



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3504210 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 473/24 (2006.01)
A61K 31/522 (2006.01)
A61P 31/00 (2006.01)
A61P 31/20 (2006.01)
A61P 37/04 (2006.01)
A61P 43/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

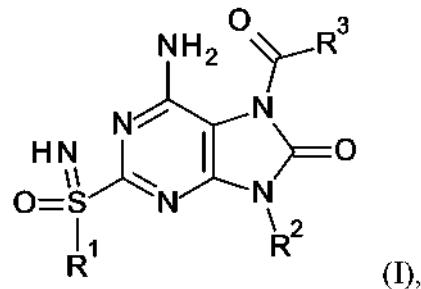
| | | |
|------|--|---|
| (45) | Translation Published | 2021.05.03 |
| (80) | Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent | 2021.02.24 |
| (86) | European Application Nr. | 17758527.0 |
| (86) | European Filing Date | 2017.08.28 |
| (87) | The European Application's Publication Date | 2019.07.03 |
| (30) | Priority | 2016.08.29, WO, PCT/CN16/097140 2017.07.12, WO, PCT/CN17/092653 |
| (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 Validation States: | MA |
| (73) | Proprietor | F. Hoffmann-La Roche AG, Grenzacherstrasse 124, 4070 Basel, Sveits |
| (72) | Inventor | GAO, Lu, Building 5 No. 720 Cailun Road, Shanghai 201203, Kina LIANG, Chungen, Building 5 No. 720 Cailun Road, Shanghai 201203, Kina YUN, Hongying, Building 5 No. 720 Cailun Road, Shanghai 201203, Kina ZHENG, Xiufang, Building 5 No. 720 Cailun Road, Shanghai 201203, Kina WANG, Jianping, Building 5 No. 720 Cailun Road, Shanghai 201203, Kina MIAO, Kun, Building 5 No. 720 Cailun Road, Shanghai 201203, Kina ZHANG, Bo, Building 5 No. 720 Cailun Road, Shanghai 201203, Kina |
| (74) | Agent or Attorney | PLOUGMANN VINGTOFT, Postboks 1003 Sentrum, 0104 OSLO, Norge |

| | | |
|------|-------------------|--|
| (54) | Title | 7-SUBSTITUTED SULFONIMIDOYL PURINONE COMPOUNDS FOR THE TREATMENT AND PROPHYLAXIS OF VIRUS INFECTION |
| (56) | References Cited: | WO-A1-2009/005687 US-A1- 2010 143 301 WO-A1-2016/180695 |

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 ifølge formel (I),



hvor

R¹ er C_{1–6}alkyl;

R² er benzyl, hvor nevnte benzyl er usubstituert eller substituert med én, to eller tre substituenter uavhengig valgt fra halogen og C_{1–6}alkyl;

R³ er –NR⁴R⁵, hvor

R⁴ er C_{1–6}alkyl eller C_{1–6}alkoksyC_{1–6}alkyl;

R⁵ er (C_{1–6}alkyl)₂NCOOC_{1–6}alkyl, C_{1–6}alkoksyC_{1–6}alkyl,

C_{1–6}alkoksykarbonyl(C_{1–6}alkyl)aminoC_{1–6}alkyl,

C_{1–6}alkoksykarbonyl(fenyl)C_{1–6}alkyl, C_{1–6}alkoksykarbonylC_{1–6}alkyl,

C_{1–6}alkoksykarbonyloksyC_{1–6}alkyl,

C_{1–6}alkyl,

C_{1–6}alkylkarbonyl(C_{1–6}alkyl)aminoC_{1–6}alkyl

eller

pyrrolidinylkarbamoyloksyC_{1–6}alkyl; eller

R⁴ og R⁵ sammen med nitrogenet de er festet til danner et heterosyklyl; eller farmasøytisk akseptabelt salt, enantiomer eller diastereomer derav; med forbehold om at

6-amino-9-benzyl-2-(propylsulfonimidoyl)-7-(pyrrolidin-1-karbonyl)purin-8-on;

6-amino-9-benzyl-7-(piperidin-1-karbonyl)-2-(propylsulfonimidoyl)purin-8-on;

