



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3472148 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/27 (2006.01)
A61K 31/41 (2006.01)
A61K 31/4192 (2006.01)
A61K 31/454 (2006.01)
C07D 249/06 (2006.01)
C07D 401/04 (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2020.07.27
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.03.11
(86)	European Application Nr.	17734594.9
(86)	European Filing Date	2017.06.20
(87)	The European Application's Publication Date	2019.04.24
(30)	Priority	2016.06.21, US, 201662352792 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	Bristol-Myers Squibb Company, Route 206 and Province Line Road, Princeton, NJ 08543, USA
(72)	Inventor	CHENG, Peter, Tai, Wah, c/o Bristol-Myers Squibb Company350 Carter Road, Hopewell, NJ 08540, USA KALTENBACH, Robert, F., III, c/o Bristol-Myers Squibb Company350 Carter Road, Hopewell, NJ 08540, USA LI, Jun, c/o Bristol-Myers Squibb Company350 Carter Road, Hopewell, NJ 08540, USA SHI, Jun, c/o Bristol-Myers Squibb Company350 Carter Road, Hopewell, NJ 08540, USA SHI, Yan, c/o Bristol-Myers Squibb Company350 Carter Road, Hopewell, NJ 08540, USA TAO, Shiwei, c/o Bristol-Myers Squibb Company350 Carter Road, Hopewell, NJ 08540, USA ZHANG, Hao, c/o Bristol-Myers Squibb Company350 Carter Road, Hopewell, NJ 08540, USA DHANUSU, Suresh, SYNGENE INTERNATIONAL LIMITEDBiocon Special Economic ZoneBiocon ParkPlot No. 2&3Bommasandra Industrial Area IV PhaseJigani Link Road Bommasandra, Bangalore 560099Karnataka, India SELVAKUMAR, Kumaravel, SYNGENE INTERNATIONAL LIMITEDBiocon Special

Economic Zone Biocon Park Plot No. 2&3 Bommasandra Industrial Area IV
 Phase Jigani Link Road Bommasandra, Bangalore 560 099 Karnataka, India
 REDDIGUNTA, Ramesh Babu, 26 Iruvaram Village and Post Chittoor District Andhra
 Pradesh, India Pin 517128, India
 WALKER, Steven J., c/o Bristol-Myers Squibb Company Route 206 and Province
 Line Road, Princeton, NJ 08543, USA
 KENNEDY, Lawrence J., c/o Bristol-Myers Squibb Company 350 Carter Road,
 Hopewell, NJ 08540, USA
 CORTE, James R., c/o Bristol-Myers Squibb Company 350 Carter Road, Hopewell,
 NJ 08540, USA
 FANG, Tianan, c/o Bristol-Myers Squibb Company 350 Carter Road, Hopewell, NJ
 08540, USA
 JUSUF, Sutjano, c/o Bristol-Myers Squibb Company 350 Carter Road, Hopewell, NJ
 08540, USA

(74) Agent or Attorney TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

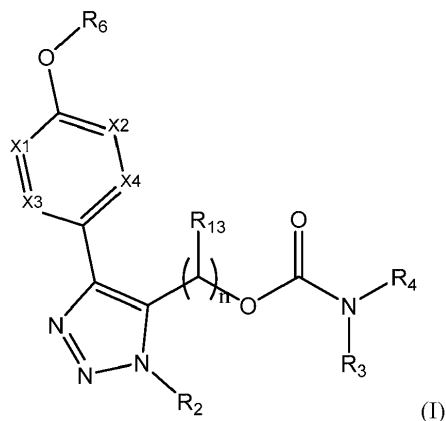
(54) Title **CARBAMOYLOXYMETHYL TRIAZOLE CYCLOHEXYL ACIDS AS LPA ANTAGONISTS**

(56) References
 Cited: EP-A2- 0 433 842
 WO-A1-2014/001279
 WO-A2-2011/041694
 US-A1- 2012 115 844
 US-A1- 2014 031 353
 US-A1- 2014 329 871
 MANICKAM BAKTHADOSS ET AL: "Synthesis of highly diversified 1,2,3-triazole derivatives via domino [3 + 2] azide cycloaddition and denitration reaction sequence", RSC ADVANCES: AN INTERNATIONAL JOURNAL TO FURTHER THE CHEMICAL SCIENCES, vol. 5, no. 113, 1 January 2015 (2015-01-01), pages 93447-93451, XP055393892, GB ISSN: 2046-2069, DOI: 10.1039/C5RA14195H

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

Patentkrav

1. En forbindelse ifølge formel (I):



5

eller stereoisomerer, tautomerer, et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvater derav, hvor

R_2 er uavhengig valgt fra H og C_{1-4} alkyl substituert med 1-5 R_9 ;

R_{13} er uavhengig valgt fra H, D og C_{1-4} alkyl substituert med 1-3 R_9 ;

10

R_3 og R_4 er uavhengig valgt fra H, C_{1-7} alkyl substituert med 1-3 R_9 , $-(CR_7R_7)_r-C_{3-8}$ sykloalkyl substituert med 1-3 R_8 , $-(CR_7R_7)_r$ -aryl substituert med 1-3 R_8 , C_{2-7} alkenyl substituert med 1-3 R_9 , $-(CR_7R_7)_r$ -5-6-leddet heterosyklisk ring substituert med 1-3 R_8 , $-(CR_7R_7)_r$ -5-6-leddet heteroaryling substituert med 1-3 R_8 eller R_3 og R_4 kombineres med N som de er bundet til for å danne en 4-9-leddet heterosyklisk ring substituert med 1-3 R_8 ;

15

X^1 , X^2 , X^3 og X^4 er uavhengig valgt fra CR_5 og N; forutsatt ikke mer enn to av X^1 , X^2 , X^3 , eller X^4 er N;

R_5 er uavhengig valgt fra H, F, Cl, OR_7 , CN, $N(R_7)_2$, C_{1-4} alkyl substituert med 1-5 R_9 , C_{1-4} alkoxy substituert med 1-5 R_9 og C_{1-4} heteroalkyl substituert med 1-5 R_9 ;

20

R_6 er C_{3-8} sykloalkyl som er substituert med R_{10} og $(-CH_2)_{0-1}R_{11}$;

R_7 er uavhengig valgt fra H, C_{1-4} alkyl og C_{3-6} sykloalkyl; eller R_7 og R_7 , sammen med karbonatomet som de begge er bundet til, danner en C_{3-6} sykloalkylring;

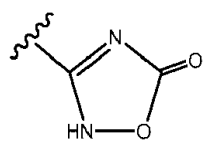
R_8 er uavhengig valgt fra H, D, C_{1-6} alkyl substituert med 1-5 R_9 , C_{2-6} alkenyl, C_{2-6} alkynyl, fenyl, $-(CH_2)_r-C_{3-6}$ sykloalkyl, F, Cl, Br, CN, COOH og C_{1-4} alkoksy;

