



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3237398 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 401/12 (2006.01)
A61K 31/517 (2006.01)
A61P 31/18 (2006.01)
C07D 239/94 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

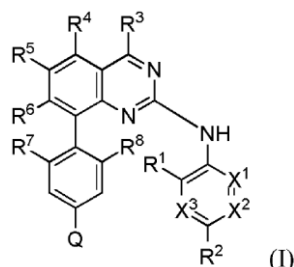
| | | |
|------|--|--|
| (21) | Translation Published | 2019.05.06 |
| (80) | Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent | 2018.12.19 |
| (86) | European Application Nr. | 15832711.4 |
| (86) | European Filing Date | 2015.12.23 |
| (87) | The European Application's Publication Date | 2017.11.01 |
| (30) | Priority | 2014.12.24, US, 201462096748 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 |
| | Designated Validation States: | MA; MD |
| (73) | Proprietor | Gilead Sciences, Inc., 333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, USA Institute of Organic Chemistry and Biochemistry AS CR, V.V.I., Flemingovo nam. 2, 16610 Praha 6, Den tsjekkiske republikk |
| (72) | Inventor | JANSA, Petr, c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, USA SIMON, Petr, c/o IOCB of the AS CR V.V.I.Flemingovo Nam. 2., 166 10 Praha 6, Den tsjekkiske republikk LANSDON, Eric, c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, USA HU, Yunfeng, Eric, c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside DriveFoster City, CA 94404, USA BASZCZYNSKI, Ondrej, c/o IOCB of the AS CR V.V.I.Flemingovo Nam. 2., 166 10 Praha 6, Den tsjekkiske republikk DEJMEK, Milan, c/o IOCB of the AS CR V.V.I.Flemingovo Nam. 2., 166 10 Praha 6, Den tsjekkiske republikk MACKMAN, Richard, L., c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, USA |
| (74) | Agent or Attorney | OSLO PATENTKONTOR AS, Postboks 7007 M, 0306 OSLO, Norge |

- (54) Title **QUINAZOLINE DERIVATIVES USED TO TREAT HIV**
- (56) References
- Cited: WO-A1-01/21598

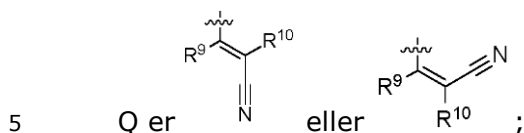
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters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

Patentkrav:

1. Forbindelse med formel (I):



hvor



X^1 , X^2 , og X^3 er hver uavhengig N eller $C(R^{11})$, forutsatt at maksimalt 2 av X^1 , X^2 , og X^3 er N;

10 R^1 er -H, -CN, -OR^a, -C(O)OR^a, halogen, C₁₋₆alkyl, C₃₋₁₀cykloalkyl, eller C₁₋₆heteroalkyl, hvor hver C₁₋₆alkyl, C₃₋₁₀cykloalkyl, og C₁₋₆heteroalkyl er eventuelt substituert med 1, 2, 3, 4, eller 5 R¹²-grupper, som kan være like eller forskjellige;

15 R^2 er -H, -CN, -OR^a, -NR^aR^b, -C(O)OR^a, halogen, C₁₋₆alkyl, C₃₋₁₀cykloalkyl, eller C₁₋₆heteroalkyl, hvor hver C₁₋₆alkyl, C₃₋₁₀cykloalkyl, og C₁₋₆heteroalkyl er eventuelt substituert med 1, 2, 3, 4, eller 5 R¹²-grupper, som kan være like eller forskjellige;

R^3 er -H, -OR^a, -SR^a, -NR^aR^b, -NHC(O)NR^aR^b, C₁₋₆alkyl, C₃₋₁₀cykloalkyl, eller C₁₋₆heteroalkyl, hvor hver C₁₋₆alkyl, C₃₋₁₀cykloalkyl, og C₁₋₆heteroalkyl er eventuelt substituert med 1, 2, 3, 4, eller 5 R¹²-grupper, som kan være like eller forskjellige;

20 R^4 er -H, -OR^a, halogen, -NO₂, -CN, -NR^aR^b, -NHC(O)NR^aR^b, -OC(O)NR^aR^b, -CH₂C(O)NR^aR^b, C₁₋₆alkyl, C₃₋₁₀cykloalkyl, eller C₁₋₆heteroalkyl, hvor hver C₁₋₆alkyl, C₃₋₁₀cykloalkyl, og C₁₋₆heteroalkyl er eventuelt substituert med 1, 2, 3, 4, eller 5 R¹²-grupper, som kan være like eller forskjellige;

R⁵ er -H, -OR^a, halogen, -NO₂, -CN, -NR^aR^b, -NHC(O)NR^aR^b, -OC(O)NR^aR^b, -CH₂C(O)NR^aR^b, C₁₋₆alkyl, C₃₋₁₀cykloalkyl, eller C₁₋₆heteroalkyl, hvor hver C₁₋₆alkyl, C₃₋₁₀cykloalkyl, og C₁₋₆heteroalkyl er eventuelt substituert med 1, 2, 3, 4, eller 5 R¹²-grupper, som kan være like eller forskjellige;