6-amino-9-benzyl-7-(morpholin-4-karbonyl)-2-(propylsulfonimidoyl)purin-8-on;

6-amino-9-benzyl-7-(3,3-dimethylpyrrolidin-1-karbonyl)-2-(propylsulfonimidoyl)purin-8-on;

etyl-1-[6-amino-9-benzyl-8-okso-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karbonyl]pyrrolidin-2-karboksylat;

6-amino-7-(2-azaspiro[3.3]heptan-2-karbonyl)-9-benzyl-2-(propylsulfonimidoyl)purin-8-on;

6-amino-9-benzyl-7-(2-oksa-6-azaspiro[3.3]heptan-6-karbonyl)-2-(propylsulfonimidoyl)purin-8-on;

6-amino-9-benzyl-7-(3,3-difluoropyrrolidin-1-karbonyl)-2-(propylsulfonimidoyl)purin-8-on;

6-amino-9-benzyl-7-(3-fluor-3-metyl-pyrrolidin-1-karbonyl)-2-(propylsulfonimidoyl)purin-8-on;

og deres enantiomerer eller diastereomerer er ekskludert.

2. Forbindelse ifølge krav 1, hvor

R^1 er C_{1-6} alkyl;

R^2 er benzyl, hvor nevnte benzyl er usubstituert eller substituert med halogen eller C_{1-6} alkyl;

R^3 er azetidinyl;

piperazinyl substituert med C_{1-6} alkyl;

piperidinyl substituert med piperidinyl;

pyrrolidinyl; eller

$-NR^4R^5$, hvor

R^4 er C_{1-6} alkyl eller C_{1-6} alkoksy C_{1-6} alkyl;

R^5 er $(C_{1-6}$ alkyl) $_2$ NCOOC C_{1-6} alkyl, C_{1-6} alkoksy C_{1-6} alkyl,

C_{1-6} alkoksykarbonyl(C_{1-6} alkyl)amino C_{1-6} alkyl,

C_{1-6} alkoksykarbonylfenyl C_{1-6} alkyl, C_{1-6} alkoksykarbonyl C_{1-6} alkyl,

C_{1-6} alkoksykarbonyloksy C_{1-6} alkyl,

C_{1-6} alkylkarbonyl(C_{1-6} alkyl)amino C_{1-6} alkyl eller

pyrrolidinylkarbamoyloksy C_{1-6} alkyl.

3. Forbindelse ifølge krav 1 eller 2, hvor

R^1 er etyl eller propyl;

R^2 er benzyl, brombenzyl, klorbenzyl, fluorbenzyl eller metylbenzyl;

R^3 er azetidinyl;

4-metylpirazinyl;

piperidinylpiperidinyl;

pyrrolidinyl; eller

$-NR^4R^5$, hvor

R^4 er methyl, etyl, propyl eller metoksyethyl;

R^5 er acetyl(methyl)aminoethyl, butyl, butyl(methyl)karbamoyloksyethyl,

dietylkarbamoyloksyethyl, etoksykarbonyl(methyl)aminoethyl, etoksykarbonyletyl,

etoksykarbonylisobutyl, etoksykarbonylisopentyl, etoksykarbonylmetyl,
 etoksykarbonyloksyetyl, etoksykarbonyl(fenyl)etyl, etyl, isobutyl,
 isopropoksykarbonylisopentyl, isopropoksykarbonyl(fenyl)etyl, isopropyl,
 metoksykarbonyl(metyl)aminoethyl, metoksyethyl, metoksypropyl, propyl,
 propyl(metyl)karbamoyloksyetyl, pyrrolidinylkarbamoyloksyetyl, tert-
 butoksykarbonyl(metyl)aminoethyl, tert-butoxyskarbonyletyl, tert-
 butoksykarbonylisopentyl eller tert-butoxyskarbonyl(fenyl)etyl.