R₉ er uafhængig valgt fra H, D, F, Cl, NH₂, OH, OC₁₋₅ alkyl, C₁₋₅ alkyl, C₁₋₅ heteroalkyl C₃₋₆ sykloalkyl og feny, hvor når R₉ er Cl, NH₂ eller OH, det er ikke substitueret på C₁ av alkylen som det er bundet til;

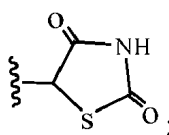
5

R₁₀ er uafhængig valgt fra H, D, C₁₋₄ alkyl, F, Cl, Br, OR₇, NHC(=O)OR₇, og NHC(=O)OR₇;

R₁₁ er uafhængig valgt fra H, CN, -C(=O)R₁₂ tetrazolyl,



og



10

R₁₂ er uafhængig valgt fra OH, OC₁₋₄ alkyl, NH₂, NHCH₂CH₂SO₃H og NHSO₂C₁₋₄ alky;

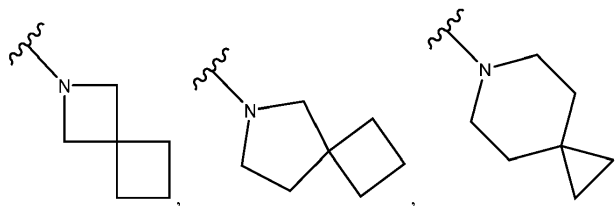
r er uafhængig valgt fra null, 1, 2, 3 og 4,

og n er valgt fra 1, 2, 3 eller 4.

2. Forbindelse ifølge krav 1, hvor

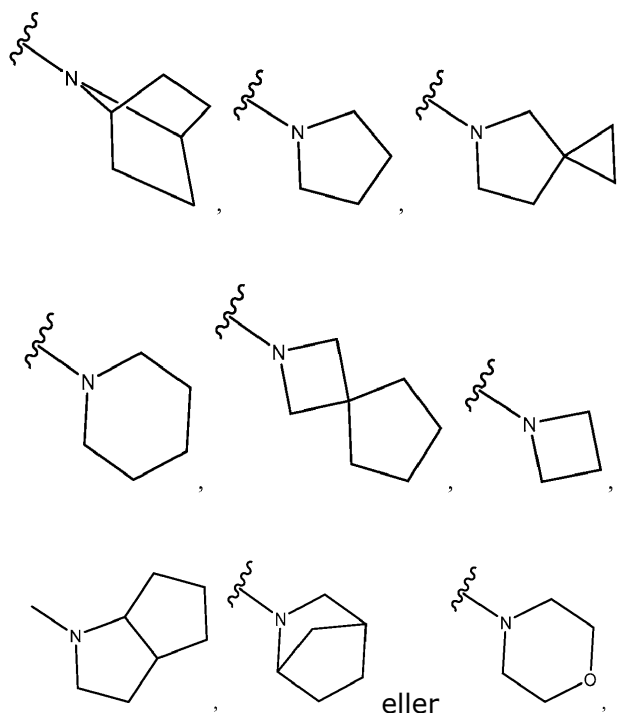
15

R₃ og R₄ er uafhængig valgt fra H, C₁₋₇ alkyl substitueret med 1-3 R₉, -(CR₇R₇)_r-C₃₋₈ sykloalkyl substitueret med 1-3 R₈, -(CR₇R₇)_r-aryl substitueret med 1-3 R₈, C₂₋₇ alkenyl substitueret med 1-3 R₉, -(CR₇R₇)_r-5-6-leddet heterosyklisk ring substitueret med 1-3 R₈, -(CR₇R₇)_r-5-6-leddet heteroaryling substitueret med 1-3 R₈ og R₃ og R₄ kombineres med det N som de er bundet til for å danne de følgende:



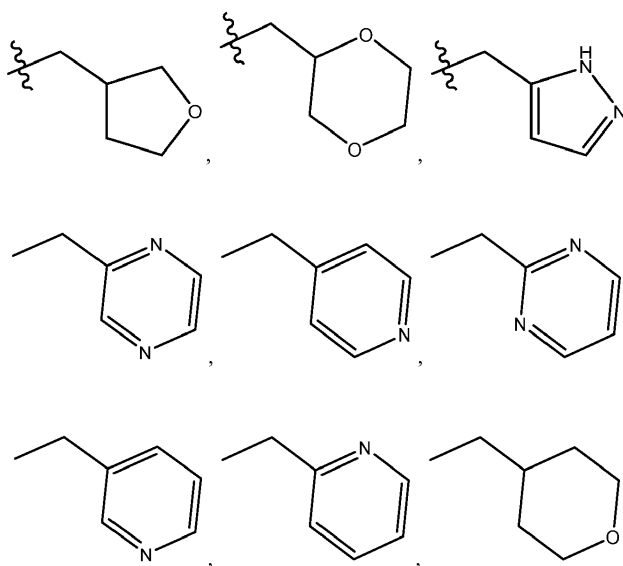
20

3



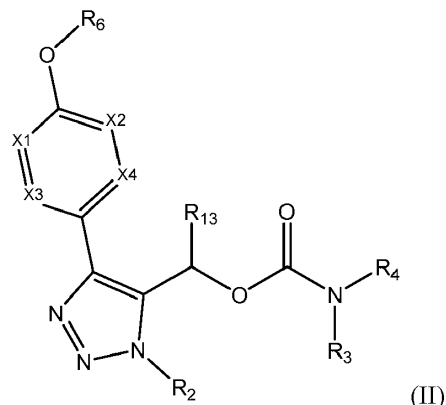
som hver kan være substituert med 1-3 R_8 , og n tilsvarer 1 eller 2.

- 10 3. Forbindelse ifølge krav 1, hvor, R_3 og R_4 er uafhængig valgt fra H, C_{1-7} alkyl substituert med 1-3 R_9 , $-(CR_7R_7)_r-C_{3-8}$ sykloalkyl substituert med 1-3 R_8 , $-(CR_7R_7)_r$ -aryl substituert med 1-3 R_8 , C_{2-7} alkenyl substituert med 1-3 R_9 ,



- 20 hvor hver kan substitueres med 1-3 R_8 , og R_3 og R_4 kombineres med det N som de er bundet til for å danne en 4-9-leddet heterosyklisk ring substituert med 1-3 R_8 ; og n tilsvarer 1 eller 2.