5 R⁶ er -H, -OR^a, halogen, -NO₂, -CN, -NR^aR^b, -NHC(O)NR^aR^b, -OC(O)NR^aR^b, -CH₂C(O)NR^aR^b, C₁₋₆alkyl, C₃₋₁₀cykloalkyl, eller C₁₋₆heteroalkyl, hvor hver C₁₋₆alkyl, C₃₋₁₀cykloalkyl, og C₁₋₆heteroalkyl er eventuelt substituert med 1, 2, 3, 4, eller 5 R¹²-grupper, som kan være like eller forskjellige;

10 R⁷ er C₁₋₆alkyl, C₃₋₁₀cykloalkyl, C₁₋₆heteroalkyl, halogen, -OR^a, -CN, eller -NO₂, hvor hver C₁₋₆alkyl, C₃₋₁₀cykloalkyl, og C₁₋₆heteroalkyl er eventuelt substituert med 1, 2, 3, 4, eller 5 R¹²-grupper, som kan være like eller forskjellige;

R⁸ er C₁₋₆alkyl, C₃₋₁₀cykloalkyl, C₁₋₆heteroalkyl, halogen, -OR^a, -CN, eller -NO₂, hvor hver C₁₋₆alkyl, C₃₋₁₀cykloalkyl, og C₁₋₆heteroalkyl er eventuelt substituert med 1, 2, 3, 4, eller 5 R¹²-grupper, som kan være like eller forskjellige;

15 R⁹ er -H, C₁₋₆alkyl, eller C₃₋₁₀cykloalkyl, hvor hver C₁₋₆alkyl og C₃₋₁₀cykloalkyl er eventuelt substituert med 1, 2, 3, 4, eller 5 R¹²-grupper, som kan være like eller forskjellige;

20 R¹⁰ er -H, C₁₋₆alkyl, eller C₃₋₁₀cykloalkyl, hvor hver C₁₋₆alkyl og C₃₋₁₀cykloalkyl er eventuelt substituert med 1, 2, 3, 4, eller 5 R¹²-grupper, som kan være like eller forskjellige;

hver R¹¹ er uafhængig -H, -CN, -OR^a, -C(O)OR^a, halogen, C₁₋₆alkyl, C₃₋₁₀cykloalkyl, eller C₁₋₆heteroalkyl, som kan være like eller forskellige, hvor hver C₁₋₆alkyl, C₃₋₁₀cykloalkyl, og C₁₋₆heteroalkyl er eventuelt substituert med 1, 2, 3, 4, eller 5 R¹²-grupper, som kan være like eller forskellige;

25 hver R¹² er uafhængig C₁₋₆alkyl, C₃₋₁₀cykloalkyl, C₁₋₆heteroalkyl, 5-10-leddet heterocyklyl, C₆₋₁₀aryl, 5-10-leddet heteroaryl, halogen, -OR^a, -C(O)R^a, -C(O)OR^a, -C(O)NR^aR^b, -OC(O)NR^aR^b, -NR^aC(O)OR^b, -SR^a, -S(O)₁₋₂R^a, -S(O)₂F, -S(O)₂NR^aR^b, -NR^aS(O)₂R^b, -N₃, -CN, eller -NO₂; hvor hver C₁₋₆alkyl, C₃₋₁₀cykloalkyl, C₁₋₆heteroalkyl, og 5-10-leddet heterocyklyl er eventuelt substituert med 1, 2, 3, 4, eller 5 substituenten valgt fra halogen, -OR^a, -C(O)R^a, -C(O)OR^a, -C(O)NR^aR^b, -OC(O)NR^aR^b, -NR^aC(O)OR^b, -SR^a, -S(O)₁₋₂R^a, -

30

$S(O)_2F$, $-S(O)_2NR^aR^b$, $-NR^aS(O)_2R^b$, $-N_3$, $-CN$, og $-NO_2$ -grupper, som kan være like eller forskjellige;

hver R^a og R^b er uavhengig $-H$, $-NH_2$, C_{1-6} alkyl, C_{3-10} cykloalkyl, C_{1-6} heteroalkyl, 5-10-leddet heterocyklyl, C_{6-10} aryl, eller 5-10-leddet heteroaryl, hvor hver C_{1-6} alkyl, C_{3-10} cykloalkyl, C_{1-6} heteroalkyl, 5-10-leddet heterocyklyl, C_{6-10} aryl, og 5-10-leddet heteroaryl er eventuelt substituert med 1, 2, 3, 4, eller 5 R^{13} -grupper, som kan være like eller forskjellige; eller R^a og R^b sammen med atomene som de er festet til danner et 5-10-leddet-heterocyklus; og

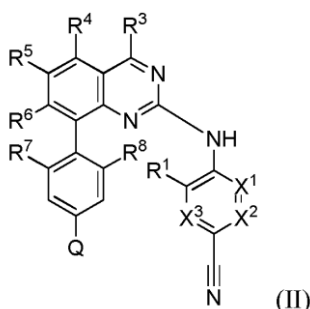
hver R^{13} er uavhengig $-CN$, halogen, C_{1-6} alkyl, C_{3-10} cykloalkyl, C_{1-6} heteroalkyl, eller 5-10-leddet heterocyklyl,

hvor "aryl" refererer til en enkelt all-karbon-aromatisk ring eller et multikondensert-all-karbon-ringsystem hvor minst en av ringene er aromatisk, hvor multikondenserte-ringsystemer eventuelt er substituert med en eller flere oksogrupper på en hvilken som helst karbocyklisk del av det multikondenserte-ringsystemet,

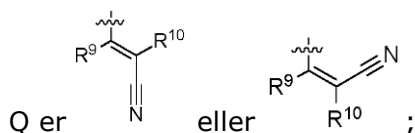
eller en tautomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

2. Forbindelse ifølge krav 1, eller en tautomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor R_2 er $-H$, $-CN$, $-ORa$ eller C_{1-6} alkyl, eventuelt hvor R_2 er $-CN$.

