



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3873897 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

<i>C07D 405/04 (2006.01)</i>	<i>C07D 311/94 (2006.01)</i>
<i>A61K 31/4709 (2006.01)</i>	<i>C07D 319/18 (2006.01)</i>
<i>A61P 29/00 (2006.01)</i>	<i>C07D 321/10 (2006.01)</i>
<i>C07C 233/87 (2006.01)</i>	<i>C07D 401/04 (2006.01)</i>
<i>C07D 215/12 (2006.01)</i>	<i>C07D 401/12 (2006.01)</i>
<i>C07D 215/227 (2006.01)</i>	<i>C07D 405/12 (2006.01)</i>
<i>C07D 265/36 (2006.01)</i>	<i>C07D 413/12 (2006.01)</i>
<i>C07D 307/87 (2006.01)</i>	<i>C07D 413/14 (2006.01)</i>
<i>C07D 311/04 (2006.01)</i>	<i>C07D 471/04 (2006.01)</i>
<i>C07D 311/58 (2006.01)</i>	

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2024.10.07
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2024.08.14
(86)	European Application Nr.	19805082.5
(86)	European Filing Date	2019.10.29
(87)	The European Application's Publication Date	2021.09.08
(30)	Priority	2018.10.30, US, 201862752859 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
(73)	Proprietor	GILEAD SCIENCES, INC., 333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA
(72)	Inventor	BLOMGREN, Peter A., c/o Gilead Sciences, Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA CAMPBELL, Taryn, c/o Gilead Sciences, Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA CHANDRASEKHAR, Jayaraman, c/o Gilead Sciences, Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA CLARK, Christopher T., c/o Gilead Sciences, Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA CODELLI, Julian A., c/o Gilead Sciences, Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA CURRIE, Kevin S., c/o Gilead Sciences, Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA KROPF, Jeffrey E., c/o Gilead Sciences, Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA MOAZAMI, Yasamin, c/o Gilead Sciences, Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA NAVA, Nicole, c/o Gilead Sciences, Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA PATEL, Leena, c/o Gilead Sciences, Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City, California 94404, USA PERREAULT, Stephane, c/o Gilead Sciences, Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City,

California 94404, USA
 PERRY, Jason K., c/o Gilead Sciences, Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City,
 California 94404, USA
 SEDILLO, Kassandra F., 12 Lawrence Drive Apt. 308, Princeton, New Jersey
 08540, USA
 SEEGER, Natalie, 21 W. Hartwell Ave., Salt Lake City, Utah 84115, USA
 STEVENS, Kirk L., c/o Gilead Sciences, Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City,
 California 94404, USA
 TREIBERG, Jennifer Anne, c/o Gilead Sciences, Inc. 333 Lakeside Drive, Foster
 City, California 94404, USA
 YEUNG, Suet C., c/o Gilead Sciences, Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City,
 California 94404, USA
 ZHAO, Zhongdong, c/o Gilead Sciences, Inc. 333 Lakeside Drive, Foster City,
 California 94404, USA

(74) Agent or Attorney ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54)	Title	N-BENZOYL-PHENYLALANINE DERIVATIVES AS ALPHA4BETA7 INTEGRIN INHIBITORS FOR TREATING INFLAMMATORY DISEASES
(56)	References Cited:	WO-A1-01/21584 WO-A1-99/36393 SIRCAR ILA ET AL: "Synthesis and SAR of N-Benzoyl-L-Biphenylalanine Derivatives: Discovery of TR-14035, A Dual alpha4beta7/alpha4beta1 Integrin Antagonist", BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY, vol. 10, no. 6, 2002, pages 2051 - 2066, XP002436680, ISSN: 0968-0896, DOI: 10.1016/S0968-0896(02)00021-4

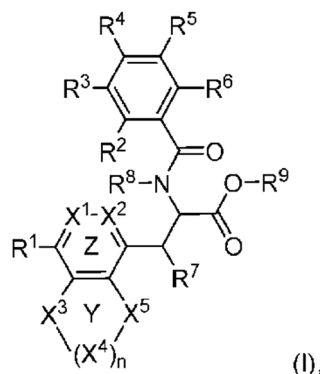
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters 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/>

3873897

1

Patentkrav

1. Forbindelse med formel (I):



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor:

- 5 hver av X^1 og X^2 uavhengig er valgt fra CR^{10} og N;
 hver av X^3 og X^5 uavhengig er valgt fra NR^{11} , O, S, C(O) og $C(R^{10})_2$;
 hver X^4 uavhengig er valgt fra NR^{11} , O, S, C(O) og $C(R^{10})_2$;
 R^1 er valgt fra $-L-A^1$, $-L-A^2$, $-L-A^3$ og $-L-A^4$;
 L er valgt fra en binding, $-O-$, $-O-C(O)-^*$, $-NH-$, $-C(O)-N(H)-^*$ og $-N(H)-C(O)-^*$;
 10 hvor * angir et tilknytningspunkt av L til A^1 , A^2 , A^3 eller A^4 ;
 A^1 er C_{6-10} -aryl, eventuelt substituert med én til seks R^a ;
 A^2 er 5-10-leddet heteroaryl som inneholder ett til fem heteroatomer uavhengig
 valgt fra S, N og O, og eventuelt én eller to C(O); hvor A^2 eventuelt er substituert med
 én til seks R^a ;
 15 A^3 er 5-10-leddet sykloalkyl eller 5-14-leddet heterosyklyl; hvor A^3 eventuelt er
 substituert med én til seks R^a ; og
 A^4 er $-NR^{a1}R^{a2}$;
 hvor hver R^a uavhengig er valgt fra halo, cyano, hydroksyl, $-NR^{a1}R^{a2}$, C_{1-6} -alkyl, C_{2-6} -
 alkenyl, C_{2-6} -alkynyl, C_{1-6} -alkoksyl, C_{1-6} -haloalkyl, C_{1-6} -haloalkoksyl, $-S(O)_m-C_{1-6}$ -alkyl, C_{3-}
 20 8 -sykloalkyl, 3-6-leddet heterosyklyl, C_{6-10} -aryl, 5-6-leddet heteroaryl, $-O-(3-6$ -leddet
 heterosyklyl), $-O-C_{1-4}$ -alkylen- C_{3-8} -sykloalkyl, $-O$ -fenyl og $-O-C_{3-8}$ -sykloalkyl;
 hvert C_{1-6} -alkyl, C_{2-6} -alkenyl, C_{2-6} -alkynyl, C_{1-6} -alkoksyl, C_{1-6} -haloalkyl, C_{1-6} -
 haloalkoksyl og $-S(O)_m-C_{1-6}$ -alkyl i R^a eventuelt er substituert med én til tre
 R^{a3} ; hvor hver R^{a3} uavhengig er valgt fra hydroksyl, cyano, $-NR^{a1}R^{a2}$, C_{1-6} -
 25 alkoksyl, C_{3-8} -sykloalkyl, fenyl og 3-6-leddet heterosyklyl; hvor hvert C_{3-8} -
 sykloalkyl, fenyl og 3-6-leddet heterosyklyl i R^{a3} uavhengig eventuelt er
 substituert med én til tre R^{a4} ; hvor hver R^{a4} uavhengig er valgt fra halo,

- cyano, hydroksyl, $-NR^{a1}R^{a2}$, C_{1-6} -alkyl, C_{1-6} -haloalkyl, C_{1-6} -alkoksyl, C_{1-6} -haloalkoksyl, C_{3-8} -sykloalkyl og 3-6-leddet heterosyklil; og
- hvert C_{3-8} -sykloalkyl, 3-6-leddet heterosyklil, C_{6-10} -aryl, 5-6-leddet heteroaryl, -O-(3-6-leddet heterosyklil), -O- C_{1-4} -alkylen- C_{3-8} -sykloalkyl, -O-fenyl og -O- C_{3-8} -sykloalkyl i R^a uavhengig eventuelt er substituert med én til tre grupper uavhengig valgt fra halo, cyano, hydroksyl, $-NR^{a1}R^{a2}$, C_{1-6} -alkyl, C_{1-6} -haloalkyl, C_{1-6} -alkoksyl og C_{1-6} -haloalkoksyl;
- hver R^2 , R^3 , R^4 , R^5 og R^6 uavhengig er valgt fra H, halo, cyano, hydroksyl, C_{1-6} -alkyl, C_{2-6} -alkenyl, C_{2-6} -alkynyl, C_{1-6} -alkoksyl, C_{1-8} -haloalkyl, C_{1-8} -haloalkoksyl, $-NR^{b1}R^{b2}$, $-R^{b3}S(O)_mR^{b4}$, $-S(O)_mR^{b4}$, $-NR^{b1}S(O)_nR^{b4}$, $-COOR^{b1}$, $-CONR^{b1}R^{b2}$, $-NR^{b1}COOR^{b2}$, $-NR^{b1}COR^{b4}$, $-R^{b3}NR^{b1}R^{b2}$, $-S(O)_nNR^{b1}R^{b2}$, C_{3-12} -sykloalkyl, C_{6-10} -aryl, 5-6-leddet heteroaryl og 3-12-leddet heterosyklil;
- hvert C_{1-6} -alkyl, C_{2-6} -alkenyl, C_{2-6} -alkynyl, C_{1-6} -alkoksyl, C_{1-8} -haloalkyl og C_{1-8} -haloalkoksyl i R^2 , R^3 , R^4 , R^5 og R^6 uavhengig eventuelt er substituert med én til to R^c ; hvor hver R^c uavhengig er valgt fra azido, okso, cyano, halo, hydroksyl, $-NR^{a1}R^{a2}$, C_{1-4} -alkoksyl, C_{3-8} -sykloalkyl, C_{6-10} -aryl, 5-6-leddet heteroaryl og 4-6-leddet heterosyklil;
- hvor hvert C_{3-8} -sykloalkyl, C_{6-10} -aryl, 5-6-leddet heteroaryl og 4-6-leddet heterosyklil i R^c uavhengig eventuelt er substituert med én til tre grupper uavhengig valgt fra halo, hydroksyl, cyano, $-NR^{a1}R^{a2}$, C_{1-4} -alkyl, C_{1-6} -haloalkyl, C_{1-4} -alkoksyl, og C_{3-6} -sykloalkyl;
- hvert C_{6-10} -aryl og 5-6-leddet heteroaryl i R^2 , R^3 , R^4 , R^5 og R^6 uavhengig eventuelt substituert er med én til fem R^b ; og
- hvert C_{3-12} -sykloalkyl og 3-12-leddet heterosyklil i R^2 , R^3 , R^4 , R^5 og R^6 uavhengig eventuelt er substituert med én til seks grupper uavhengig valgt fra $=CR^{b1}R^{b2}$ og R^b ; hvor hver R^b uavhengig er valgt fra azido, cyano, halo, hydroksyl, $-NR^{a1}R^{a2}$, C_{1-6} -alkyl, C_{1-8} -haloalkyl, C_{1-6} -alkoksyl, C_{3-6} -sykloalkyl, C_{6-10} -aryl, 5-6-leddet heteroaryl og 4-6-leddet heterosyklil; hvor hvert C_{3-6} -sykloalkyl, C_{6-10} -aryl, 5-6-leddet heteroaryl og 4-6-leddet heterosyklil i R^b uavhengig eventuelt er substituert med én til tre grupper uavhengig valgt fra halo, hydroksyl, cyano, $-NR^{a1}R^{a2}$, C_{1-4} -alkyl, C_{1-4} -haloalkyl og C_{1-4} -alkoksyl;
- hver R^{b1} og R^{b2} uavhengig er valgt fra H, C_{1-8} -alkyl, C_{1-8} -haloalkyl, C_{3-8} -sykloalkyl, C_{6-10} -aryl, 5-6-leddet heteroaryl og 3-8-leddet heterosyklil;
- hvert C_{1-8} -alkyl og C_{1-6} -haloalkyl i R^{b1} og R^{b2} eventuelt er substituert med én til to R^{b5} ; og
- hvert C_{3-8} -sykloalkyl, C_{6-10} -aryl, 5-6-leddet heteroaryl og 3-8-leddet heterosyklil i R^{b1} og R^{b2} uavhengig eventuelt er substituert med én til tre grupper uavhengig valgt

fra halo, cyano, hydroksyl, $-NR^{a1}R^{a2}$, C_{1-8} -alkyl, C_{1-8} -haloalkyl, C_{1-6} -alkoksyl, C_{3-6} -sykloalkyl, C_{6-10} -aryl, 5-6-leddet heteroaryl og 4-6-leddet heterosyklyl;