4. Forbindelse ifølge krav 3, hvor R³ er azetidinyl, 4-metylpirazinyl,
 piperidinylpiperidinyl, pyrrolidinyl, acetyl(metyl)aminoethyl(metyl)amino,
 bis(metoksyethyl)amino, butyl(etyl)amino, butyl(metyl)amino,
 butyl(metyl)karbamoyloksyetyl(metyl)amino,
 dietylkarbamoyloksyetyl(metyl)amino,
 etoksykarbonyl(metyl)aminoethyl(metyl)amino,
 etoksykarbonyletyl(metyl)amino, etoksykarbonylisobutyl(metyl)amino,
 etoksykarbonylisopentyl(metyl)amino, etoksykarbonylmetyl(metyl)amino,
 etoksykarbonyloksyetyl(metyl)amino, etoksykarbonyl(fenyl)etyl(metyl)amino,
 etyl(metyl)amino, isobutyl(metyl)amino,
 isopropoksykarbonylisopentyl(metyl)amino,
 isopropoksykarbonyl(fenyl)etyl(metyl)amino, isopropyl(metyl)amino,
 metoksykarbonyl(metyl)aminoethyl(metyl)amino, metoksyethyl(etyl)amino,
 metoksyethyl(metyl)amino, metoksyethyl(propyl)amino,
 metoksypropyl(metyl)amino, propyl(etyl)amino, propyl(metyl)amino,
 propyl(metyl)karbamoyloksyetyl(metyl)amino,
 pyrrolidinylkarbamoyloksyetyl(metyl)amino, tert-
 butoksykarbonyl(metyl)aminoethyl(metyl)amino, tert-
 butoksykarbonyletyl(metyl)amino, tert-butoxyskarbonylisopentyl(metyl)amino
 eller tert-butoxyskarbonyl(fenyl)etyl(metyl)amino.

5. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, hvor R¹ er etyl.

6. Forbindelse ifølge krav 1 eller 2, hvor R² er benzyl substituert med halogen
 eller C₁₋₆alkyl.

7. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 2 til 6, hvor R² er
 brombenzyl, klorbenzyl, fluorbenzyl eller methylbenzyl.

8. Forbindelse ifølge krav 7, hvor R² er brombenzyl, klorbenzyl eller fluorbenzyl.

9. Forbindelse ifølge krav 1 eller 2, hvor R³ er -NR⁴R⁵, hvor R⁴ er C₁₋₆alkyl, R⁵

er C₁₋₆alkyl.

10. Forbindelse ifølge krav 9, hvor R³ er propyl(metyl)amino eller etyl(metyl)amino.

11. Forbindelse ifølge krav 1, valgt fra:

6-amino-9-benzyl-N-metyl-8-okso-N-propyl-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karboksamid;

6-amino-9-benzyl-N-(2-metoksyethyl)-N-metyl-8-okso-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karboksamid;

6-amino-9-benzyl-N-etil-8-okso-N-propyl-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karboksamid;

6-amino-9-benzyl-7-[4-(1-piperidyl)piperidin-1-karbonyl]-2-(propylsulfonimidoyl)purin-8-on;

6-amino-9-benzyl-N-etil-N-(2-metoksyethyl)-8-okso-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karboksamid;

6-amino-9-benzyl-N-butyl-N-etil-8-okso-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karboksamid;

6-amino-9-benzyl-N-(2-metoksyethyl)-8-okso-N-propyl-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karboksamid;

6-amino-9-benzyl-N,N-bis(2-metoksyethyl)-8-okso-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karboksamid;

6-amino-7-(azetidin-1-karbonyl)-9-benzyl-2-(propylsulfonimidoyl)purin-8-on;

6-amino-9-benzyl-N-isopropyl-N-metyl-8-okso-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karboksamid;

6-amino-9-benzyl-7-(4-metylpirazin-1-karbonyl)-2-(propylsulfonimidoyl)purin-8-on;

6-amino-9-benzyl-N-(3-metoksypropyl)-N-metyl-8-okso-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karboksamid;

6-amino-9-benzyl-N-isobutyl-N-metyl-8-okso-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karboksamid;

Etyl-2-[[6-amino-9-benzyl-8-okso-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karbonyl]-metyl-amino]acetat;