20 3. Forbindelse ifølge krav 1, med formel (II)



hvor



X^1 , X^2 , og X^3 er hver uavhengig N eller $C(R^{11})$, forutsatt at maksimalt 2 av X^1 , X^2 , og X^3 er N;

5 R^1 er -H, -CN, -OR^a, -C(O)OR^a, halogen eller C₁₋₆alkyl, hvor C₁₋₆alkyl er eventuelt substituert med 1, 2, 3, 4, eller 5 R¹²-grupper, som kan være like eller forskjellige;

R^3 er -H, -OR^a, -NR^aR^b, -NHC(O)NR^aR^b, C₁₋₆alkyl eller C₁₋₆heteroalkyl, hvor hver C₁₋₆alkyl og C₁₋₆heteroalkyl er eventuelt substituert med 1, 2, 3, 4, eller 5 R¹²-grupper, som kan være like eller forskjellige;

10 R^4 er -H, -OR^a, halogen, -NO₂, -CN, -NR^aR^b, C₁₋₆alkyl eller C₁₋₆heteroalkyl, hvor hver C₁₋₆alkyl og C₁₋₆heteroalkyl er eventuelt substituert med 1, 2, 3, 4, eller 5 R¹²-grupper, som kan være like eller forskjellige;

15 R^5 er -H, -OR^a, halogen, -NO₂, -CN, -NR^aR^b, -NHC(O)NR^aR^b, -OC(O)NR^aR^b, -CH₂C(O)NR^aR^b, C₁₋₆alkyl, C₃₋₁₀cykloalkyl, eller C₁₋₆heteroalkyl, hvor hver C₁₋₆alkyl, C₃₋₁₀cykloalkyl, og C₁₋₆heteroalkyl er eventuelt substituert med 1, 2, 3, 4, eller 5 R¹²-grupper, som kan være like eller forskjellige;

R^6 er -H, -OR^a, halogen, -NO₂, -CN, -NR^aR^b, C₁₋₆alkyl eller C₁₋₆heteroalkyl, hvor hver C₁₋₆alkyl og C₁₋₆heteroalkyl er eventuelt substituert med 1, 2, 3, 4, eller 5 R¹²-grupper, som kan være like eller forskjellige;

20 R^7 er C₁₋₆alkyl, C₁₋₆heteroalkyl, halogen, -OR^a, -CN, eller -NO₂, hvor hver C₁₋₆alkyl er eventuelt substituert med 1, 2, 3, 4, eller 5 R¹²-grupper, som kan være like eller forskjellige;

R^8 er C₁₋₆alkyl, C₁₋₆heteroalkyl, halogen, -OR^a, -CN, eller -NO₂, hvor hver C₁₋₆alkyl er eventuelt substituert med 1, 2, 3, 4, eller 5 R¹²-grupper, som kan være like eller forskjellige;

25 R^9 er -H eller C₁₋₆alkyl, hvor C₁₋₆alkyl er eventuelt substituert med 1, 2, 3, 4, eller 5 R¹²-grupper, som kan være like eller forskjellige;

R^{10} er -H eller C₁₋₆alkyl, hvor C₁₋₆alkyl er eventuelt substituert med 1, 2, 3, 4, eller 5 R¹²-grupper, som kan være like eller forskjellige;

hver R^{11} er uavhengig -H, -CN, -OR^a, -C(O)OR^a, halogen eller C₁₋₆alkyl, som kan være like eller forskjellige, hvor C₁₋₆alkyl er eventuelt substituert med 1, 2, 3, 4, eller 5 R¹²-grupper, som kan være like eller forskjellige;

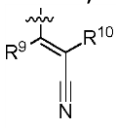
5 hver R¹² er uavhengig C₁₋₆alkyl, C₃₋₁₀cykloalkyl, C₁₋₆heteroalkyl, 5-10-leddet heterocyklyl, C₆₋₁₀aryl, 5-10-leddet heteroaryl, halogen, -OR^a, -C(O)R^a, -C(O)OR^a, -C(O)NR^aR^b, -OC(O)NR^aR^b, -NR^aC(O)OR^b, -SR^a, -S(O)₁₋₂R^a, -S(O)₂F, -S(O)₂NR^aR^b, -NR^aS(O)₂R^b, -N₃, -CN, eller -NO₂; hvor hver C₁₋₆alkyl, C₃₋₁₀cykloalkyl, C₁₋₆heteroalkyl, og 5-10-leddet heterocyklyl er eventuelt substituert med 1, 2, 3, 4, eller 5 substituenten valgt fra halogen, -OR^a, -C(O)R^a, -C(O)OR^a, -C(O)NR^aR^b, -OC(O)NR^aR^b, -NR^aC(O)OR^b, -SR^a, -S(O)₁₋₂R^a, -S(O)₂F, -S(O)₂NR^aR^b, -NR^aS(O)₂R^b, -N₃, -CN, og -NO₂-grupper, som kan være like eller forskjellige;