R^{b3} er C_{1-4} -alkylen;

R^{b4} er valgt fra C_{1-4} -alkyl, C_{1-4} -haloalkyl, C_{3-6} -sykloalkyl, C_{6-10} -aryl, 5-6-leddet heteroaryl og 4-6-leddet heterosyklyl; hvor hvert C_{1-4} -alkyl, C_{1-4} -haloalkyl, C_{3-6} -sykloalkyl, C_{6-10} -aryl, 5-6-leddet heteroaryl og det 4-6-leddede heterosyklylet i R^{b4} eventuelt er substituert med én til tre R^{b6} ;

hvor R^{b5} uavhengig er valgt fra cyano, hydroksyl, C_{1-4} -alkoksyl, C_{3-8} -sykloalkyl, C_{6-10} -aryl, 5-6-leddet heteroaryl og 4-6-leddet heterosyklyl; hvor hvert C_{3-8} -sykloalkyl, C_{6-10} -aryl, 5-6-leddet heteroaryl og 4-6-leddet heterosyklyl i R^{b5} eventuelt er substituert med én til tre grupper uavhengig valgt fra halo, cyano, hydroksyl, $-NR^{a1}R^{a2}$, C_{1-4} -alkyl, C_{1-4} -aaloalkyl, C_{1-4} -alkoksyl og fenyl; og

hvor R^{b6} uavhengig er valgt fra halo, cyano, C_{1-4} -alkyl, C_{1-4} -haloalkyl, C_{1-4} -alkoksyl, C_{3-6} -sykloalkyl, fenyl, 4-6-leddet heterosyklyl og 5-6-leddet heteroaryl; hvor hvert C_{3-6} -sykloalkyl, 4-6-leddet heterosyklyl og 5-6-leddet heteroaryl i R^{b6} uavhengig eventuelt er substituert med én til tre grupper uavhengig valgt fra halo, cyano, $-NR^{a1}R^{a2}$, C_{1-4} -alkyl, C_{1-4} -haloalkyl og C_{1-4} -alkoksyl; eller

R^2 og R^3 , R^3 og R^4 eller R^5 og R^6 , sammen med atomene de er tilknyttet, kan danne et C_{6-10} -aryl, 5-6-leddet heteroaryl, C_{3-6} -sykloalkyl eller 5-6-leddet heterosyklyl; hvor hvert C_{6-10} -aryl, 5-6-leddet heteroaryl, C_{3-6} -sykloalkyl eller 5-6-leddet heterosyklyl eventuelt er substituert med én til tre grupper uavhengig valgt fra halo, cyano, $-NR^{a1}R^{a2}$, C_{1-6} -alkyl, C_{1-6} -alkoksyl, C_{1-6} -haloalkyl, C_{3-8} -sykloalkyl, 3-6-leddet heterosyklyl, C_{6-10} -aryl, 5-6-leddet heteroaryl, C_{1-4} -alkylen- C_{3-8} -sykloalkyl, C_{1-4} -alkylen- C_{6-10} -aryl og C_{1-4} -alkylen-(5-6-leddet heteroaryl);

R^7 er valgt fra H, C_{1-4} -alkyl og C_{1-4} -haloalkyl;

R^8 er valgt fra H, C_{1-4} -alkyl og C_{1-4} -haloalkyl;

R^9 er valgt fra H, C_{1-6} -alkyl, $-C_{1-4}$ -alkylen- $-NR^{a1}R^{a2}$, $-C_{1-4}$ -alkylen- $C(O)NR^{a1}R^{a2}$, $-C_{1-4}$ -alkylen- $O-C(O)-C_{1-4}$ -alkyl, $-C_{1-4}$ -alkylen- $O-C(O)-O-C_{1-4}$ -alkyl, $-C_{1-4}$ -alkylen- $O-C(O)-C_{1-4}$ -alkylen- $-NR^{a1}R^{a2}$, $-C_{1-4}$ -alkylen- $O-C_{1-4}$ -alkyl, C_{3-8} -sykloalkyl, $-C_{1-4}$ -alkylen- C_{3-8} -sykloalkyl, 4-6-leddet heterosyklyl og $-C_{1-4}$ -alkylen-(4-6-leddet heterosyklyl);

hvor hvert C_{3-8} -sykloalkyl, $-C_{1-4}$ -alkylen- C_{3-8} -sykloalkyl, 4-6-leddet heterosyklyl og $-C_{1-4}$ -alkylen-(4-6-leddet heterosyklyl) i R^9 eventuelt er substituert med én til tre grupper uavhengig valgt fra halo, C_{1-4} -alkyl, C_{1-4} -alkoksyl og C_{1-4} -haloalkyl; eller

R^9 , sammen med det N som knytter til R^8 , danner et 5-leddet heterosyklyl;

3873897

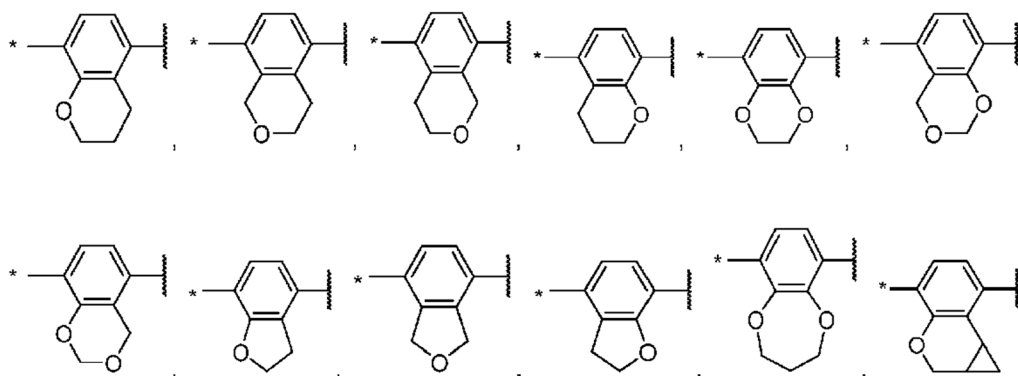
4

hvor det 5-leddede heterosyklylet eventuelt er substituert med én til to grupper uavhengig valgt fra halo, C₁₋₆-alkyl, C₁₋₆-alkoksyl, C₁₋₆-haloalkyl og C₆₋₁₀-aryl; hvor C₆₋₁₀-aryl eventuelt er substituert med én til tre grupper uavhengig valgt fra halo, C₁₋₆-alkyl, C₁₋₆-alkoksyl og C₁₋₆-haloalkyl;

- 5 hver R¹⁰ uavhengig er valgt fra H, halo, cyano, hydroksyl, -C(O)R^{b1}, -NR^{a1}R^{a2}, C₁₋₄-alkyl, C₁₋₄-alkoksyl, C₁₋₄-haloalkyl, C₁₋₄-haloalkoksyl, C₃₋₁₀-sykloalkyl, 3-8-leddet heterosyklyl, C₆₋₁₀-aryl og 5-6-leddet heteroaryl; hvor hvert C₁₋₄-alkyl, C₁₋₄-alkoksyl, C₁₋₄-haloalkyl, C₁₋₄-haloalkoksyl, C₃₋₁₀-sykloalkyl, 3-8-leddet heterosyklyl, C₆₋₁₀-aryl og 5-6-leddet heteroaryl uavhengig eventuelt er substituert med én til tre grupper uavhengig valgt fra halo, hydroksyl, cyano, -NR^{a1}R^{a2}, C₁₋₄-alkyl, C₁₋₄-haloalkyl, C₁₋₄-alkoksyl og C₃₋₆-sykloalkyl;
- 10 eller to R¹⁰ knyttet til enten det samme eller tilstøtende atomer danner C₃₋₁₂-sykloalkyl eller 3-10-leddet heterosyklyl; hvor hvert C₃₋₁₂-sykloalkyl og 3-10-leddet heterosyklyl eventuelt er substituert med én til tre grupper uavhengig valgt fra H, halo, C₁₋₄-alkyl, C₁₋₄-alkoksyl, C₁₋₄-haloalkyl og C₁₋₄-haloalkoksyl;
- 15 hver R¹¹ uavhengig er valgt fra H, C₁₋₄-alkyl, -C(O)R^{b1} og C₁₋₄-haloalkyl; hvor hvert C₁₋₄-alkyl, -C(O)R^{b1} og C₁₋₄-haloalkyl i R¹¹ uavhengig eventuelt er substituert med én til tre grupper uavhengig valgt fra halo, hydroksyl, cyano, -NR^{a1}R^{a2}, C₁₋₄-alkyl, C₁₋₄-haloalkyl, C₁₋₄-alkoksyl og C₃₋₆-sykloalkyl;
- hver R^{a1} og R^{a2} uavhengig er valgt fra H, C₁₋₆-alkyl og C₁₋₆-haloalkyl;
- 20 n er valgt fra 1, 2 og 3;
- m er valgt fra 0, 1 og 2; og
- v er valgt fra 1 og 2.