Etyl-3-[[6-amino-9-benzyl-8-okso-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karbonyl]-metyl-amino]propanoat;

tert-butyl-3-[[6-amino-9-benzyl-8-okso-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-

karbonyl]-metyl-amino]propanoat;
Etyl-(2S)-2-[[6-amino-9-benzyl-8-okso-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karbonyl]-metyl-amino]propanoat;
tert-butyl-(2S)-2-[[6-amino-9-benzyl-8-okso-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karbonyl]-metyl-amino]-4-methyl-pentanoat;
Isopropyl-(2S)-2-[[6-amino-9-benzyl-8-okso-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karbonyl]-metyl-amino]-4-methyl-pentanoat;
Etyl-(2S)-2-[[6-amino-9-benzyl-8-okso-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karbonyl]-metyl-amino]-3-methyl-butanoat;
Etyl-(2S)-2-[[6-amino-9-benzyl-8-okso-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karbonyl]-metyl-amino]-4-methyl-pentanoat;
Etyl-(2S)-2-[[6-amino-9-benzyl-8-okso-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karbonyl]-metyl-amino]-3-fenyl-propanoat;
Isopropyl-(2S)-2-[[6-amino-9-benzyl-8-okso-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karbonyl]-metyl-amino]-3-fenyl-propanoat;
tert-butyl-(2S)-2-[[6-amino-9-benzyl-8-okso-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karbonyl]-metyl-amino]-3-fenyl-propanoat;
N-[2-[acetyl(metyl)amino]etyl]-6-amino-9-benzyl-*N*-metyl-8-okso-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karboksamid;
Metyl-*N*-[2-[[6-amino-9-benzyl-8-okso-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karbonyl]-metyl-amino]etyl]-*N*-methyl-karbamat;
tert-butyl-*N*-[2-[[6-amino-9-benzyl-8-okso-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karbonyl]-metyl-amino]etyl]-*N*-methyl-karbamat;
Etyl-*N*-[2-[[6-amino-9-benzyl-8-okso-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karbonyl]-metyl-amino]etyl]-*N*-methyl-karbamat;
2-[[6-amino-9-benzyl-8-okso-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karbonyl]-metyl-amino]etyl-*N*-butyl-*N*-methyl-karbamat;
2-[[6-amino-9-benzyl-8-okso-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karbonyl]-metyl-amino]etyl pyrrolidin-1-karboksylat;
2-[[6-amino-9-benzyl-8-okso-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karbonyl]-metyl-amino]etyl-*N*-methyl-*N*-propyl-karbamat;
2-[[6-amino-9-benzyl-8-okso-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karbonyl]-metyl-amino]etyl-*N,N*-dietylkarbamat;
2-[[6-amino-9-benzyl-8-okso-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karbonyl]-metyl-

amino]etyl-etylkarbonat;
6-amino-N-butyl-9-[(4-klorfenyl)metyl]-N-metyl-8-okso-2-[S(S)-propylsulfonimidoyl]purin-7-karboksamid;
6-amino-N-butyl-9-[(4-klorfenyl)metyl]-N-metyl-8-okso-2-[S(S)-propylsulfonimidoyl]purin-7-karboksamid;
6-amino-9-[(4-klorfenyl)metyl]-N-etyl-N-metyl-8-okso-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karboksamid;
6-amino-N-metyl-8-okso-N-propyl-2[S(S)-propylsulfonimidoyl]-9-(p-tolylmetyl)purin-7-karboksamid;
6-amino-N-metyl-8-okso-N-propyl-2[S(R)-propylsulfonimidoyl]-9-(p-tolylmetyl)purin-7-karboksamid;
6-amino-2-[S(S)-propylsulfonimidoyl]-9-(p-tolylmetyl)-7-(pyrrolidin-1-karbonyl)purin-8-on;
6-amino-2-[S(R)-propylsulfonimidoyl]-9-(p-tolylmetyl)-7-(pyrrolidin-1-karbonyl)purin-8-on;
6-amino-N-(2-metoksyethyl)-N-metyl-8-okso-2-[S(S)-propylsulfonimidoyl]-9-(p-tolylmetyl)purin-7-karboksamid;
6-amino-N-(2-metoksyethyl)-N-metyl-8-okso-2-[S(R)-propylsulfonimidoyl]-9-(p-tolylmetyl)purin-7-karboksamid;
6-amino-N-etyl-N-metyl-8-okso-2-(propylsulfonimidoyl)-9-(p-tolylmetyl)purin-7-karboksamid;
6-amino-N-butyl-N-metyl-8-okso-2-(propylsulfonimidoyl)-9-(p-tolylmetyl)purin-7-karboksamid;
6-amino-9-[(4-klorfenyl)metyl]-2-[S(R)-etyl sulfonimidoyl]-N-metyl-8-okso-N-propyl-purin-7-karboksamid;
6-amino-9-[(4-klorfenyl)metyl]-2-[S(S)-etyl sulfonimidoyl]-N-metyl-8-okso-N-propyl-purin-7-karboksamid;
6-amino-9-[(4-klorfenyl)metyl]-N-etyl-2[S(S)-etyl sulfonimidoyl]-N-metyl-8-okso-purin-7-karboksamid;
6-amino-9-[(4-klorfenyl)metyl]-N-etyl-2-[S(R)-etyl sulfonimidoyl]-N-metyl-8-okso-purin-7-karboksamid;
6-amino-2-[S(S)-etyl sulfonimidoyl]-N-metyl-8-okso-N-propyl-9-(p-tolylmetyl)purin-7-karboksamid;
6-amino-2-[S(R)-etyl sulfonimidoyl]-N-metyl-8-okso-N-propyl-9-(p-