4. Forbindelse ifølge krav 1 med formel (II):



5 eller en enantiomer, en diastereomer, en stereoisomer, et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor

R₂ er uavhengig valgt fra H og C₁₋₄ alkyl substituert med 1-5 R₉;

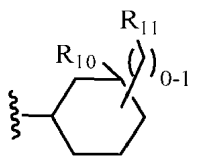
R₁₃ er uavhengig valgt fra H, D og C₁₋₄ alkyl substituert med 1-3 R₉;

R₃ og R₄ er uavhengig valgt fra H, C₁₋₇ alkyl substituert med 1-3 R₉, -(CR₇R₇)_r-C₃₋₆ sykloalkyl substituert med 1-3 R₈, og -(CR₇R₇)_r-aryl substituert med 1-3 R₈;

10 X¹, X², X³ og X⁴ er uavhengig valgt fra CR₅ og N; forutsatt ikke mer enn to av X¹, X², X³, eller X⁴ er N;

R₅ er uavhengig valgt fra H, F, Cl, OR₇, CN, N(R₇)₂, C₁₋₄ alkyl substituert med 1-5 R₉, C₁₋₄ alkoxy substituert med 1-5 R₉ og C₁₋₄ heteroalkyl substituert med 1-5 R₉;

R₆ er



15

R₇ er uavhengig valgt fra H, C₁₋₄ alkyl og C₃₋₆ sykloalkyl; eller R₇ og R₇, sammen med karbonatomet som de begge binder til, danner en C₃₋₆ sykloalkylring;

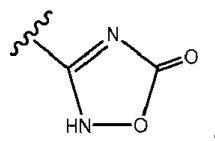
R₈ er uavhengig valgt fra H, C₁₋₆ alkyl substituert med 1-5 R₉, C₂₋₆ alkenyl, C₂₋₆ alkynyl, -(CH₂)_r-C₃₋₆ sykloalkyl, F, Cl, Br, CN og COOH;

R₉ er uafhængig valgt fra H, F, Cl, NH₂, OH, OC₁₋₅ alkyl, C₁₋₅ alkyl, C₁₋₅ heteroalkyl C₃₋₆ syklealkyl og fenyl hvor når R₉ er Cl, NH₂ eller OH, det er ikke substitueret på C₁ av alkylen som det er bundet til;

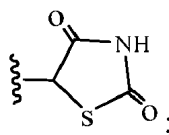
5

R₁₀ er uafhængig valgt fra H, D, C₁₋₄ alkyl, F, Cl, Br, OR₇, NHC(=O)OR₇, og NHC(=O)OR₇;

R₁₁ er uafhængig valgt fra CN, -C(=O)R₁₂ tetrazolyl,



og

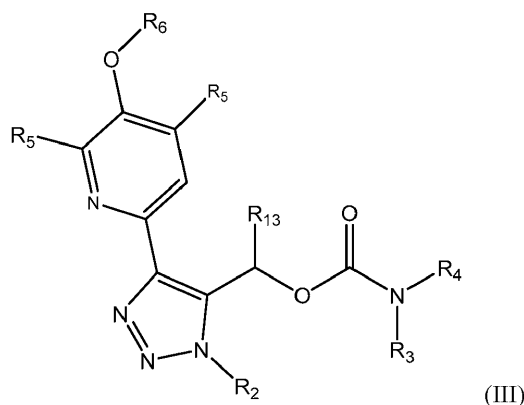


10

R₁₂ er uafhængig valgt fra OH, OC₁₋₄ alkyl, NH₂, NHCH₂CH₂SO₃H og NHSO₂C₁₋₄ alky;

r er uafhængig valgt fra null, 1, 2, 3 og 4.

5. Forbindelse ifølge krav 4 som har formel (III):



(III)

15

eller en enantiomer, en diastereomer, en stereoisomer, et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor

R₂ er uafhængig valgt fra CH₃ og CD₃;

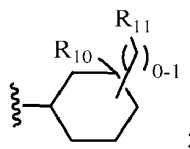
R₁₃ er uafhængig valgt fra H og C₁₋₄ alkyl;

R₃ er uafhængig valgt fra H og C₁₋₄ alkyl;

R₄ er uavhengig valgt fra C₁₋₆ alkyl substituert med 1-3 R₉, -(CR₇R₇)_r-C₃₋₆ sykloalkyl substituert med 1-3 R₈, og -(CR₇R₇)_r-aryl substituert med 1-3 R₈;

R₅ er uavhengig valgt fra H, F, Cl, CN og C₁₋₄ alkyl; forutsatt en av R₅ er H;

R₆ er



R₇ er uavhengig valgt fra H, C₁₋₄ alkyl og C₃₋₆ sykloalkyl; eller R₇ og R₇, sammen med karbonatomet som de begge binder til, danner en C₃₋₆ sykloalkylring;

R₈ er uavhengig valgt fra H, C₁₋₆ alkyl substituert med 1-5 R₉, C₃₋₆ sykloalkyl, F, Cl, Br, CN, =O og COOH;

10 R₉ er uavhengig valgt fra H, F, Cl, NH₂, OH, OC₁₋₅ alkyl, C₁₋₅ alkyl, C₃₋₆ sykloalkyl og fenyl hvor når R₉ er Cl, NH₂ eller OH, det er ikke substituert på C₁ av alkylene som det er bundet til;

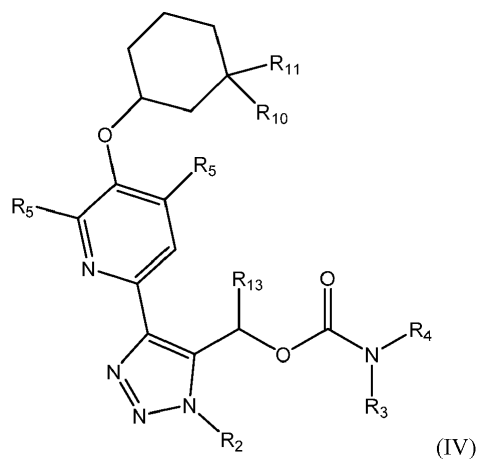
R₁₀ er uavhengig valgt fra H, D, C₁₋₄ alkyl og F;

R₁₁ er uavhengig valgt fra CN, -C(=O)R₁₂ og tetrazolyl;

15 R₁₂ er uavhengig valgt fra OH, OC₁₋₄ alkyl, NH₂ og NHSO₂C₁₋₄ alky; og

r er uavhengig valgt fra null, 1, 2, 3 og 4.

6. Forbindelse ifølge krav 5, med formel (IV):



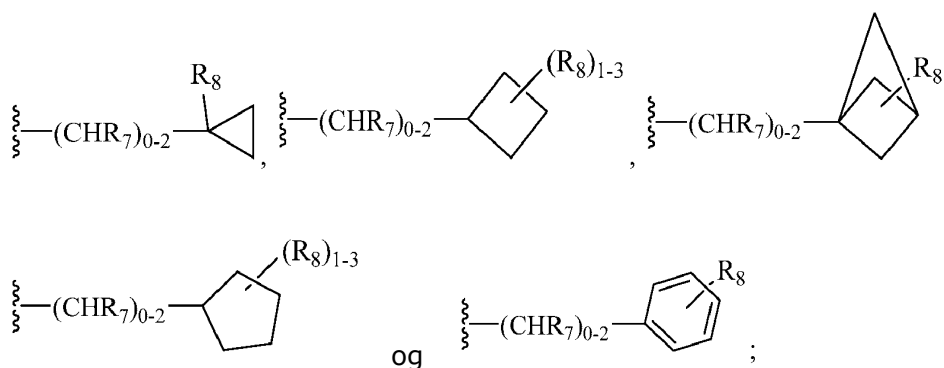
eller en enantiomer, en diastereomer, en stereoisomer, et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor