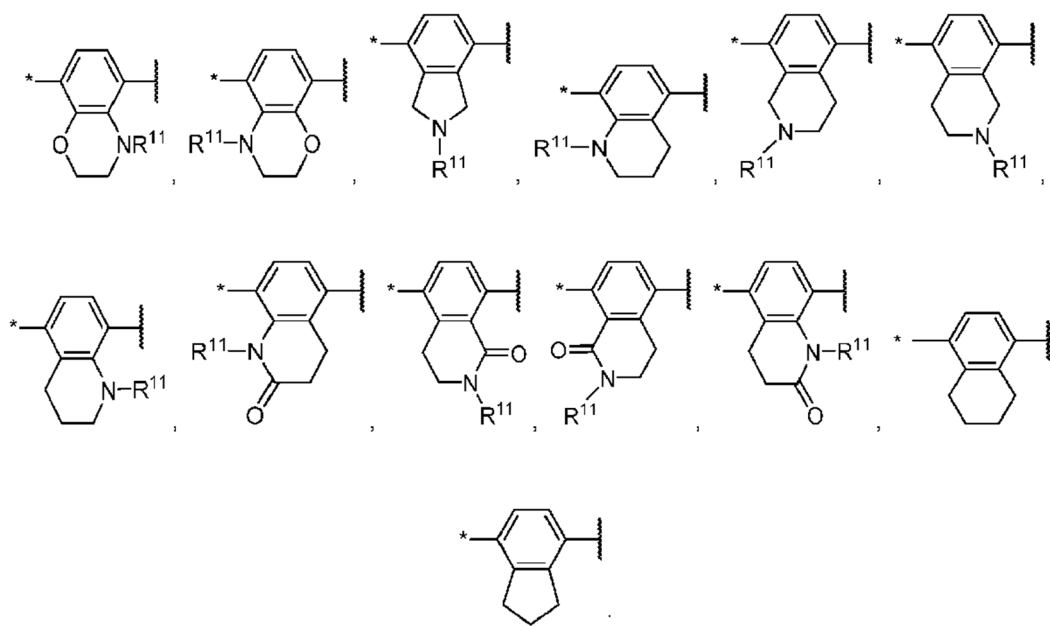
2. Forbindelse ifølge krav 1, hvor ringen dannet av Y og Z er valgt fra:

25



3873897

5



og

5

hvor * angir et tilknytningspunkt til R^1 ;

hvor hver gruppe eventuelt er substituert med 1 til 7 R^{10} ; og

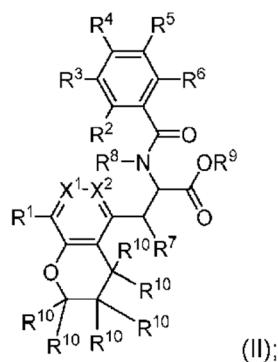
hvor hver R^{10} uavhengig er valgt fra halo, cyano, hydroksyl, C_{1-4} -alkyl, C_{1-4} -alkoksyl, C_{1-4} -haloalkyl, C_{1-4} -haloalkoksyl, C_{3-10} -sykloalkyl, 3-8-leddet heterosykl, C_{6-10} -aryl, 5-6-leddet heteroaryl og $-NR^{a1}R^{a2}$, hvor hvert C_{1-4} -alkyl, C_{1-4} -alkoksyl, C_{1-4} -haloalkyl, C_{1-4} -haloalkoksyl, C_{3-10} -sykloalkyl, 3-8-leddet heterosykl, C_{6-10} -aryl og 5-6-leddet heteroaryl i R^{10} uavhengig eventuelt er substituert med én til tre grupper uavhengig valgt fra halo, hydroksyl, cyano, $-NR^{a1}R^{a2}$, C_{1-4} -alkyl, C_{1-4} -haloalkyl, C_{1-4} -alkoksyl og C_{3-6} -sykloalkyl.

15

3. Forbindelse ifølge krav 1 eller 2, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, med én av de følgende formler:

(1)

Formel (II)



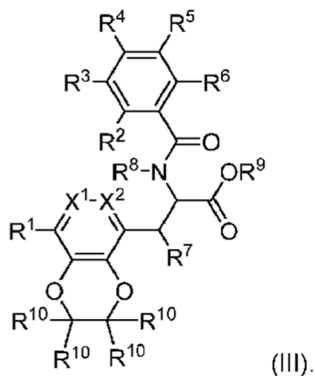
(II);

3873897

6

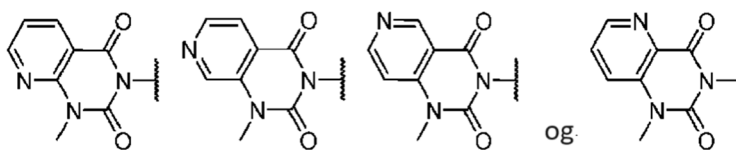
(2)

Formel (III)



- 5 4. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor R¹ er valgt fra fenyl, naftyl, pyridinyl, pyridazinyl, pyrazinyl, pyrimidinyl, kinolinyl, isokinolinyl, isoksazolyl, triazolyl, pyrazolyl, benzotiazolyl, pyridinonyl, kinolinonyl, isokinolinonyl, kinazolindionyl, pyrazinonyl, pyrimidinonyl, pyrimidindionyl, pyridazinonyl, kinazolinonyl, benzofuranyl, tetrahydrocyklopenta[b]pyridinonyl, naftyridinonyl, kromanyl, isokromanyl og
- 10 kromenonyl, og hvor hver R¹ uavhengig eventuelt er substituert med én til fire R^a.

5. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor R¹ er valgt fra

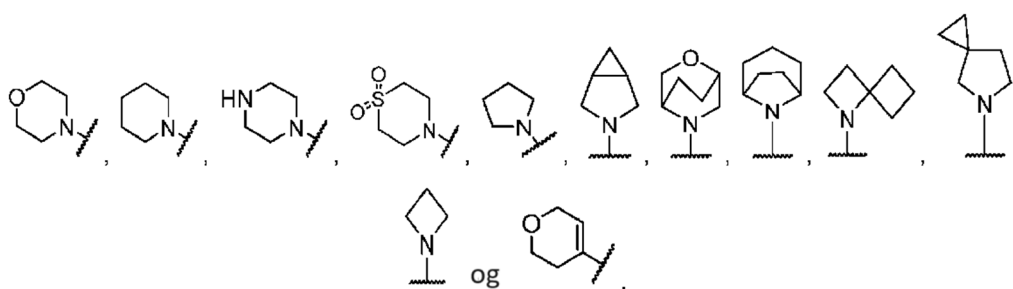


15

6. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor hver R² og R⁶ uavhengig er valgt fra -CH₃, -CD₃, F og Cl.

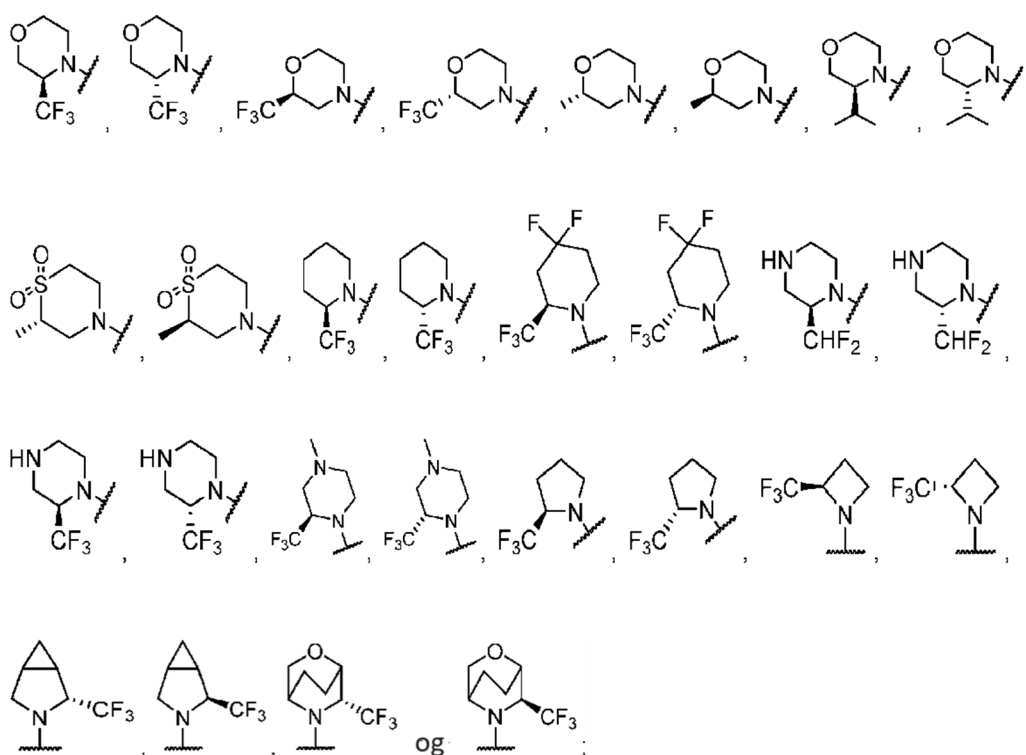
- 20 7. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor:

(i) R⁴ er valgt fra



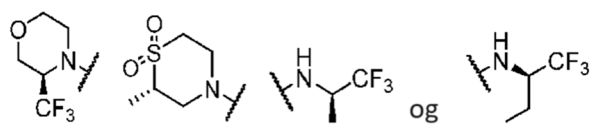
hvor hver R⁴ eventuelt er substitueret med én til to grupper uafhængig valgt fra F, Cl, cyano, hydroksyl, NH₂, -CH₃, -CH(CH₃)₂, -CH₂F, -CHF₂, -CF₃, -CH₂CH₂F, -CH₂CHF₂, -CH₂CF₃, C₃₋₆-sykloalkyl og -CH₂C₃₋₆-sykloalkyl;

(ii) R^4 er valgt fra



eller

(iii) R^4 er valgt fra

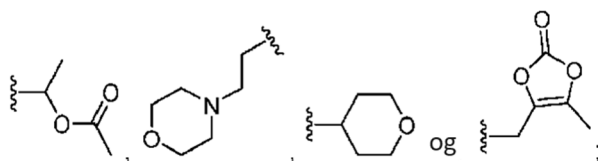


8. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor R⁹ er valgt fra H, metyl, etyl, propyl, butyl, -CH₂C(O)N(CH₃)₂, -(CH₂)₂ N(CH₂CH₃)₂, -CH₂-O-C(O)CH₃, -(CH₂)₂-O-C(O)CH₃, -CH₂-O-C(O)C(CH₃)₃, -(CH₂)₂-O-C(O)C(CH₃)₃, -CH₂-O-C(O)-O-CH₃, -CH₂-O-

3873897

8

$C(O)-O-CH_2CH_3$, $-CH_2-O-C(O)-O-CH(CH_3)_2$, $-CH_2-O-C(O)-O-C(CH_3)_3$, $-(CH_2)_2C(O)CH_3$,



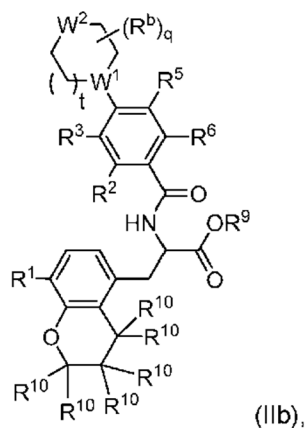
eller

5 R^9 er H.

9. Forbindelse ifølge krav 1, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, med én av følgende strukturer:

(1)