15 hver R^a og R^b er uavhengig -H, C₁₋₆alkyl, C₃₋₁₀cykloalkyl, C₁₋₆heteroalkyl, 5-10-leddet heterocyklyl, C₆₋₁₀aryl, eller 5-10-leddet heteroaryl, hvor hver C₁₋₆alkyl, C₃₋₁₀cykloalkyl, C₁₋₆heteroalkyl, 5-10-leddet heterocyklyl, C₆₋₁₀aryl, og 5-10-leddet heteroaryl er eventuelt substituert med 1, 2, 3, 4, eller 5 R¹³-grupper, som kan være like eller forskjellige; eller R^a og R^b sammen med atomene som de er festet til danner et 5-10leddet heterocyklus; og

20 hver R¹³ er uavhengig -CN, halogen, C₁₋₆alkyl, C₃₋₁₀cykloalkyl, C₁₋₆heteroalkyl, eller 5-10-leddet heterocyklyl,

eller en tautomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

4. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-3, eller en tautomer

eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor Q er  eller

25  ;

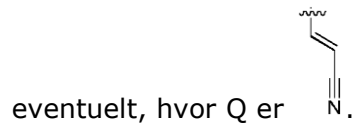
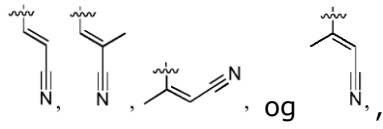
5. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-4, eller en tautomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor X¹, X², og X³ er hver CH; eller 30 X¹ er N; X² er CH; og X³ er CH; eller X¹, X², og X³ er C(R¹¹), idet hver R¹¹ er uavhengig valgt fra -H, -CN, -OR^a, halogen

og C₁₋₆alkyl; og idet R¹ er valgt fra -H, -CN, -OR^a, halogen og C₁₋₆alkyl; eller X¹, X², og X³ er C(R¹¹), idet hver R¹¹ er -H; og idet R¹ er -H.

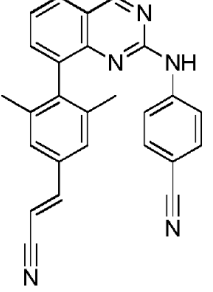
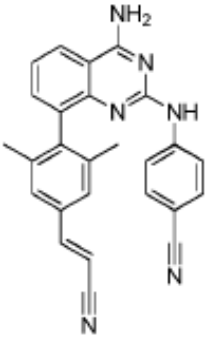
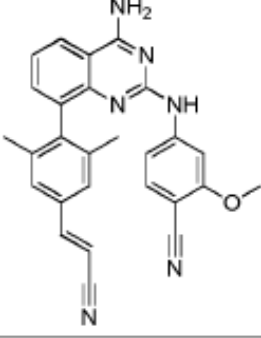
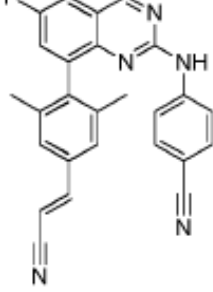
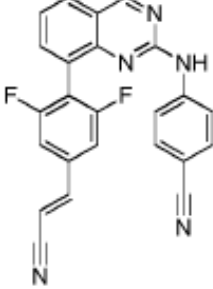
6. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-5, eller en tautomer
5 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor R³ er -H, -OR^a, -NR^aR^b, -NHC(O)NR^aR^b, C₁₋₆alkyl eller C₁₋₆heteroalkyl, eventuelt hvor R³ er -H, -OR^a, -NR^aR^b, eller -NHC(O)NR^aR^b, eventuelt hvor R³ er -NH₂ eller -OH.
7. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-6, eller en tautomer
10 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor R⁴ er -H, -OR^a, halogen, -NO₂, -CN, -NR^aR^b, -NHC(O)NR^aR^b, eller C₁₋₆alkyl; og/eller R⁵ er -H, -OR^a, halogen, -NO₂, -CN, -NR^aR^b, -NHC(O)NR^aR^b, eller C₁₋₆alkyl; og/eller R⁶ er -H, -OR^a, halogen, -NO₂, -CN, -NR^aR^b, -NHC(O)NR^aR^b, eller C₁₋₆alkyl.
- 15 8. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-7, eller en tautomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor to av R⁴, R⁵, og R⁶ er -H, -OR^a, halogen, -NO₂, -CN, -NR^aR^b, -NHC(O)NR^aR^b, eller C₁₋₆alkyl; eller to av R⁴, R⁵, og R⁶ er -H, og en av R⁴, R⁵, og R⁶ er -H, -OR^a, halogen, -NO₂, -NR^aR^b, eller C₁₋₆alkyl.
20
9. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-8, eller en tautomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor R⁶ er -H; eller hvor R⁴, R⁵, og R⁶ er -H.
- 25 10. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-9, eller en tautomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor R⁷ er C₁₋₆alkyl, C₁₋₆heteroalkyl, halogen, -OR^a, -CN, eller -NO₂; og/eller R⁸ er C₁₋₆alkyl, C₁₋₆heteroalkyl, halogen, -OR^a, -CN, eller -NO₂; eventuelt hvor R⁷ og R⁸ er like og er valgt fra C₁₋₆alkyl, C₁₋₆heteroalkyl, halogen, -OR^a, -CN, eller -
30 NO₂; eventuelt hvor R⁷ og R⁸ er C₁₋₆alkyl, eventuelt hvor R⁷ og R⁸ er metyl.
11. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-10, eller en tautomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor R⁹ er -H eller C₁₋₆alkyl; og/eller R¹⁰ er -H eller C₁₋₆alkyl;
35 eventuelt hvor R⁹ og R¹⁰ er -H.