R_2 er uavhengig valgt fra CH_3 og CD_3 ;

R_{13} er uavhengig valgt fra H og C_{1-4} alkyl;

5 R_3 er uavhengig valgt fra H og C_{1-4} alkyl;

R_4 er uavhengig valgt fra C_{1-6} alkyl,



10 R_5 er uavhengig valgt fra H, F, Cl og C_{1-4} alkyl; forutsatt en av R_5 er H;

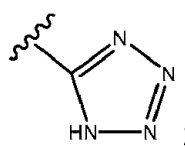
R_7 er uavhengig valgt fra H, C_{1-4} alkyl og C_{3-6} sykloalkyl;

R_8 er uavhengig valgt fra H, C_{1-6} alkyl substituert med 1-5 R_9 , C_{3-6} sykloalkyl, F, Cl, Br, CN, =O og COOH;

15 R_9 er uavhengig valgt fra H, F, Cl, NH_2 , OH, OC_{1-5} alkyl, C_{1-5} alkyl, C_{3-6} sykloalkyl og fenyl hvor når R_9 er Cl, NH_2 eller OH, det er ikke substituert på C_1 av alkylene som det er bundet til;

R_{10} er uavhengig valgt fra H, D, C_{1-4} alkyl og F;

R_{11} er uavhengig valgt fra CN, $-\text{C}(=\text{O})\text{R}_{12}$, og

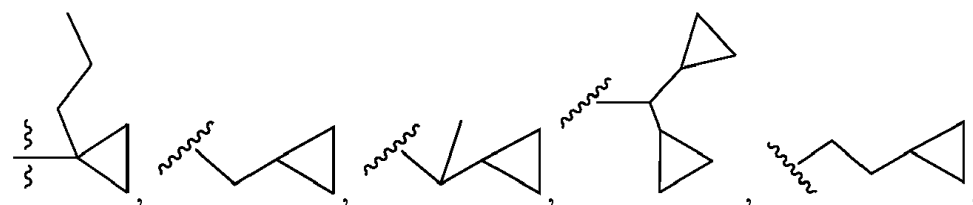
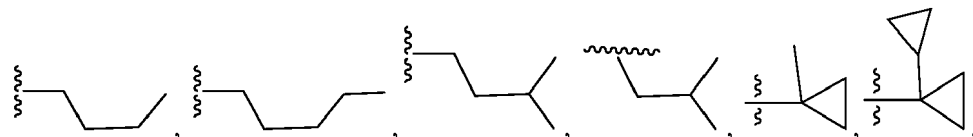
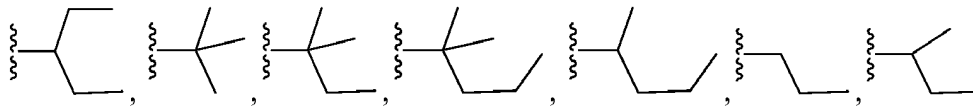


20 og

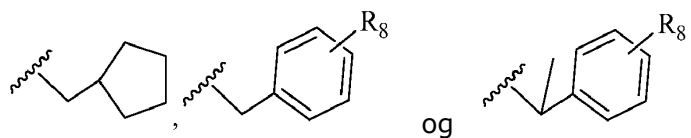
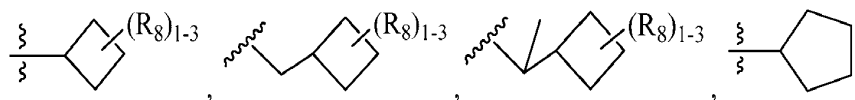
R_{12} er uavhengig valgt fra OH og $\text{NHSO}_2\text{C}_{1-4}$ alky.

7. Forbindelse ifølge krav 6 eller en enantiomer, en diastereomer, en stereoisomer, et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor R₄ er uafhængig valgt fra

5



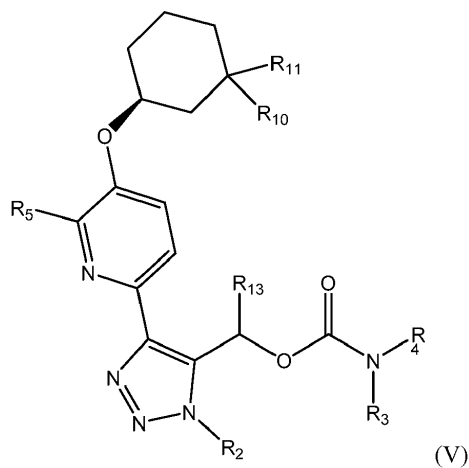
10



15 og

R₈ er uafhængig valgt fra H, F, Cl, Br, CN og C₁₋₄ alkyl.

8. Forbindelse ifølge krav 7 som har formel (V):



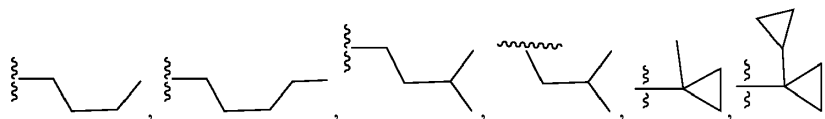
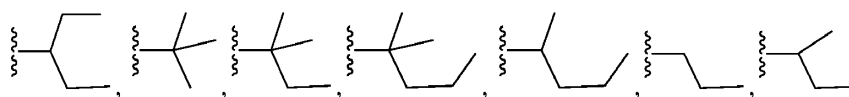
eller en enantiomer, en diastereomer, en stereoisomer, et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor

R_2 er uavhengig valgt fra CH_3 og CD_3 ;

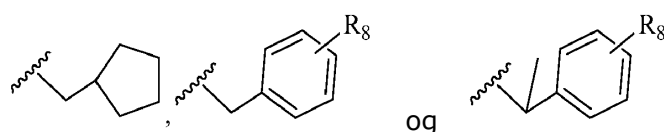
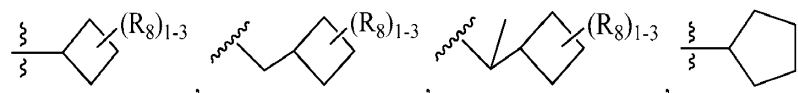
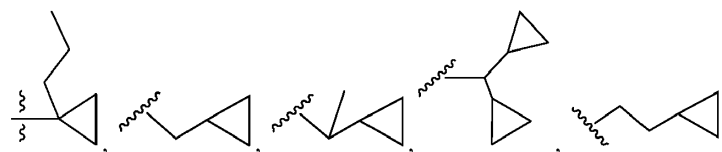
R_{13} er uavhengig valgt fra H og CH_3 ;

5 R_3 er uavhengig valgt fra H og CH_3 ;

R_4 er uavhengig valgt fra



10



15

og

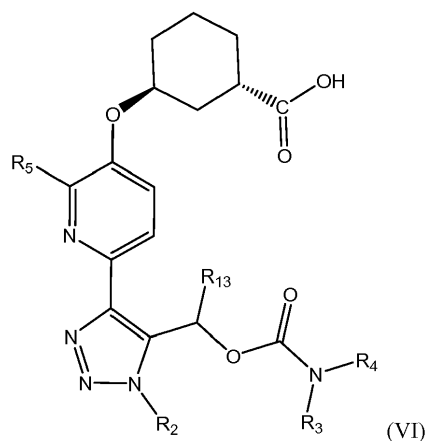
R_5 er uavhengig valgt fra H, F og C_{1-4} alkyl;

R_8 er uavhengig valgt fra H, F, Cl, Br, CN og C_{1-4} alkyl;

R_{10} er uavhengig valgt fra H, D og F; og

20 R_{11} er uavhengig valgt fra $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$, og $-\text{C}(=\text{O})\text{NHSO}_2\text{Me}$.