Formel (IIb):



(IIb),

hvor:

W^1 er valgt fra CR^{31} og N;

W^2 er valgt fra $CR^{31}R^{31}$, NR^{32} , O og $S(O)_2$;

hver R^{31} uavhengig er valgt fra H og R^b ;

R^{32} er valgt fra H, C_{1-4} -alkyl og C_{1-4} -haloalkyl;

q er valgt fra 0, 1, 2 og 3; og

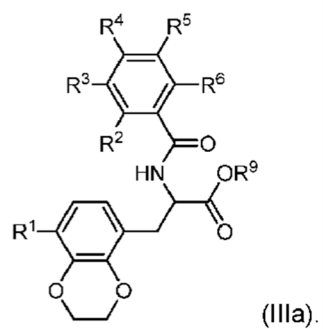
t er 0 eller 1;

3873897

9

(2)

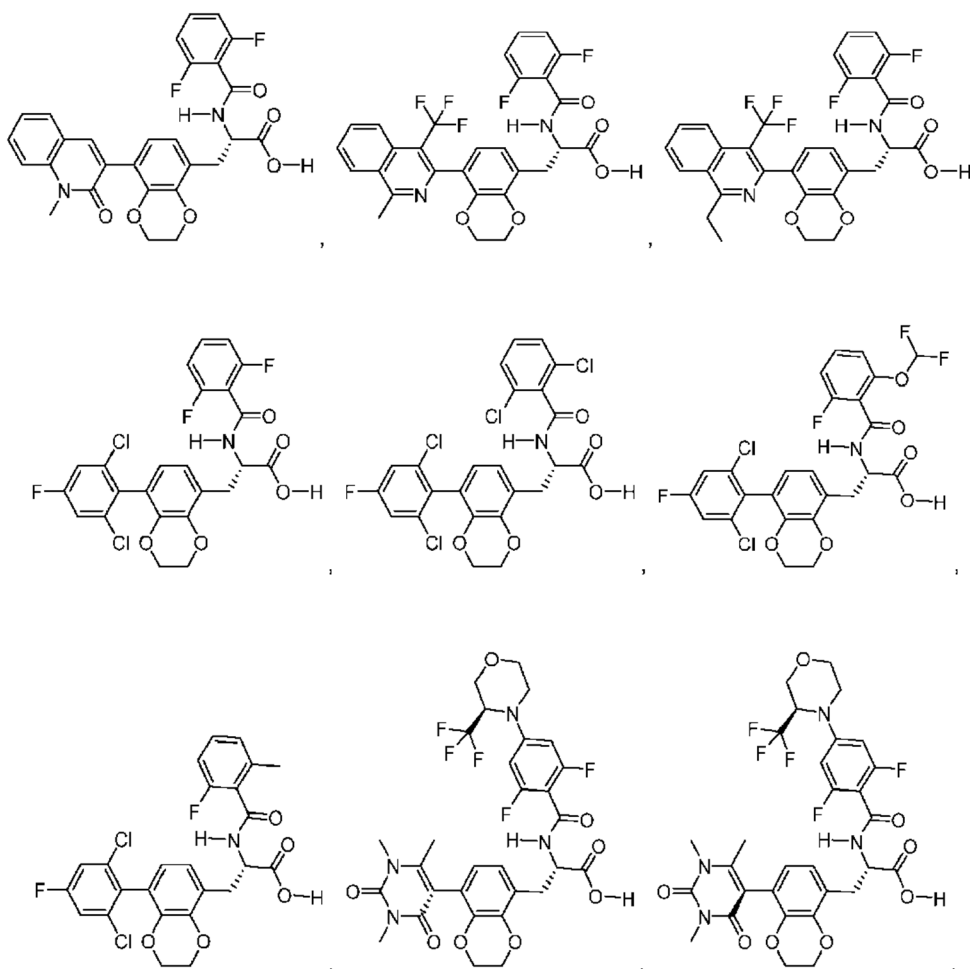
Formel (IIIa):



10. Forbindelse ifølge krav 1, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, valgt fra:

5

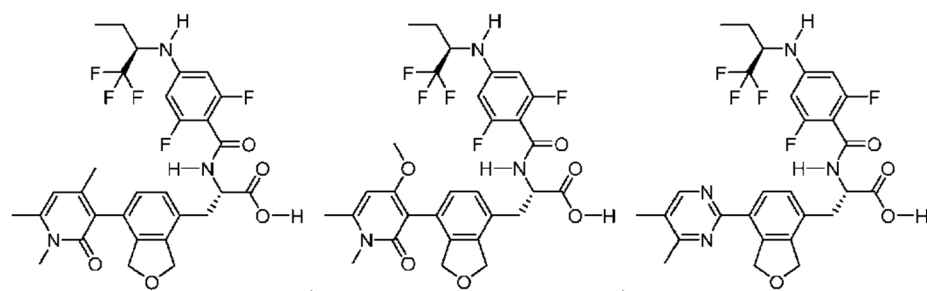
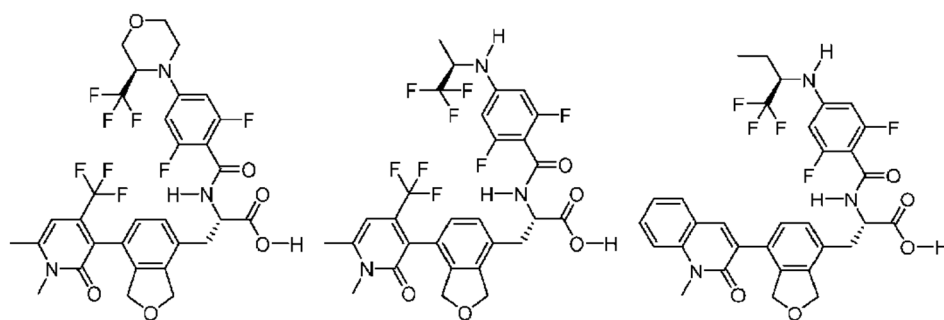
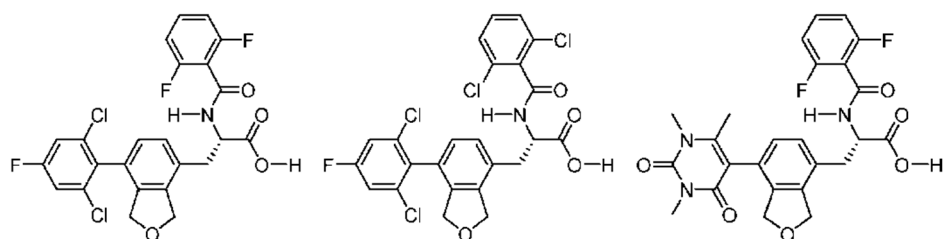
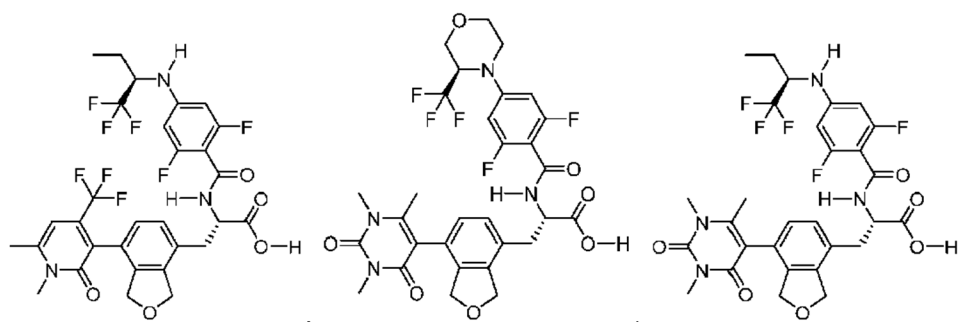
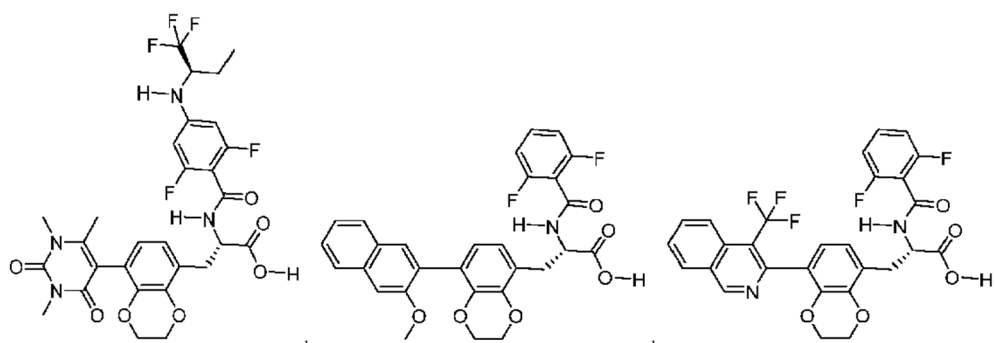
(A)



10

3873897

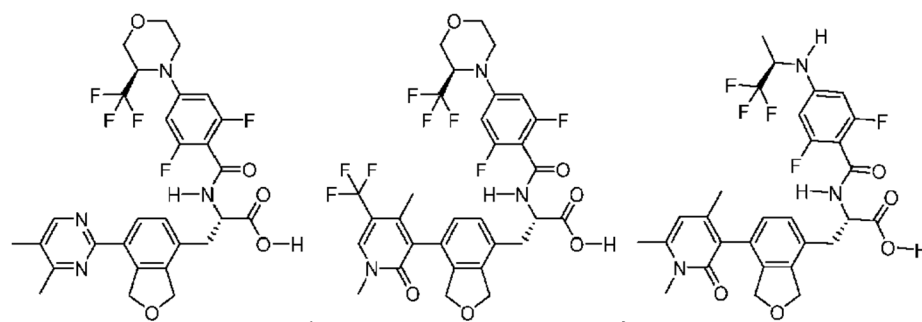
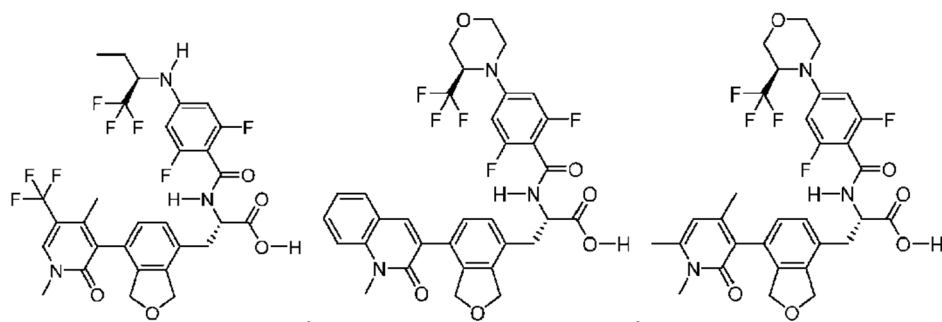
10