tolylmetyl)purin-7-karboksamid;
6-amino-*N*-etyl-2-[S(*S*)-ethylsulfonimidoyl]-*N*-metyl-8-*okso*-9-(*p*-tolylmetyl)purin-7-karboksamid;
6-amino-*N*-etyl-2-[S(*R*)-ethylsulfonimidoyl]-*N*-metyl-8-*okso*-9-(*p*-tolylmetyl)purin-7-karboksamid;
6-amino-2-[S(*S*)ethylsulfonimidoyl]-9-[(4-fluorfenyl)metyl]-*N*-metyl-8-*okso*-*N*-propyl-purin-7-karboksamid;
6-amino-2-[S(*R*)ethylsulfonimidoyl]-9-[(4-fluorfenyl)metyl]-*N*-methyl-8-*okso*-*N*-propyl-purin-7-karboksamid;
6-amino-*N*-etyl-2-(ethylsulfonimidoyl)-9-[(4-fluorfenyl)metyl]-*N*-methyl-8-*okso*-purin-7-karboksamid;
6-amino-*N*-etyl-2-[S(*S*)-(ethylsulfonimidoyl)]-9-[(4-fluorfenyl)metyl]-*N*-methyl-8-*okso*-purin-7-karboksamid;
6-amino-*N*-etyl-2-[S(*R*)-(ethylsulfonimidoyl)]-9-[(4-fluorfenyl)metyl]-*N*-methyl-8-*okso*-purin-7-karboksamid;
6-amino-9-[(4-bromfenyl)metyl]-2-(ethylsulfonimidoyl)-*N*-methyl-8-*okso*-*N*-propyl-purin-7-karboksamid;
6-amino-2-[S(*R*)-ethylsulfonimidoyl]-9-[(4-bromfenyl)metyl]-*N*-methyl-8-*okso*-*N*-propyl-purin-7-karboksamid;
6-amino-2-[S(*S*)-ethylsulfonimidoyl]-9-[(4-bromfenyl)metyl]-*N*-methyl-8-*okso*-*N*-propyl-purin-7-karboksamid;
6-amino-9-[(4-bromfenyl)metyl]-*N*-etyl-2-(ethylsulfonimidoyl)-*N*-methyl-8-*okso*-purin-7-karboksamid;
6-amino-9-[(4-bromfenyl)metyl]-*N*-etyl-2-[S(*S*)-(ethylsulfonimidoyl)]-*N*-methyl-8-*okso*-purin-7-karboksamid; og
6-amino-9-[(4-bromfenyl)metyl]-*N*-etyl-2-[S(*R*)-(ethylsulfonimidoyl)]-*N*-methyl-8-*okso*-purin-7-karboksamid;

eller farmasøytisk akseptabelt salt, enantiomer eller diastereomer derav.