9. Forbindelse ifølge krav 7 som har formel (VI):



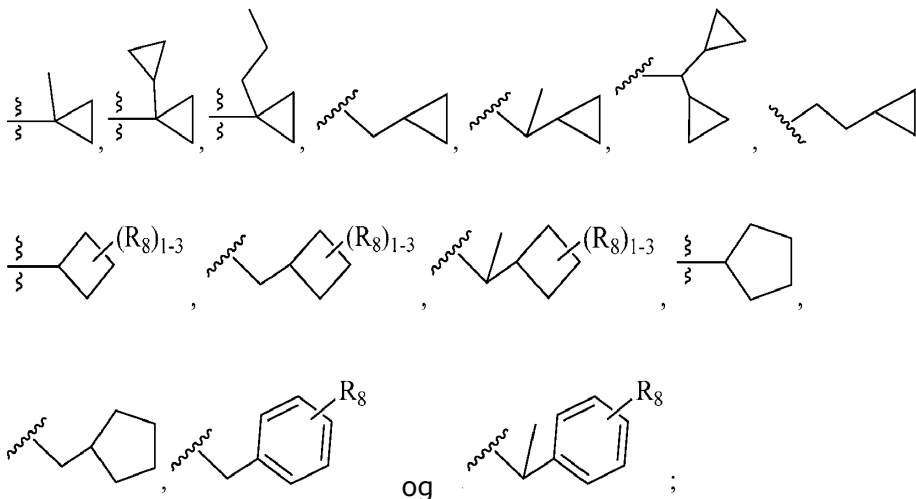
eller en enantiomer, en diastereomer, en stereoisomer, et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor

R₂ er uavhengig valgt fra CH₃ og CD₃;

5 R₁₃ er uavhengig valgt fra H og CH₃;

R₃ er uavhengig valgt fra H og CH₃;

R₄ er uavhengig valgt fra

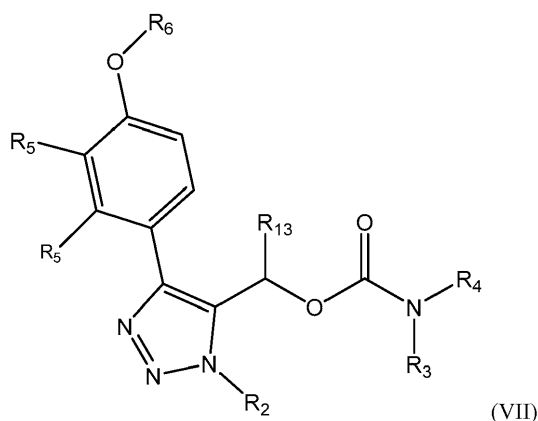


R₅ er uavhengig valgt fra H og CH₃; og

R₈ er uavhengig valgt fra H, F, Cl, Br, CN og C₁₋₄ alkyl.

15

10. Forbindelse ifølge krav 4 som har formel (VII):



eller en enantiomer, en diastereomer, en stereoisomer, et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor

R₂ er uavhengig valgt fra CH₃ og CD₃;

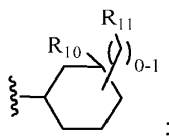
5 R₁₃ er uavhengig valgt fra H og C₁₋₄ alkyl;

R₃ er uavhengig valgt fra H og C₁₋₄ alkyl;

R₄ er uavhengig valgt fra C₁₋₆ alkyl substituert med 1-3 R₉, (CR₇R₇)_r-C₃₋₆ sykkloalkyl substituert med 1-3 R₈, og -(CR₇R₇)_r-aryl substituert med 1-3 R₈;

R₅ er uavhengig valgt fra H, F, Cl, CN og C₁₋₄ alkyl;

10 R₆ er



R₇ er uavhengig valgt fra H, C₁₋₄ alkyl og C₃₋₆ sykkloalkyl; eller R₇ og R₇, sammen med karbonatomet som de begge er bundet til, danner en C₃₋₆ sykkloalkylring;

15 R₈ er uavhengig valgt fra H, C₁₋₆ alkyl substituert med 1-5 R₉, C₃₋₆ sykkloalkyl, F, Cl, Br, CN, =O og COOH;

R₉ er uavhengig valgt fra H, F, Cl, NH₂, OH, OC₁₋₅ alkyl, C₁₋₅ alkyl, C₃₋₆ sykkloalkyl og fenyl, hvor når R₉ er Cl, NH₂ eller OH, det er ikke substituert på C₁ av alkylen som det er bundet til;

R₁₀ er uavhengig valgt fra H, C₁₋₄ alkyl og F;

20 R₁₁ uavhengig valgt fra -C(=O)R₁₂ og tetrazolyl;

R₁₂ er uafhængig valgt fra OH og NHSO₂C₁₋₄ alky; og

r er uafhængig valgt fra null, 1, 2, 3 og 4.

11. Forbindelse ifølge krav 10, eller en enantiomer, en diastereomer, en stereoisomer, et

5 farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor

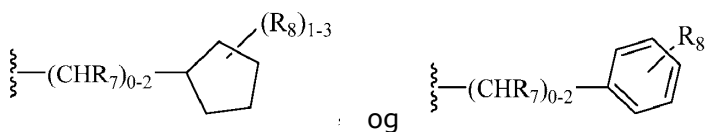
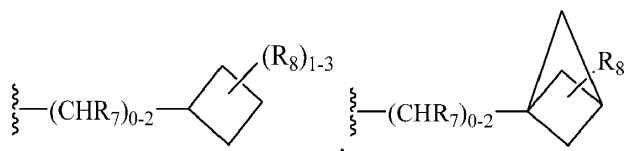
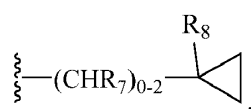
R₂ er uafhængig valgt fra CH₃ og CD₃;

R₁₃ er uafhængig valgt fra H og CH₃;

R₃ er uafhængig valgt fra H og CH₃;

R₄ er uafhængig valgt fra C₁₋₆ alkyl,

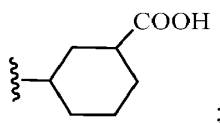
10



15

R₅ er uafhængig valgt fra H, F, Cl og C₁₋₄ alkyl;