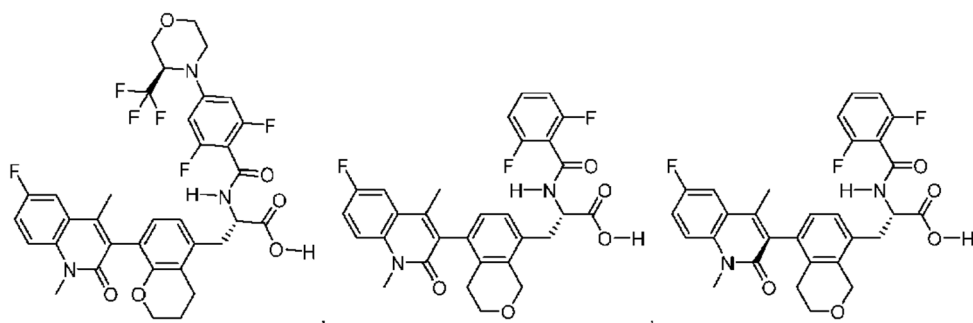
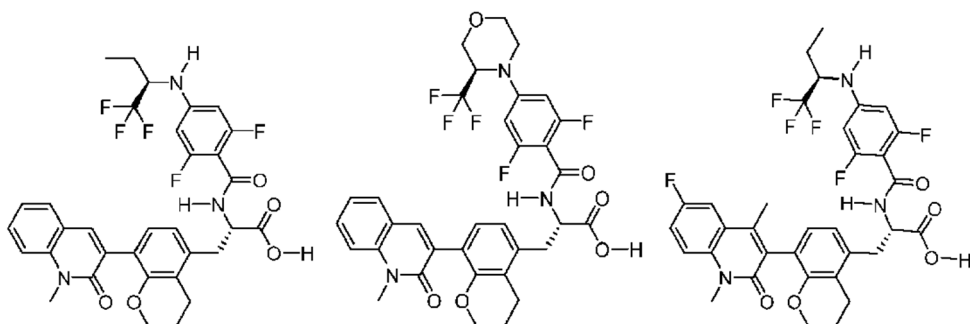
5

3873897

11

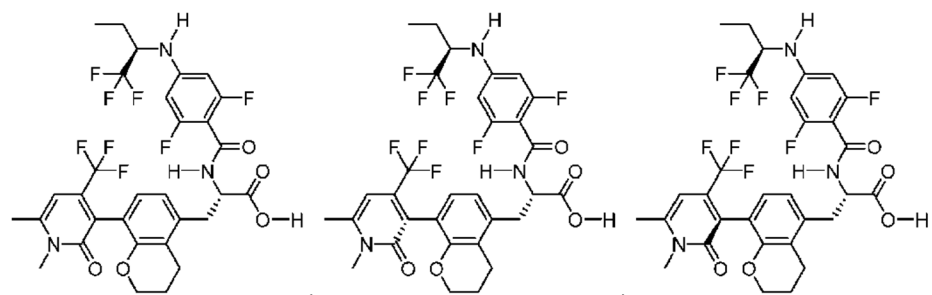
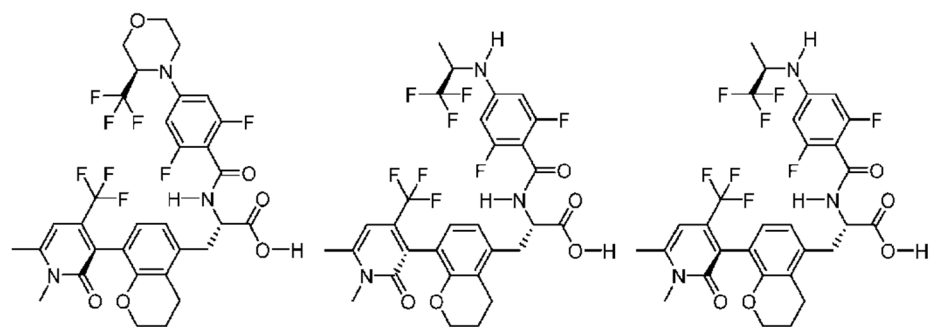
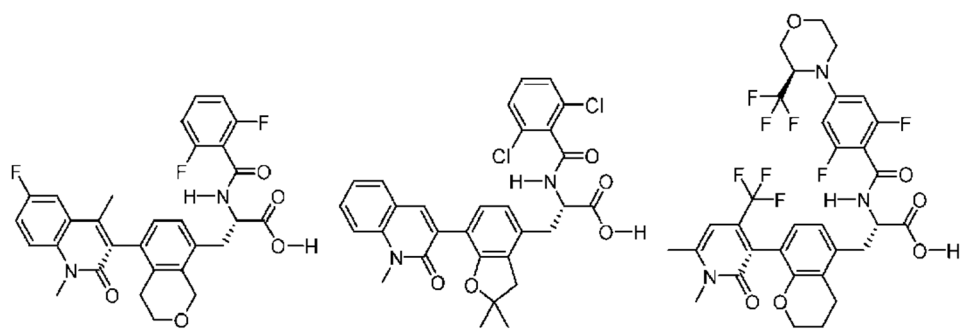


5

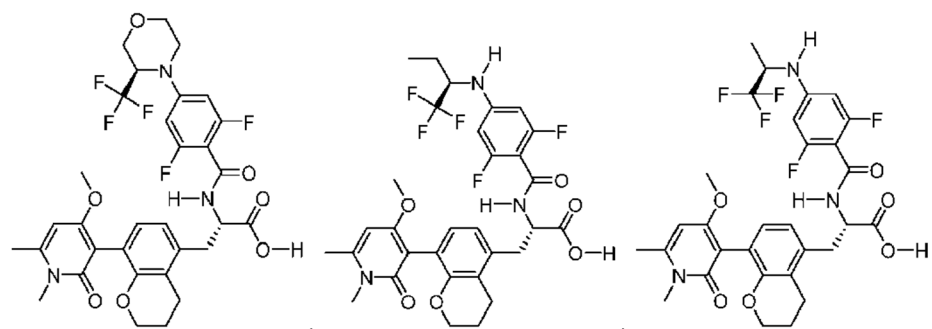


3873897

12

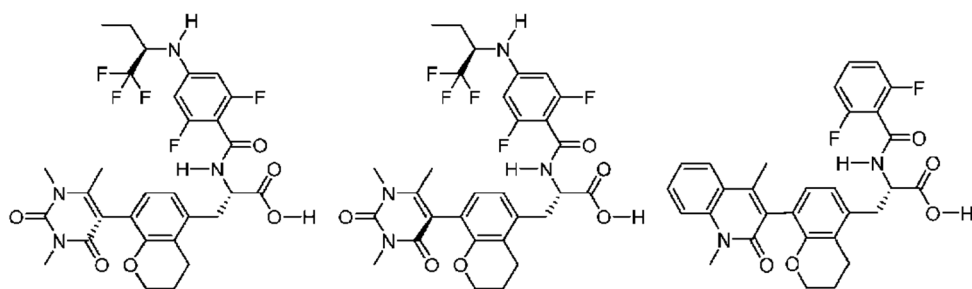
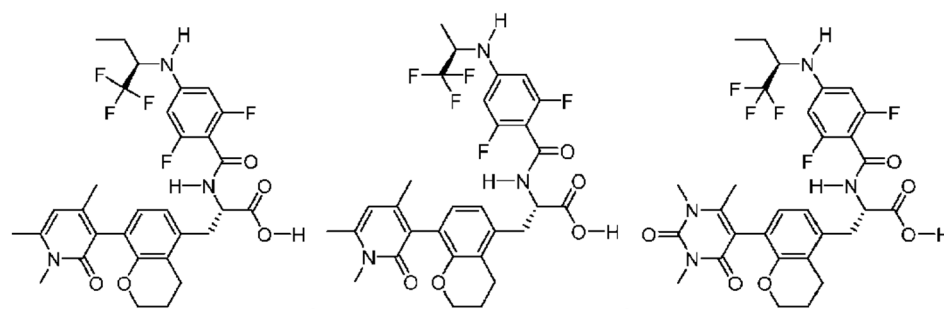
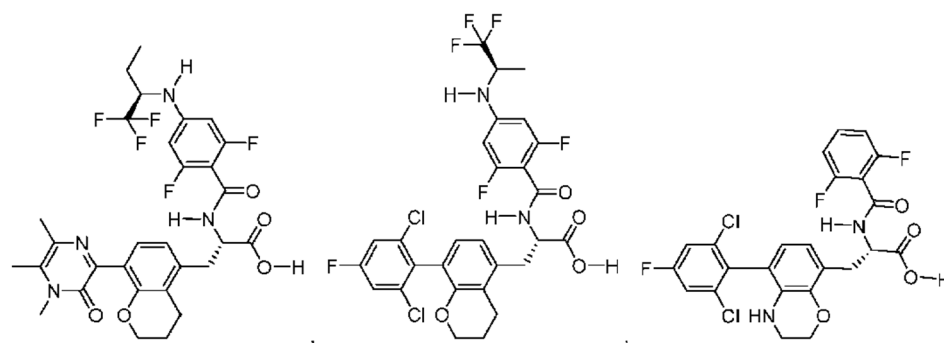


5

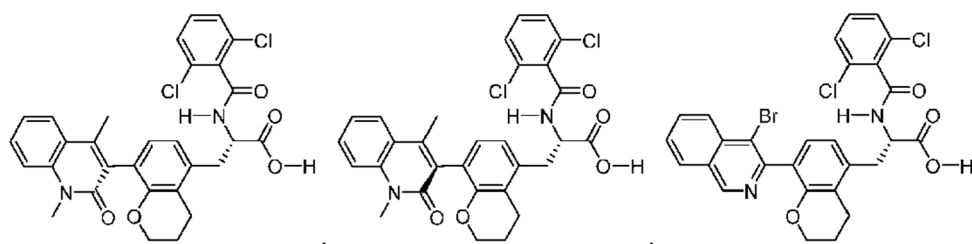
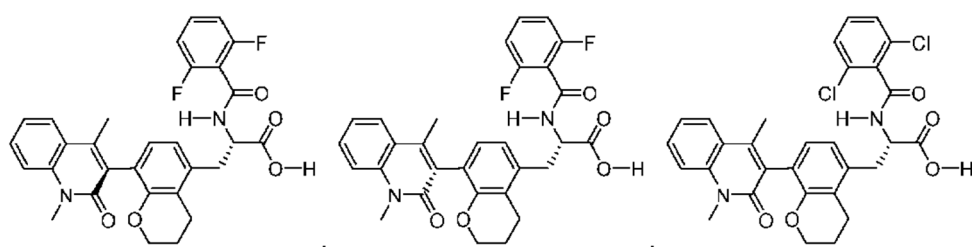