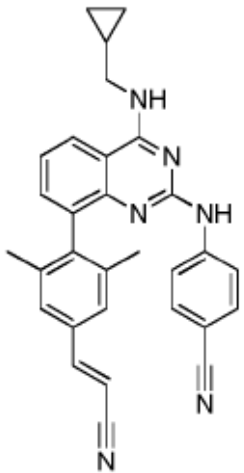
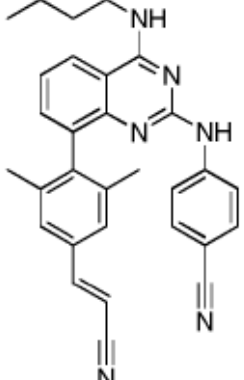
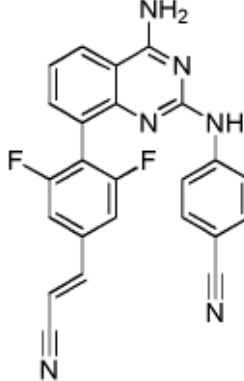
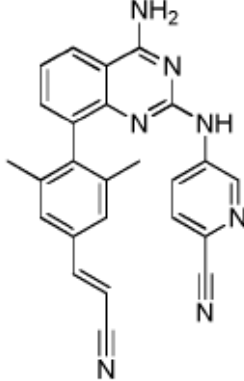
12. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-11, eller en tautomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor Q er valgt fra

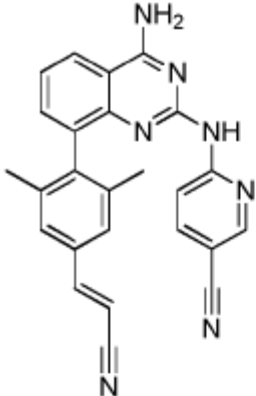
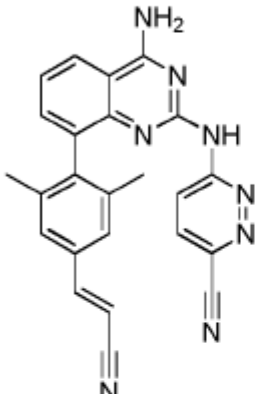
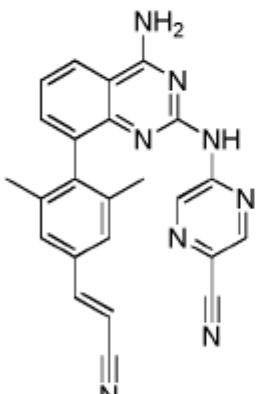
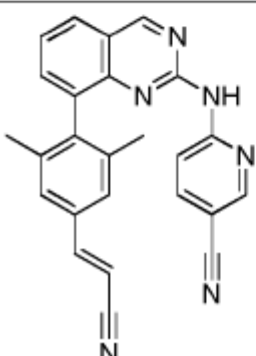
5

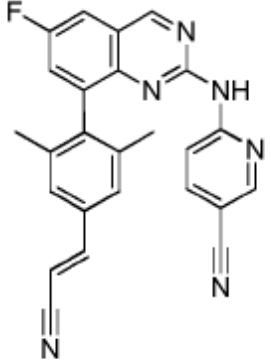
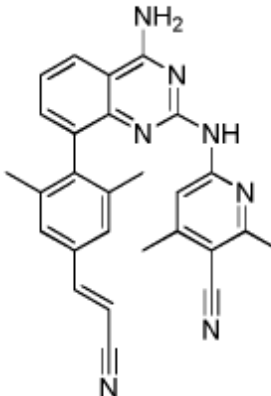
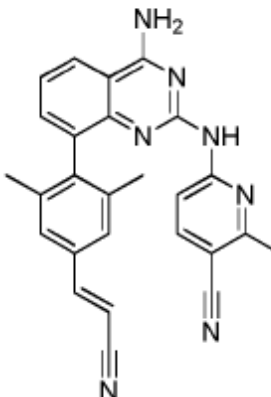
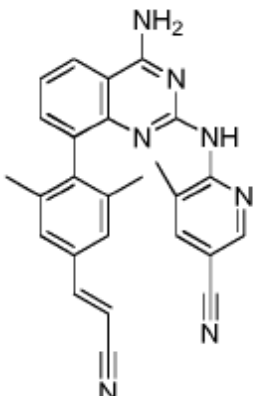


