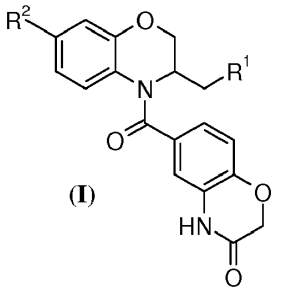
(54) Title **BENZOXAZINONE AMIDES AS MINERALOCORTICOID RECEPTOR MODULATORS**

(56) References Cited:

HASUI TOMOAKI ET AL: "Design, synthesis, and structure-activity relationships of dihydrofuran-2-one and dihydropyrrol-2-one derivatives as novel benzoxazin-3-one-based mineralocorticoid receptor antagon", BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY, vol. 21, no. 19, 31 July 2013 (2013-07-31) , pages 5983-5994, XP028706278, ISSN: 0968-0896, DOI: 10.1016/J.BMC.2013.07.043, WO-A2-2006/015259

Patentkrav

1. Forbindelse med formel (I)



(I)

hvori

R¹ er valgt fra $CONH_2$ eller $CONHCH_3$; og

R² er valgt fra H, F, Cl eller Br;

eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

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

R¹ er $CONHCH_3$; og

R² er valgt fra H, F, Cl eller Br.

3. Forbindelse ifølge krav 1 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori

R¹ er $CONHCH_3$; og

R² er F.

4. Forbindelse ifølge krav 1, som er valgt fra

2-{4-[(3-okso-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-6-yl)karbonyl]-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-3-yl}acetamid;

N-metyl-2-{4-[(3-okso-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-6-yl)karbonyl]-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-3-yl}acetamid;

N-metyl-2-{(3*S*)-4-[(3-okso-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-6-yl)karbonyl]-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-3-yl}acetamid;

N-metyl-2-{(3*R*)-4-[(3-okso-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-6-yl)karbonyl]-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-3-yl}acetamid;

2-{7-fluor-4-[(3-okso-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-6-yl)karbonyl]-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-3-yl}acetamid;

2-{(3*S*)-7-fluor-4-[(3-okso-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-6-yl)karbonyl]-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-3-yl}acetamid;

2-{(3*R*)-7-fluor-4-[(3-okso-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-6-yl)karbonyl]-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-3-yl}acetamid;

2-{7-fluor-4-[(3-okso-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-6-yl)karbonyl]-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-3-yl}-*N*-metylacetamid;
2-{(3*S*)-7-fluor-4-[(3-okso-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-6-yl)karbonyl]-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-3-yl}-*N*-metylacetamid;
2-{(3*R*)-7-fluor-4-[(3-okso-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-6-yl)karbonyl]-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-3-yl}-*N*-metylacetamid;
2-{7-klor-4-[(3-okso-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-6-yl)karbonyl]-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-3-yl}acetamid;
2-{(3*S*)-7-klor-4-[(3-okso-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-6-yl)karbonyl]-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-3-yl}acetamid;
2-{(3*R*)-7-klor-4-[(3-okso-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-6-yl)karbonyl]-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-3-yl}acetamid;
2-{7-klor-4-[(3-okso-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-6-yl)karbonyl]-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-3-yl}-*N*-metylacetamid;
2-{(3*S*)-7-klor-4-[(3-okso-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-6-yl)karbonyl]-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-3-yl}-*N*-metylacetamid;
2-{(3*R*)-7-klor-4-[(3-okso-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-6-yl)karbonyl]-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-3-yl}-*N*-metylacetamid;
2-{7-brom-4-[(3-okso-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-6-yl)karbonyl]-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-3-yl}acetamid;
2-{(3*S*)-7-brom-4-[(3-okso-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-6-yl)karbonyl]-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-3-yl}acetamid;
2-{(3*R*)-7-brom-4-[(3-okso-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-6-yl)karbonyl]-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-3-yl}acetamid;
2-{7-brom-4-[(3-okso-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-6-yl)karbonyl]-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-3-yl}-*N*-metylacetamid;
2-{(3*S*)-7-brom-4-[(3-okso-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-6-yl)karbonyl]-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-3-yl}-*N*-metylacetamid;
2-{(3*R*)-7-brom-4-[(3-okso-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-6-yl)karbonyl]-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-3-yl}-*N*-metylacetamid;
eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

5. Forbindelse ifølge krav 1, som er 2-{(3*S*)-7-fluor-4-[(3-okso-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-6-yl)karbonyl]-3,4-dihydro-2*H*-1,4-benzoksazin-3-yl}-*N*-metylacetamid.

6. Farmasøytisk formulering som omfatter en forbindelse med formel (**I**) eller et farmasøytisk akseptabelt salt av en forbindelse med formel (**I**) ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5 og en farmasøytisk akseptabel bærer, hjelpestoff eller

fortynningsmiddel.

7. Forbindelse med formel (**I**) eller et farmasøytisk akseptabelt salt av en forbindelse med formel (**I**) ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5 for anvendelse i terapi.

8. Forbindelse med formel (**I**) eller et farmasøytisk akseptabelt salt av en forbindelse med formel (**I**) ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5 for anvendelse ved behandling og/eller forebygging av kardiovaskulær sykdom.

9. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 8; hvori den kardiovaskulære sykdommen er hjertesvikt.

10. Forbindelse med formel (**I**) eller et farmasøytisk akseptabelt salt av en forbindelse med formel (**I**) ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5 for anvendelse ved behandling og/eller forebygging av kronisk nyresykdom.