3873897

13



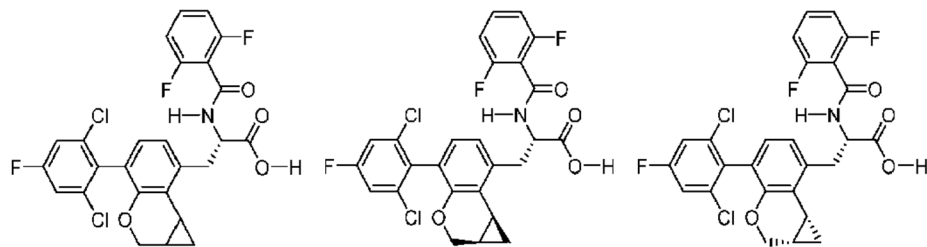
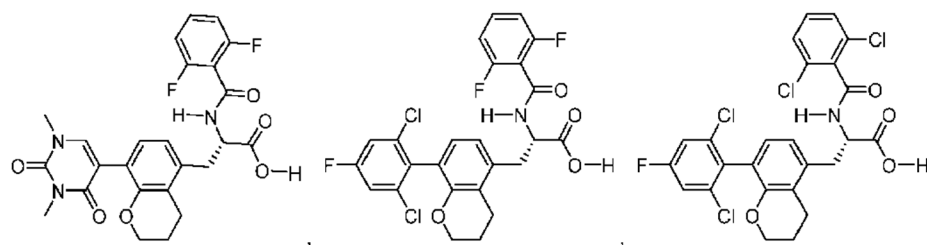
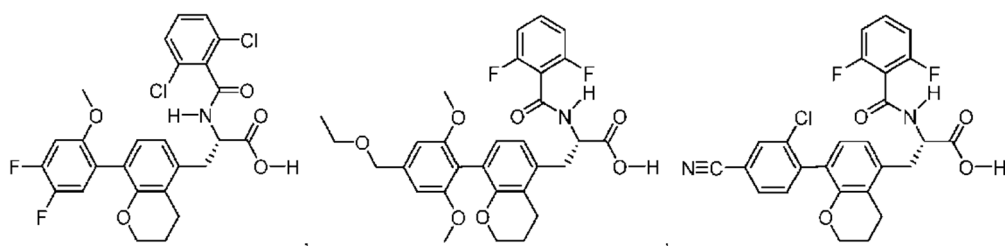
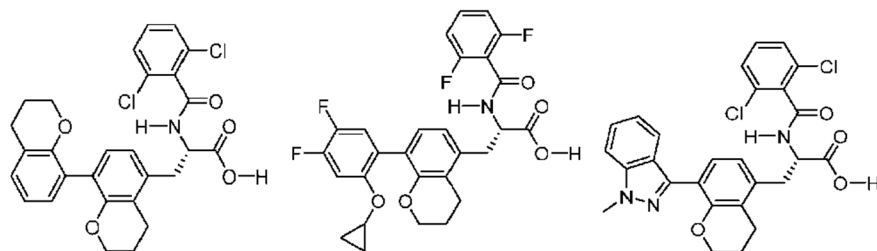
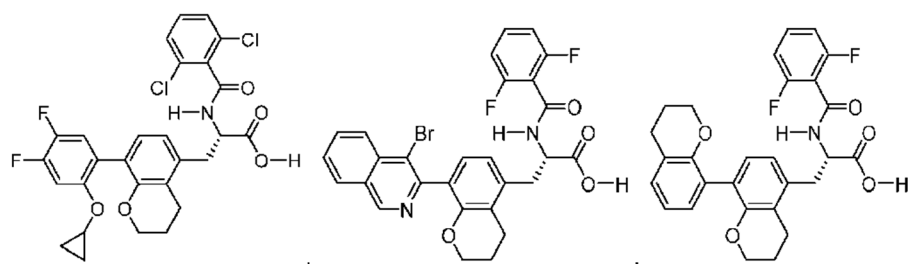
5



10

3873897

14

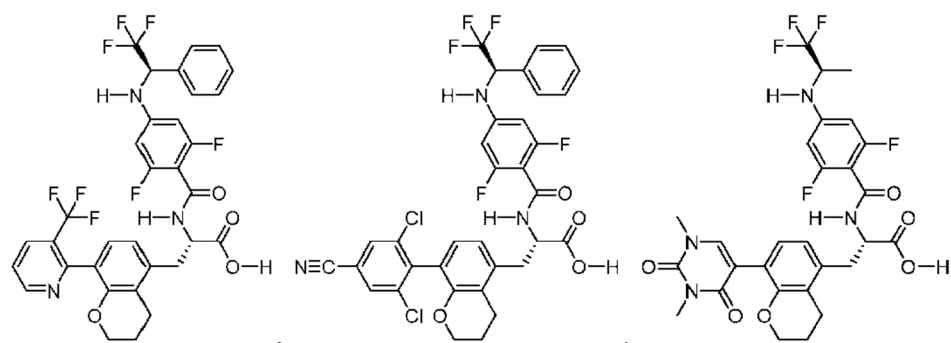
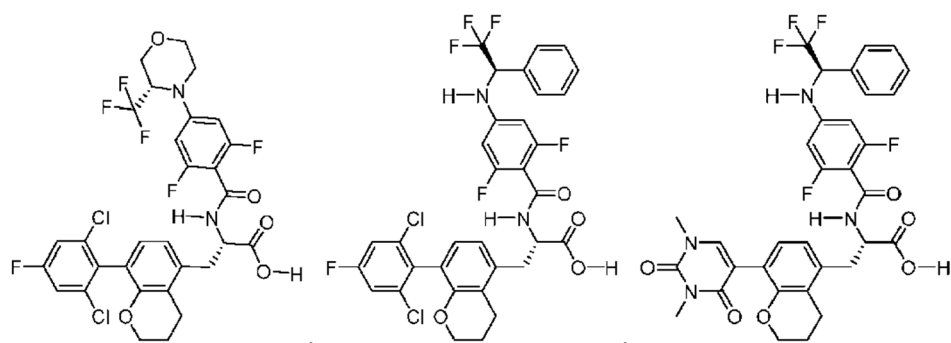
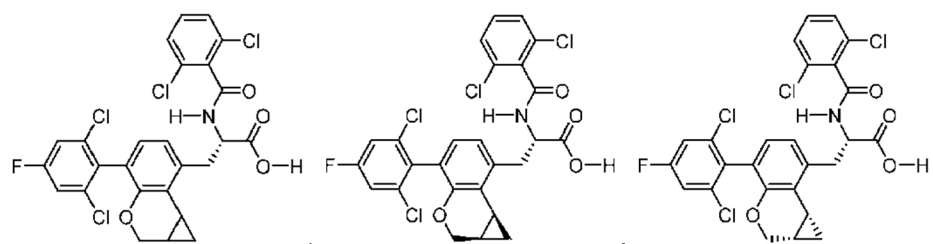


5

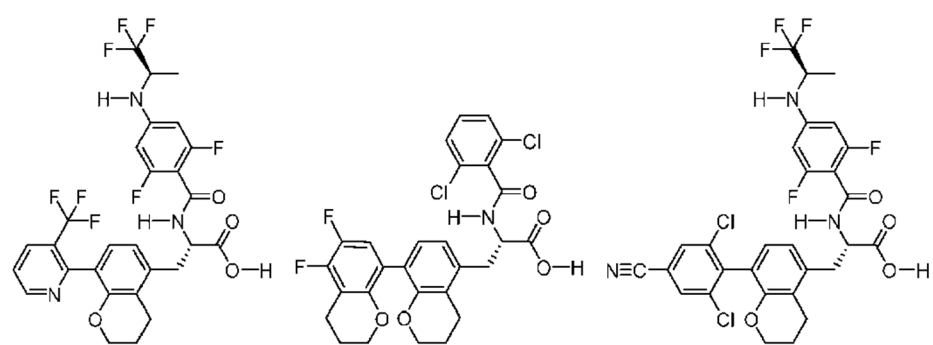
10

3873897

15

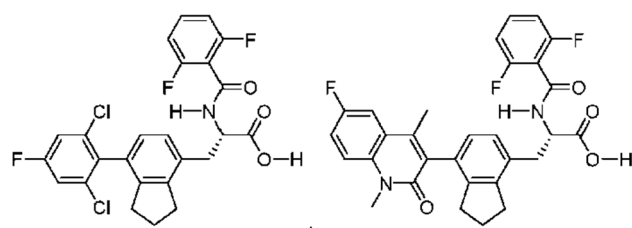
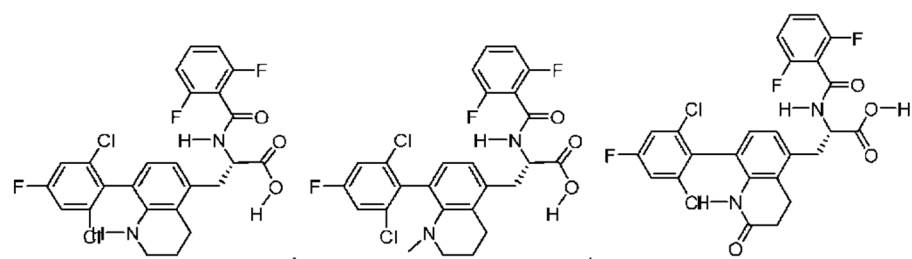
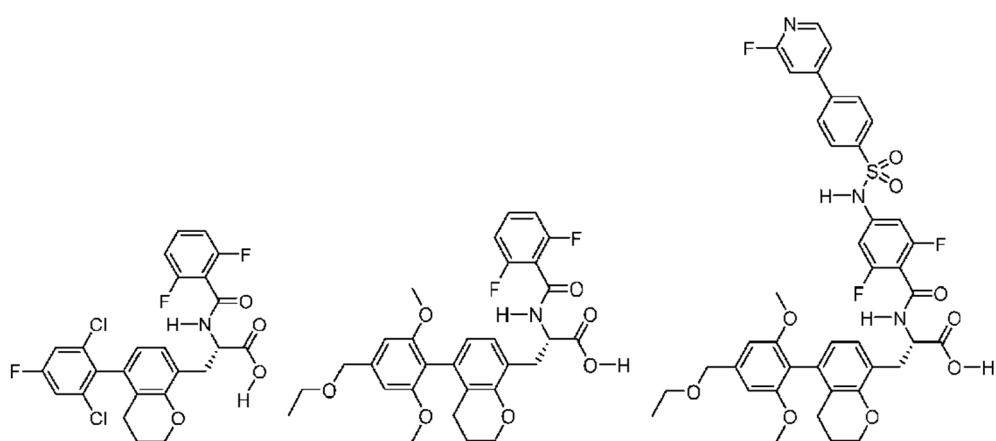
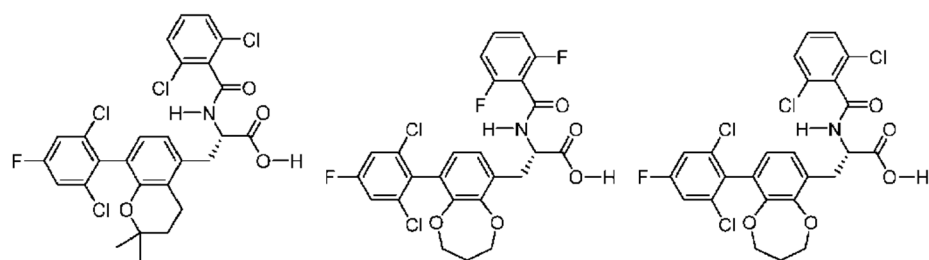
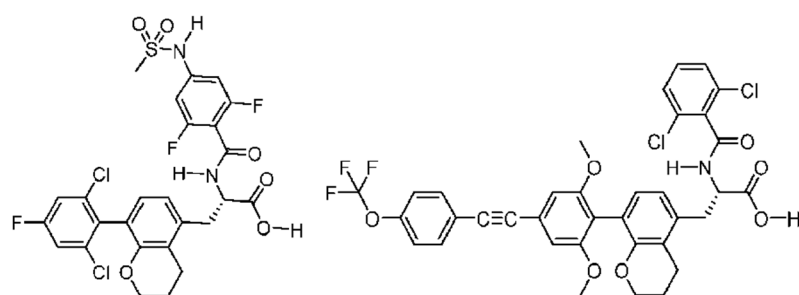