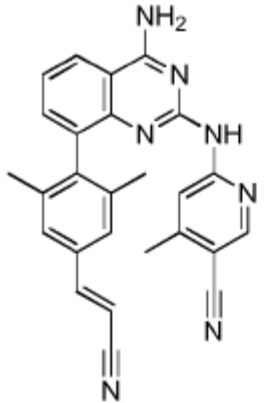
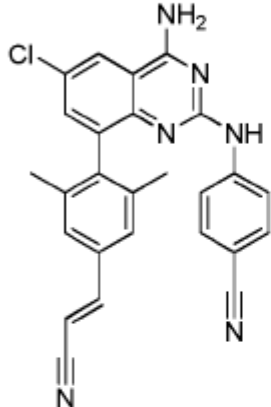
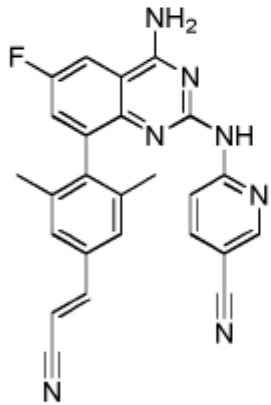
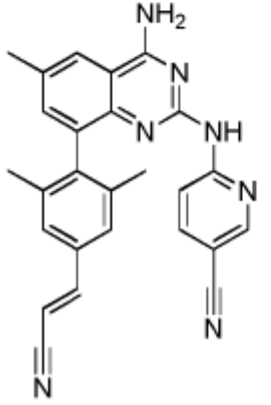
13. Forbindelse ifølge krav 1 valgt fra gruppen bestående av:

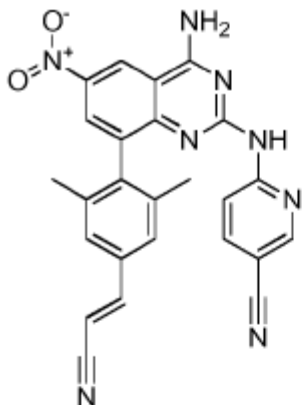
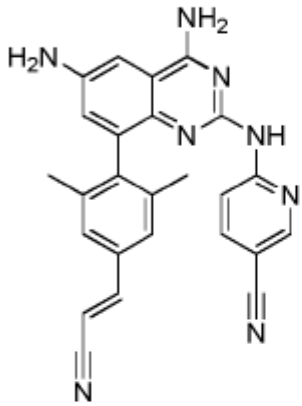
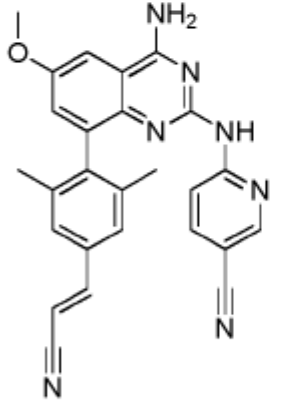
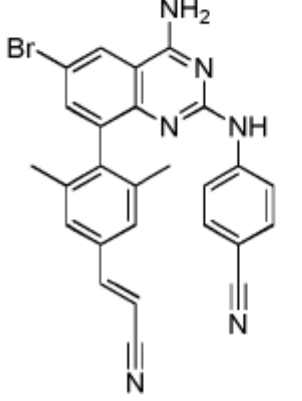
| Structure | Compound ID |
|---|-------------|
|  | 1; |
|  | 2; |
|  | 3; |
|  | 4; |
|  | 5; |

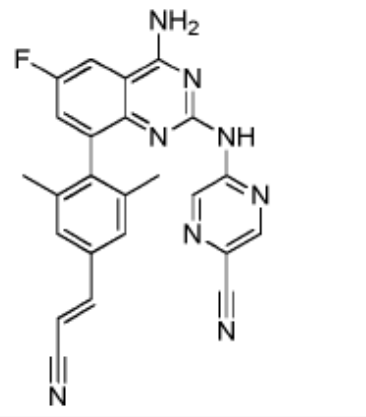
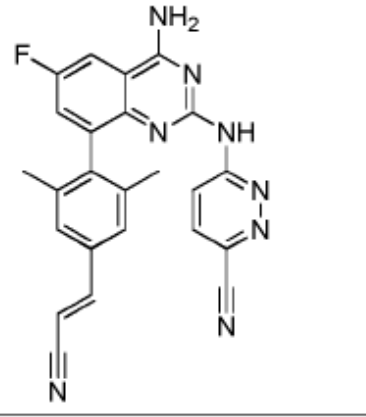
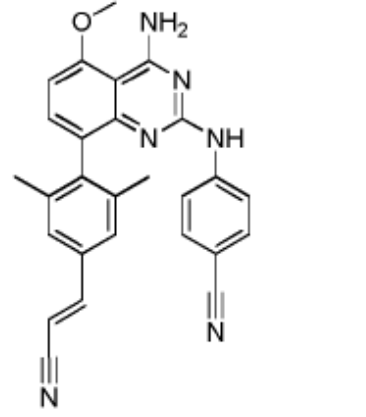
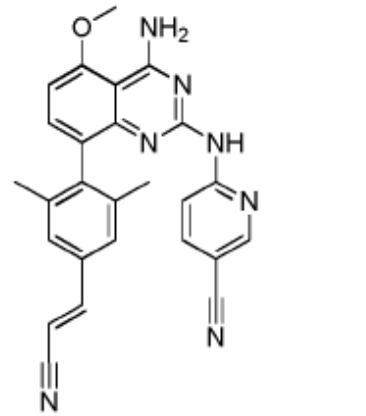
| | |
|---|----|
|  | 6; |
|  | 7; |
|  | 8; |
|  | 9; |