12. Forbindelse ifølge krav 11, valgt fra:

6-amino-9-benzyl-*N*-metyl-8-*okso*-*N*-propyl-2-(propylsulfonimidoyl)purin-7-karboksamid;
6-amino-9-[(4-klorfenyl)metyl]-2-[S(*R*)-ethylsulfonimidoyl]-*N*-methyl-8-*okso*-*N*-propyl-purin-7-karboksamid;
6-amino-9-[(4-klorfenyl)metyl]-2-[S(*S*)-ethylsulfonimidoyl]-*N*-methyl-8-*okso*-*N*-

propyl-purin-7-karboksamid;

6-amino-9-[(4-klorfenyl)metyl]-N-etyl-2-[S(S)-etylulfonimidoyl]-N-metyl-8-*okso*-purin-7-karboksamid;

6-amino-9-[(4-klorfenyl)metyl]-N-etyl-2-[S(R)-etylulfonimidoyl]-N-metyl-8-*okso*-purin-7-karboksamid;

6-amino-2-[S(S)-etylulfonimidoyl]-N-metyl-8-*okso*-N-propyl-9-(*p*-tolylmetyl)purin-7-karboksamid;

6-amino-2-[S(R)-etylulfonimidoyl]-N-metyl-8-*okso*-N-propyl-9-(*p*-tolylmetyl)purin-7-karboksamid;

6-amino-N-etyl-2-[S(S)-etylulfonimidoyl]-N-metyl-8-*okso*-9-(*p*-tolylmetyl)purin-7-karboksamid;

6-amino-N-etyl-2-[S(R)-etylulfonimidoyl]-N-metyl-8-*okso*-9-(*p*-tolylmetyl)purin-7-karboksamid;

6-amino-2-(etylulfonimidoyl)-9-[(4-fluorfenyl)metyl]-N-metyl-8-*okso*-N-propyl-purin-7-karboksamid;

6-amino-2-[S(S)etylulfonimidoyl]-9-[(4-fluorfenyl)metyl]-N-metyl-8-*okso*-N-propyl-purin-7-karboksamid; og

6-amino-2-[S(R)etylulfonimidoyl]-9-[(4-fluorfenyl)metyl]-N-metyl-8-*okso*-N-propyl-purin-7-karboksamid;

eller farmasøytisk akseptabelt salt, enantiomer eller diastereomer derav.

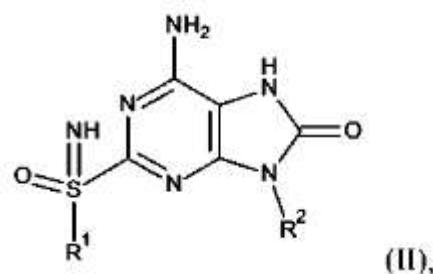
13. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 11 og 12, hvor forbindelsen er:

6-amino-9-[(4-klorfenyl)metyl]-N-etyl-2-[S(R)-etylulfonimidoyl]-N-metyl-8-*okso*-purin-7-karboksamid

eller farmasøytisk akseptabelt salt, enantiomer eller diastereomer derav.

14. Fremgangsmåte for fremstilling av en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 13, som omfatter det følgende trinnet:

omsetning av en forbindelse ifølge formel (II),



med karbamoylklorid i nærvær av en blandet base;
hvor den blandede basen er pyridin og trietylamin, pyridin og DIPEA, DMAP og
trietylamin, eller DMAP og DIPEA; R¹ og R² er definert som i et hvilket som helst
av kravene 1 til 13.

15. Forbindelse eller farmasøytisk akseptabelt salt, enantiomer eller
diastereomer ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 13, for anvendelse som
terapeutisk aktivt stoff.

16. Farmasøytisk sammensetning som omfatter en forbindelse i samsvar med
et hvilket som helst av kravene 1 til 13, og en terapeutisk inert bærer.

17. Forbindelse eller farmasøytisk akseptabelt salt, enantiomer eller
diastereomer ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 13, for behandling eller
profylakse av hepatitt B-virusinfeksjon.