5



3873897

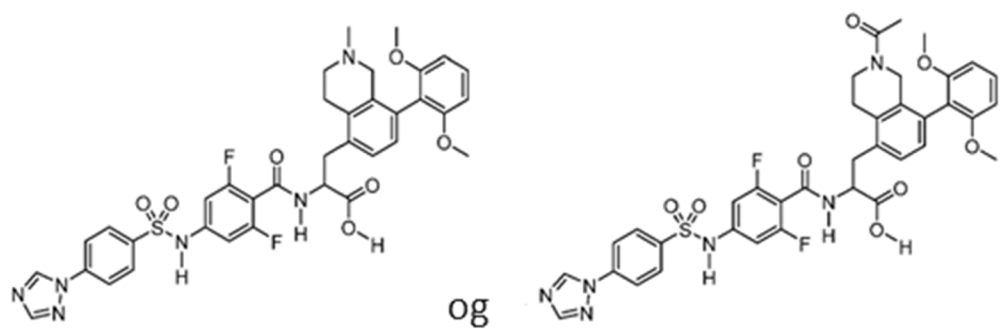
16



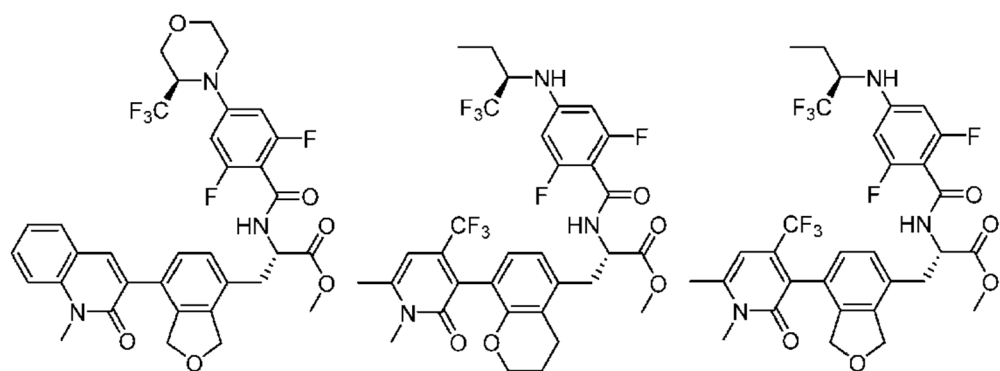
10

3873897

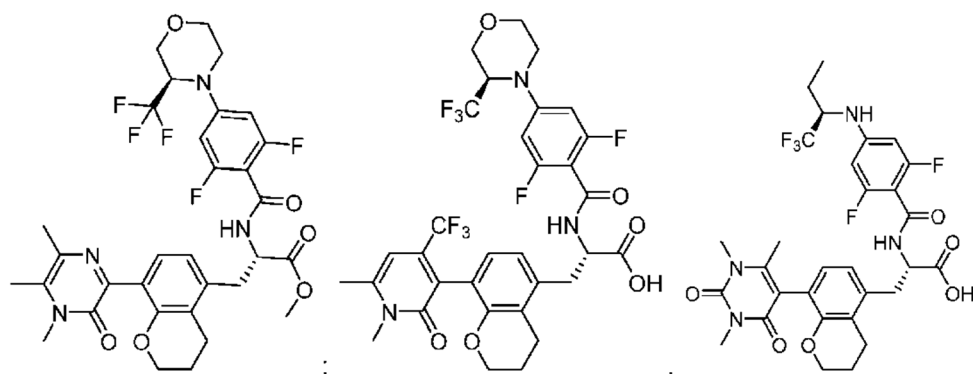
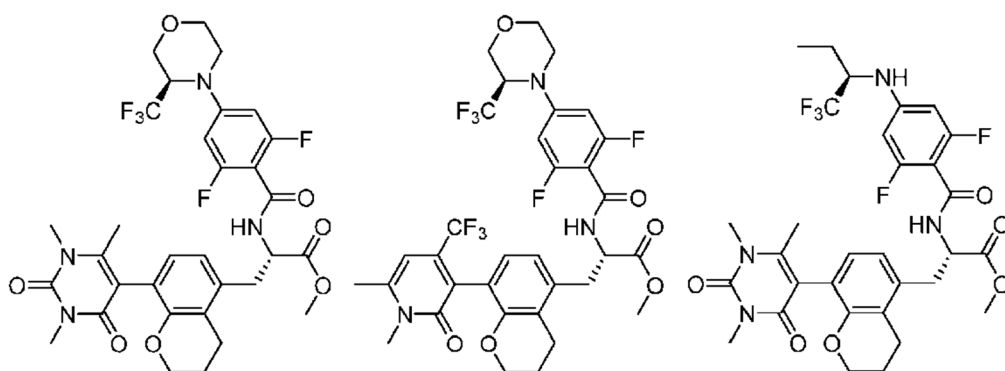
17



(B)