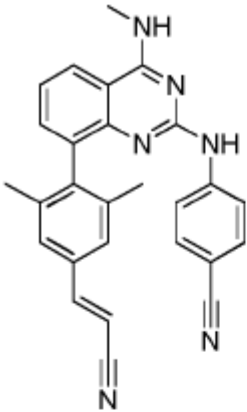
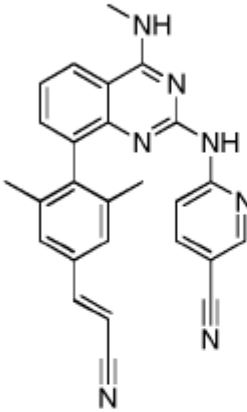
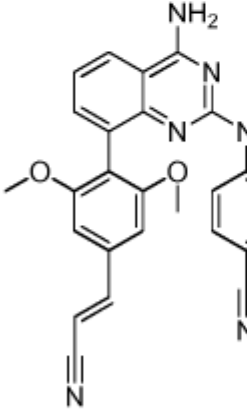
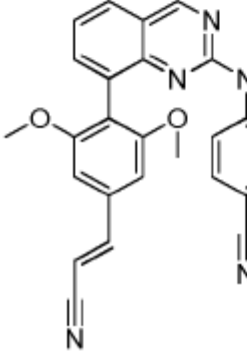
| | |
|---|-----|
|  | 10; |
|  | 11; |
|  | 12; |
|  | 13; |

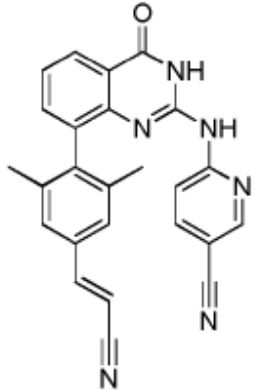
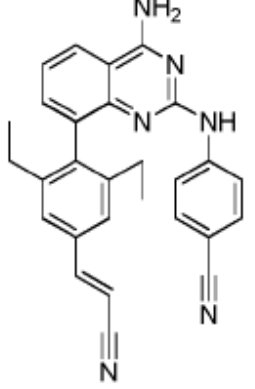
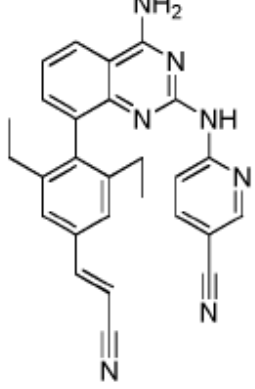
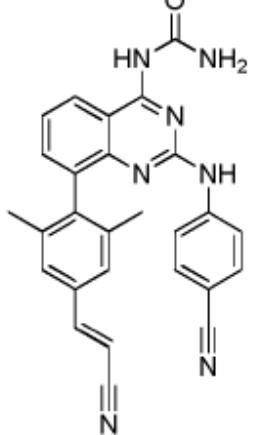
| | |
|---|-----|
|  | 14; |
|  | 15; |
|  | 16; |
|  | 17; |

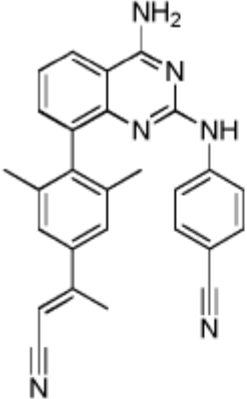
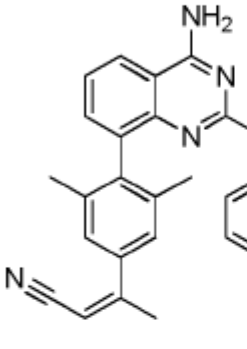
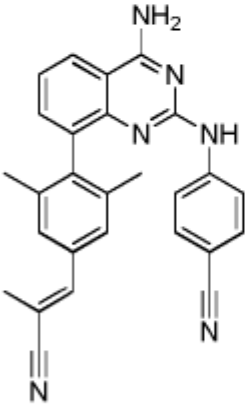
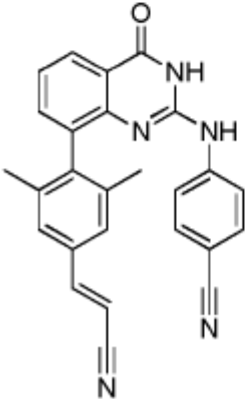
| | |
|---|-----|
|  | 18; |
|  | 19; |
|  | 20; |
|  | 21; |

| | |
|--|--|
|  <p>22;</p> | |
|  <p>23;</p> | |
|  <p>24;</p> | |
|  <p>25;</p> | |

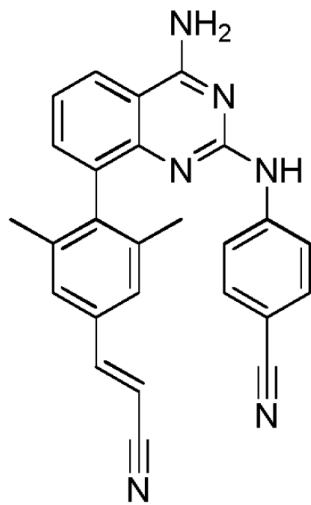
| | |
|---|-----|
|  <p>Chemical structure 26: A pyrimidin-2-amine derivative with a 4-fluoro-2-methylphenyl group at position 4, a 2-cyano-3-methylphenyl group at position 5, and a 4-cyano-1H-imidazol-2-yl group at position 6.</p> | 26; |
|  <p>Chemical structure 27: A pyrimidin-2-amine derivative with a 4-fluoro-2-methylphenyl group at position 4, a 2-cyano-3-methylphenyl group at position 5, and a 4-cyano-1,2,4-triazol-5-yl group at position 6.</p> | 27; |
|  <p>Chemical structure 28: A pyrimidin-2-amine derivative with a 4-methoxy-2-methylphenyl group at position 4, a 2-cyano-3-methylphenyl group at position 5, and a 4-cyano-1H-imidazol-2-yl group at position 6.</p> | 28; |
|  <p>Chemical structure 29: A pyrimidin-2-amine derivative with a 4-methoxy-2-methylphenyl group at position 4, a 2-cyano-3-methylphenyl group at position 5, and a 4-cyano-1,2,4-triazol-5-yl group at position 6.</p> | 29; |