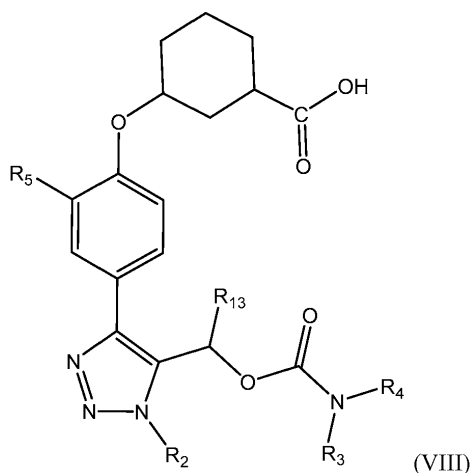
R₆ er



R₇ er uafhængig valgt fra H, C₁₋₄ alkyl og C₁₋₆ sykloalkyl; og

20 R₈ er uafhængig valgt fra H, F, Cl, Br, CN og C₁₋₄ alkyl.

12. Forbindelse ifølge krav 10 som har formel (VIII):



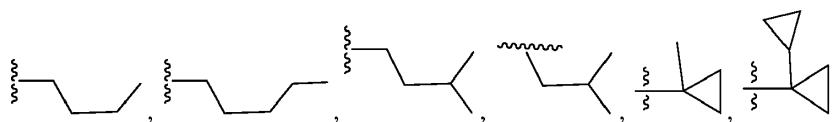
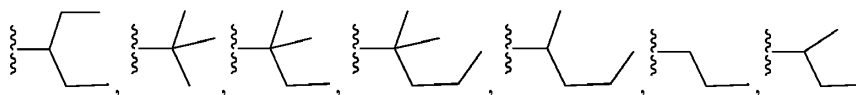
eller en enantiomer, en diastereomer, en stereoisomer, et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor

R₂ er uavhengig valgt fra CH₃ og CD₃;

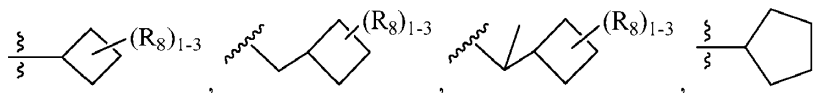
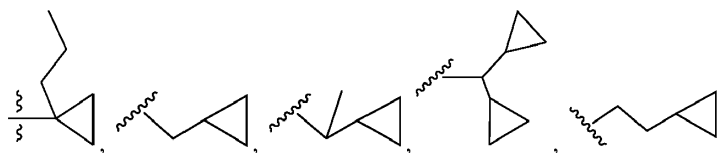
5 R₁₃ er uavhengig valgt fra H og CH₃;

R₃ er uavhengig valgt fra H og CH₃;

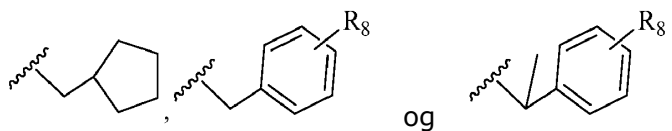
R₄ er uavhengig valgt fra



10



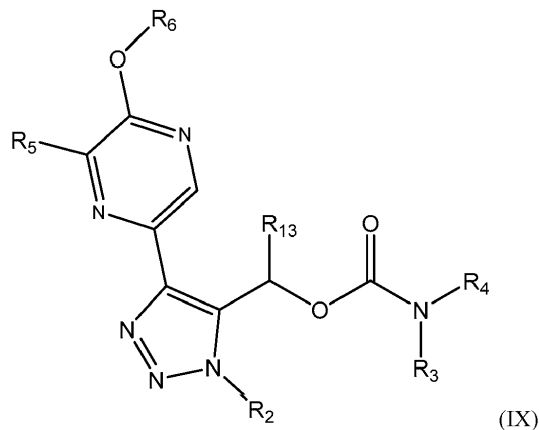
15



R₅ er uavhengig valgt fra H, F og CH₃; og

R₈ er uafhængig valgt fra H, F, Cl, Br, CN og C₁₋₄ alkyl.

13. Forbindelse ifølge krav 4 som har formel (IX):



5 eller en enantiomer, en diastereomer, en stereoisomer, et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor

R₂ er uafhængig valgt fra CH₃ og CD₃;

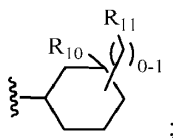
R₁₃ er uafhængig valgt fra H og C₁₋₄ alkyl;

R₃ er uafhængig valgt fra H og C₁₋₄ alkyl;

10 R₄ er uafhængig valgt fra C₁₋₆ alkyl substitueret med 1-3 R₉, (CR₇R₇)_r-C₃₋₆ sykloalkyl substitueret med 1-3 R₈, og -(CR₇R₇)_r-aryl substitueret med 1-3 R₈;

R₅ er uafhængig valgt fra H, F, Cl, CN og C₁₋₄ alkyl;

R₆ er



15 R₇ er uafhængig valgt fra H, C₁₋₄ alkyl og C₃₋₆ sykloalkyl; eller R₇ og R₇, sammen med karbonatomet som de begge er bundet til, danner en C₃₋₆ sykloalkylring;

R₈ er uafhængig valgt fra H, C₁₋₆ alkyl substitueret med 1-5 R₉, C₃₋₆ sykloalkyl, F, Cl, Br, CN, =O og COOH;

R₉ er uafhængig valgt fra H, F, Cl, NH₂, OH, OC₁₋₅ alkyl, C₁₋₅ alkyl, C₃₋₆ sykloalkyl og feny, hvor når R₉ er Cl, NH₂ eller OH, det er ikke substitueret på C₁ av alkylen som det er bundet til;

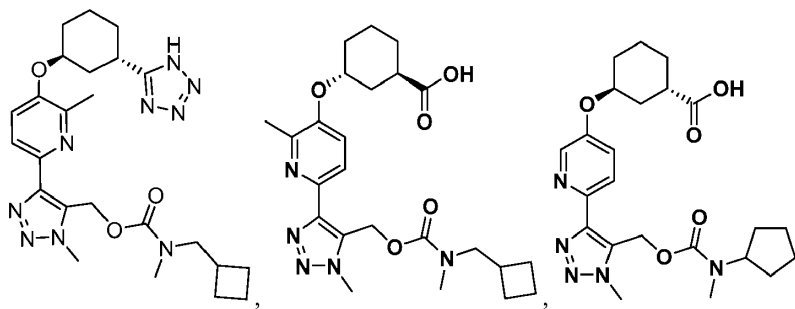
R₁₀ er uafhængig valgt fra H og F;

5 R₁₁ er uafhængig valgt fra -C(=O)R₁₂ og tetrazoly;

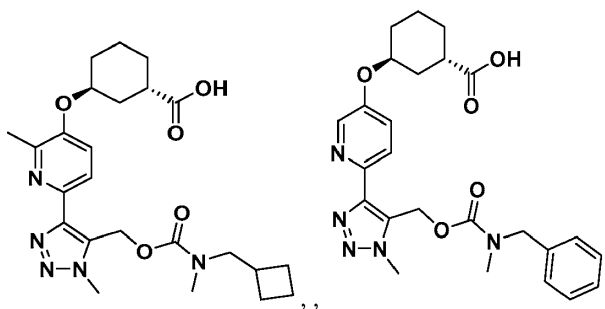
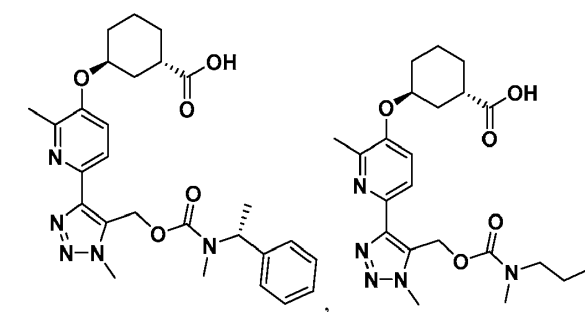
R₁₂ er uafhængig valgt fra OH og -C(=O)NHSO₂Me; og

r er uafhængig valgt fra null, 1, 2, 3 og 4.

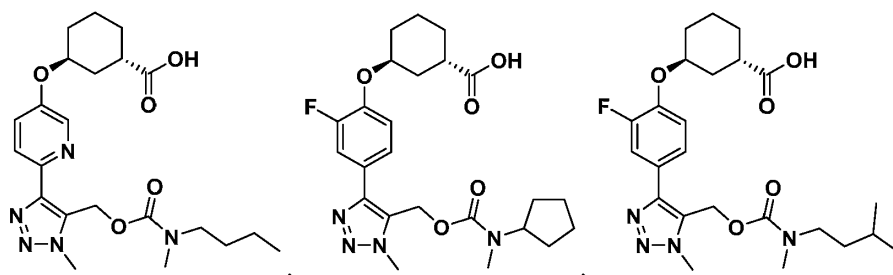
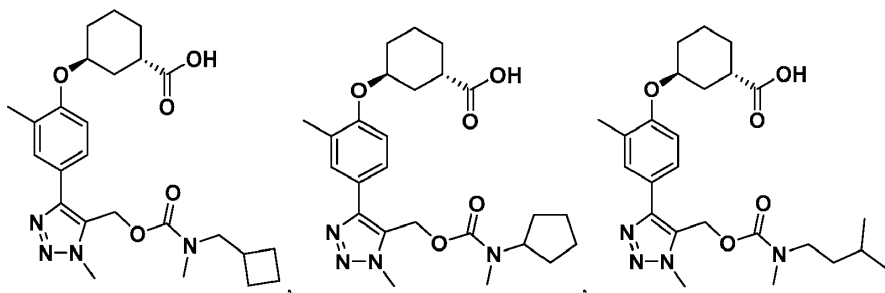
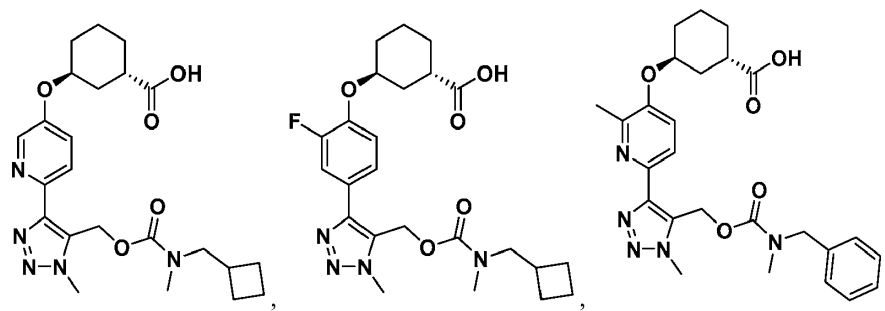
14. Forbindelse ifølge krav 4, hvor forbindelsen er valgt fra gruppen av:



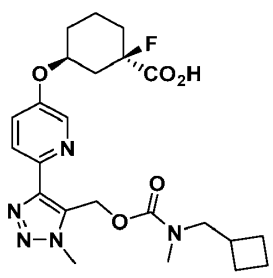
10



15



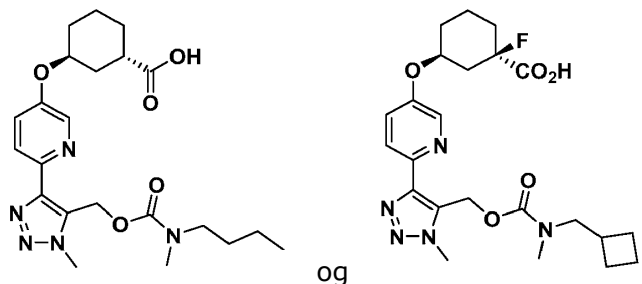
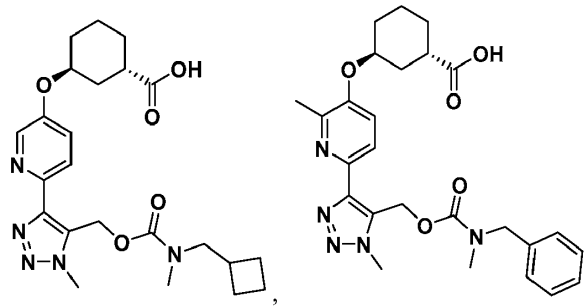
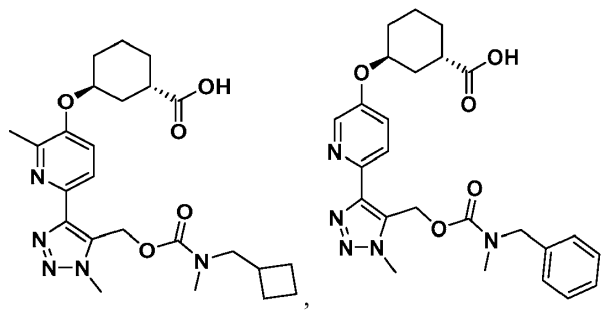
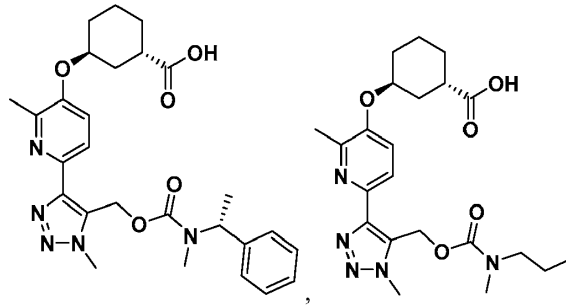
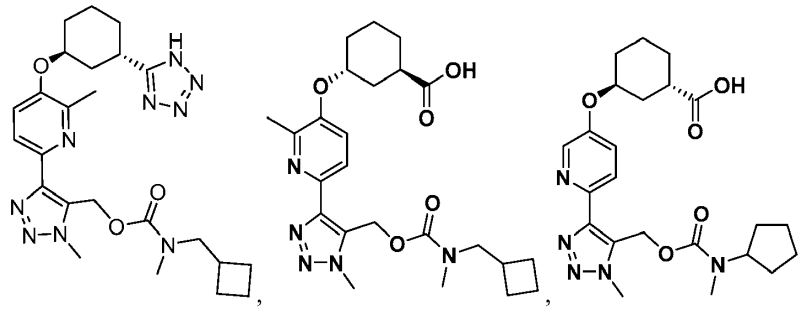
5



eller en enantiomer, en diastereomer, en stereoisomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