| | |
|---|-----|
|  | 30; |
|  | 31; |
|  | 32; |
|  | 33; |

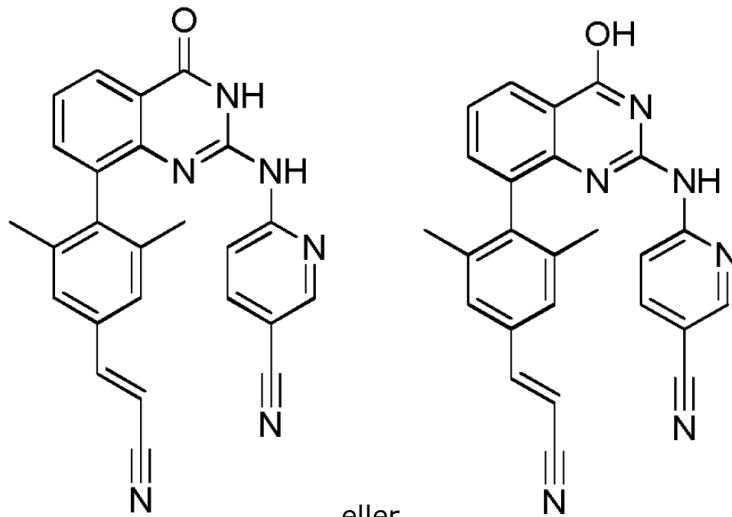
| | |
|---|-----|
|  | 34; |
|  | 35; |
|  | 36; |
|  | 37; |

| | |
|---|--------|
|  | 38; |
|  | 39; |
|  | 40; og |
|  | 41. |

14. Forbindelse ifølge krav 1 med formel:



eller



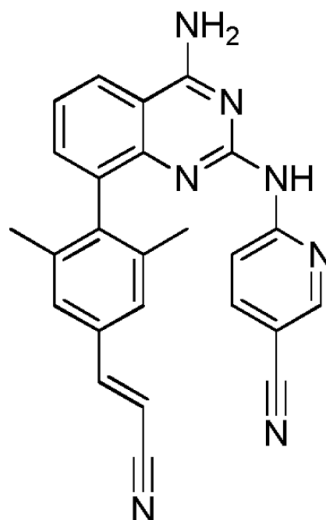
eller

;

eller en tautomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

5

15. Forbindelse ifølge krav 1 med formel:



eller en tautomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

16. Farmasøytisk sammensetning omfattende en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-15, eller en tautomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og en farmasøytisk akseptabel bærer, eventuelt videre omfattende minst ett eller flere ytterligere terapeutisk middel, eventuelt hvor det minst ene eller flere
5 ytterligere terapeutisk middel er valgt fra gruppen bestående av HIV-proteaseinhiberende forbindelser, HIV-ikke-nukleosidinhibitorer av revers transkriptase, HIV-nukleosidinhibitorer av revers transkriptase, HIV-nukleotidinhibitorer av revers transkriptase, HIV-integrase-inhibitorer, gp41-inhibitorer, CXCR4-inhibitorer, gp120-inhibitorer, CCR5-inhibitorer,
10 kapsidpolymerisasjonsinhibitorer og andre legemidler for behandling av HIV, og kombinasjoner derav.

17. Kit omfattende en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-15, eller en tautomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

15

18. Fremgangsmåte for fremstilling omfattende en enhetsdose av en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-15 eller en tautomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

19. Forbindelse ifølge hvilket som helst av kravene 1-15, eller et tautomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, til anvendelse i en fremgangsmåte for behandling eller forebygging av en HIV-infeksjon i et individ som omfatter administrering til individet som trenger det, en forbindelse ifølge et hvilket som
20 helst av kravene 1 -15 eller en tautomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt
25 derav i kombinasjon med en terapeutisk effektiv mengde av en eller flere ytterligere terapeutiske midler valgt fra gruppen bestående av HIV-proteaseinhiberende forbindelser, HIV-ikke-nukleosidinhibitorer av revers transkriptase, HIV-nukleosidinhibitorer av revers transkriptase, HIV-nukleotidinhibitorer av revers transkriptase, HIV-integrase-inhibitorer, gp41-
30 inhibitorer, CXCR4-inhibitorer, gp120-inhibitorer, CCR5-inhibitorer, kapsidpolymerisasjonsinhibitorer og andre legemidler for behandling av HIV, og kombinasjoner derav.

20. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-15, eller en tautomer
35 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for bruk i medisinsk terapi.

21. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-15, eller en tautomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for bruk i behandling eller forebygging av en HIV-virusinfeksjon i et individ.
- 5 22. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-15, eller en tautomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for hemming av HIV-revers transkriptase *in vitro*.