10

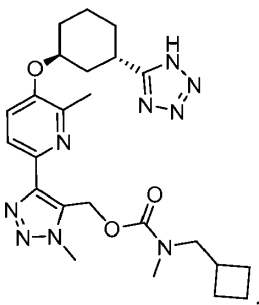
15. Forbindelse ifølge krav 4, hvor forbindelsen er valgt fra gruppen av:



og

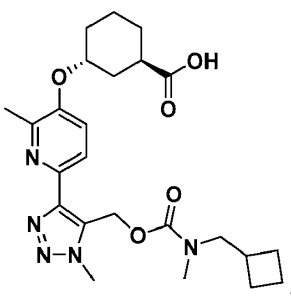
- 10 eller en enantiomer, en diastereomer, en stereoisomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt deriv.

16. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-8, hvor forbindelsen har formelen:



5 en enantiomer, en diastereomer, en stereoisomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

17. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-8, hvor forbindelsen har formelen:

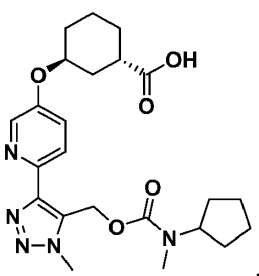


10

en enantiomer, en diastereomer, en stereoisomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

18. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-8, hvor forbindelsen har formelen:

15

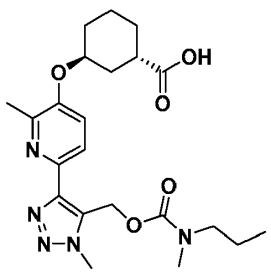


en enantiomer, en diastereomer, en stereoisomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

20

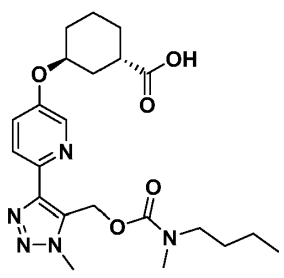
19. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-8, hvor forbindelsen har formelen:

19



en enantiomer, en diastereomer, en stereoisomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

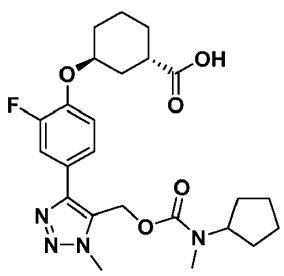
- 5 20. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-8, hvor forbindelsen har formelen:



en enantiomer, en diastereomer, en stereoisomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

10

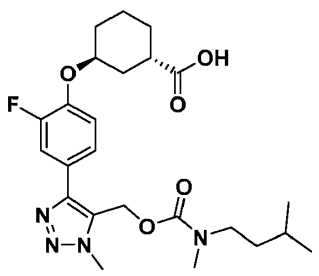
21. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-8, hvor forbindelsen har formelen:



en enantiomer, en diastereomer, en stereoisomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

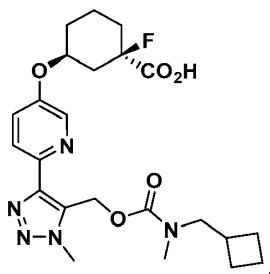
15

22. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-8, hvor forbindelsen har formelen:



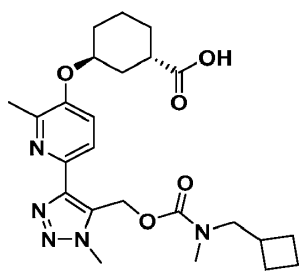
en enantiomer, en diastereomer, en stereoisomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

23. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-8, hvor forbindelsen har formelen:



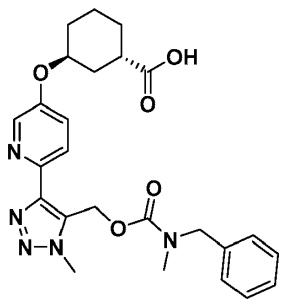
eller en enantiomer, en diastereomer, en stereoisomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

24. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-8, hvor forbindelsen har formelen:



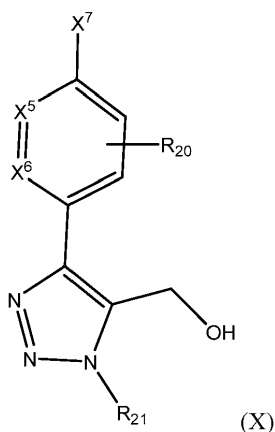
en enantiomer, en diastereomer, en stereoisomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

25. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-8, hvor forbindelsen har formelen:



en enantiomer, en diastereomer, en stereoisomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

26. En forbindelse med formel (X):



eller en enantiomer, en diastereomer eller en stereoisomer derav, hvor

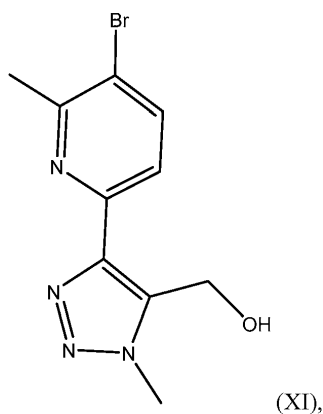
R₂₀ er uafhængig C₁₋₆ alkyl eller H;

R₂₁ er uafhængig C₁₋₆ alkyl eller H;

5 X⁵ og X⁶ uafhængig er CH eller N; og

X⁷ er Br.

27. Forbindelse ifølge krav 26 som har formel (XI):



10 eller en enantiomer, en diastereomer eller en stereoisomer derav.

28. Farmasøytisk sammensætning som omfatter en eller flere forbindelser ifølge et hvilket som helst av kravene 1-25 og en farmasøytisk akseptabel bærer eller fortynningsmiddel.

15 29. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-25 for anvendelse i terapi.

30. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-25 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse i behandling av fibrose hos et pattedyr som trenger det.

31. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-25 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse i behandling av lungefibrose (idiopatisk lungefibrose), astma, kronisk obstruktiv lungesykdom (KOLS), nyrefibrose, akutt
5 nyreskade, kronisk nyresykdom, leverfibrose (ikke-alkoholisk steatohepatitt), hudfibrose, fibrose i tarmen, brystkreft, kreft i bukspyttkjertelen, kreft i eggstokkene, prostatakreft, glioblastom, beinkreft, tykktarmskreft, tarmkreft, kreft i hodet og nakken, melanom, myelomatose, kronisk lymfocytisk leukemi, kreftsmerter, tumormetastase, transplantasjonsorganavstøtning, sklerodermi, okulær fibrose, aldersrelatert makulær
10 degenerasjon (AMD), diabetisk retinopati, kollagen vaskulær sykdom, åreforkalkning, Raynauds fenomen, eller nevropatisk smerte hos et pattedyr med behov for dette.