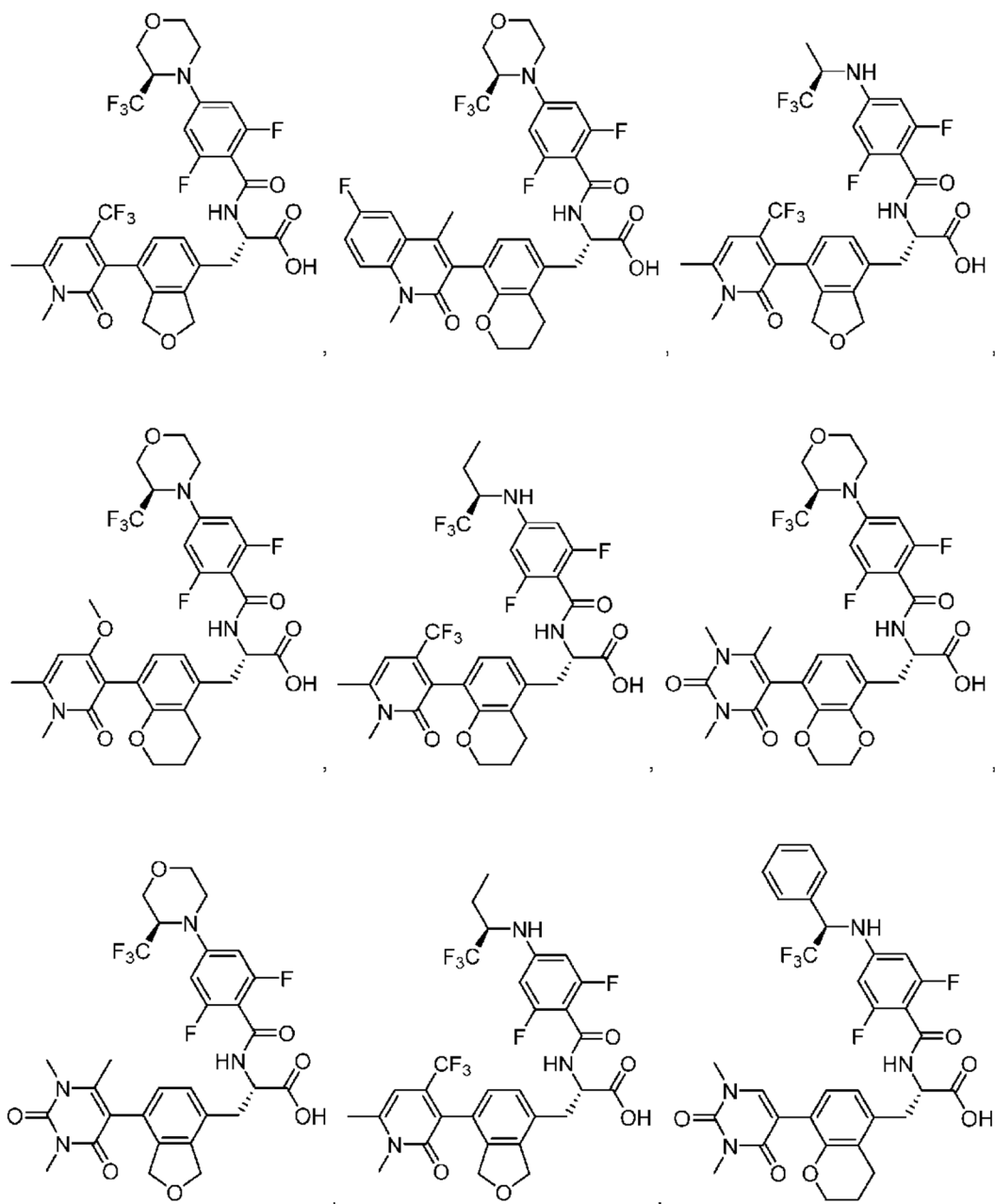


5



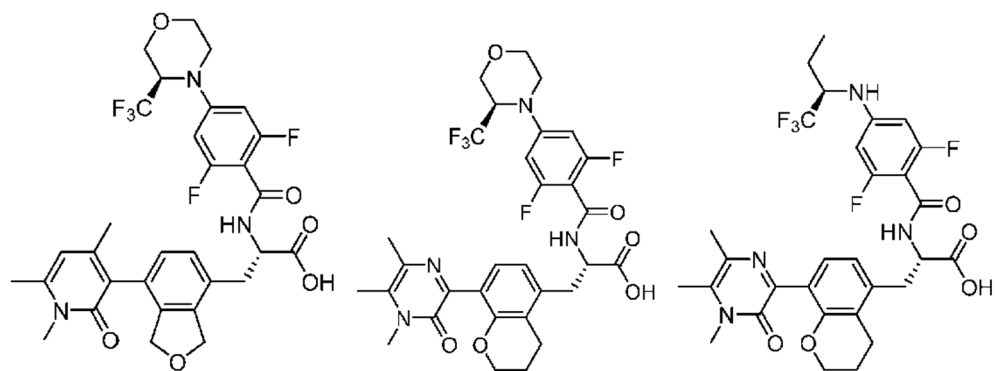
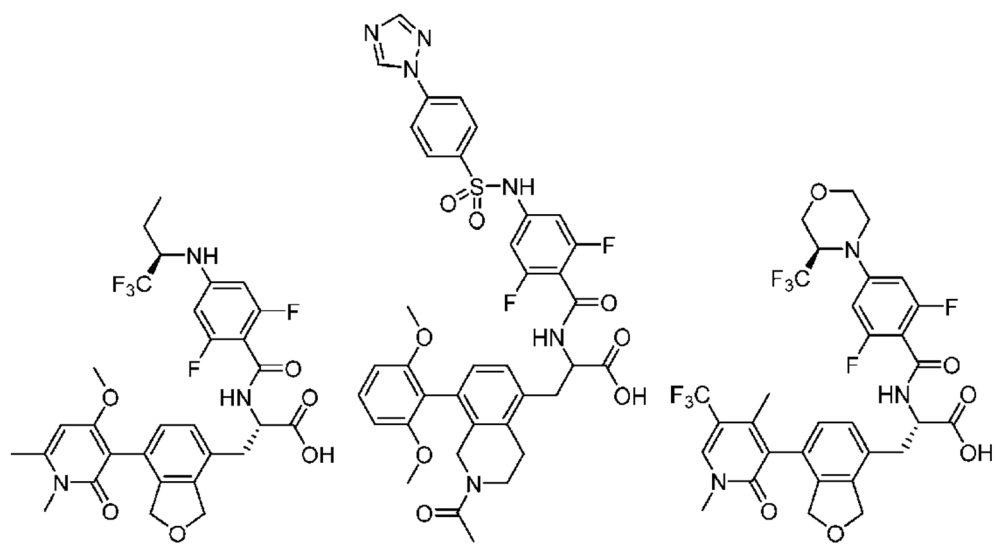
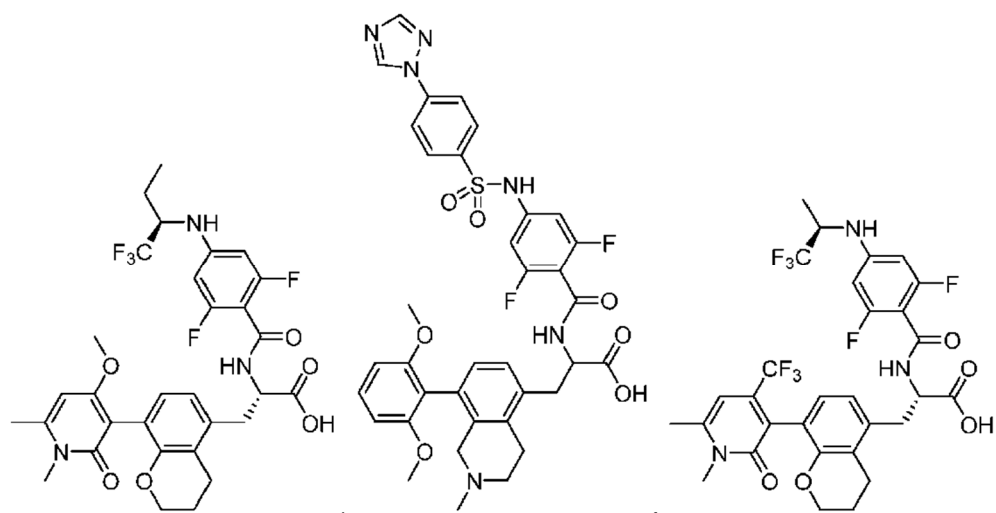
3873897

18



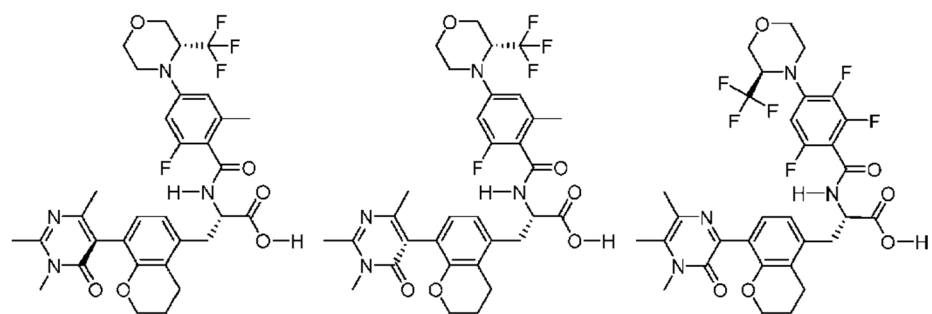
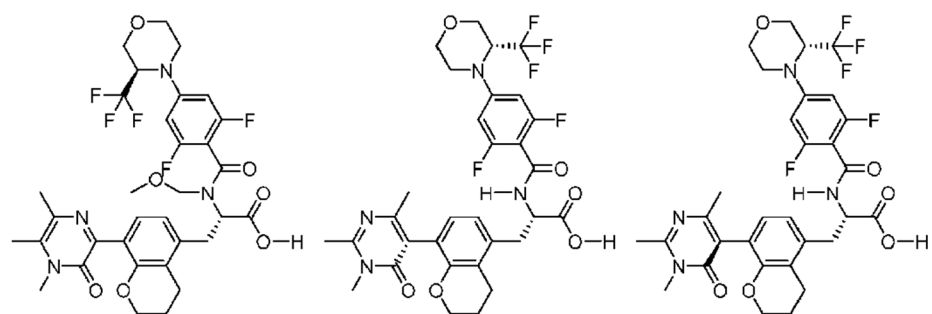
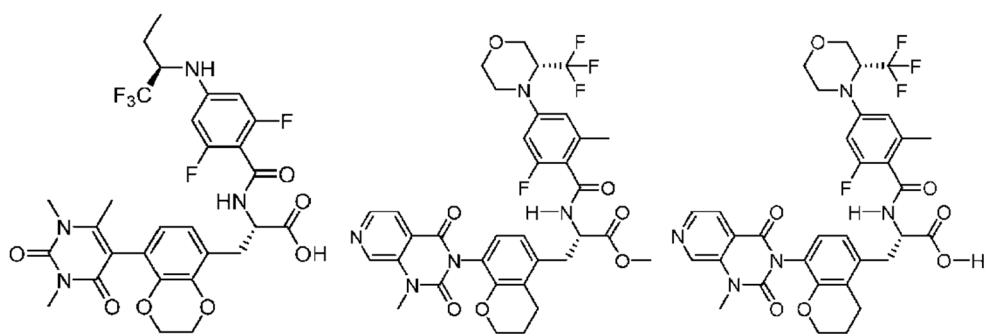
3873897

19

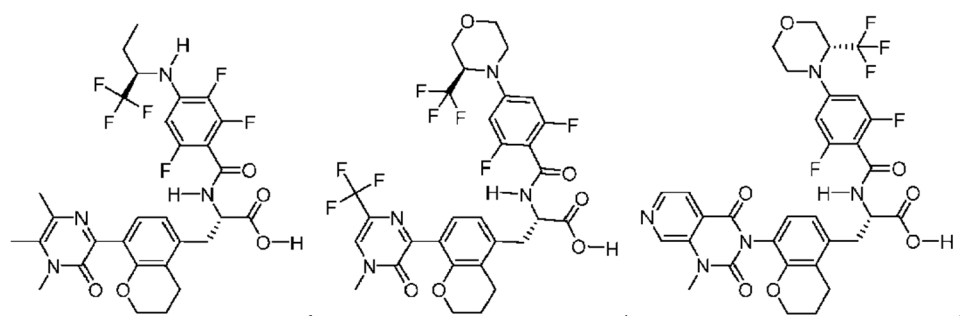


3873897

20

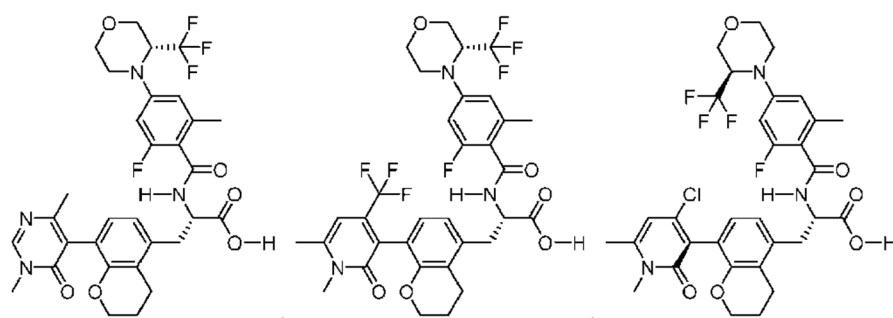
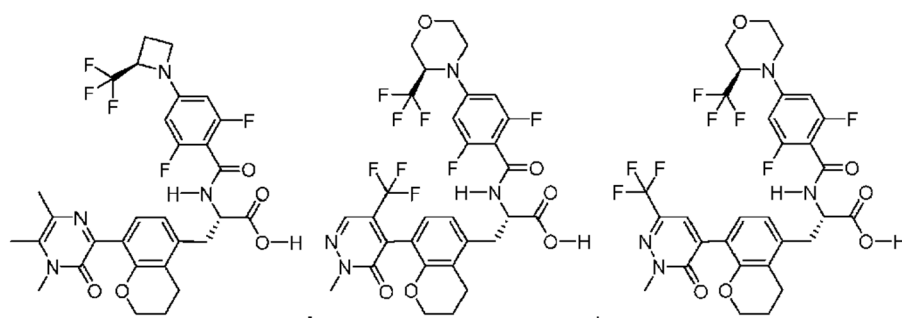
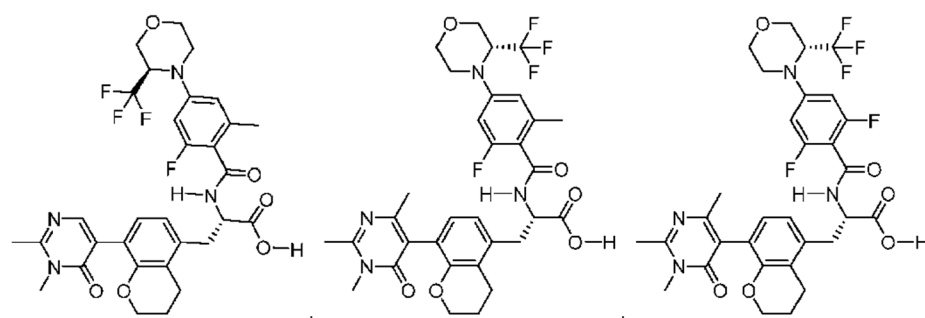
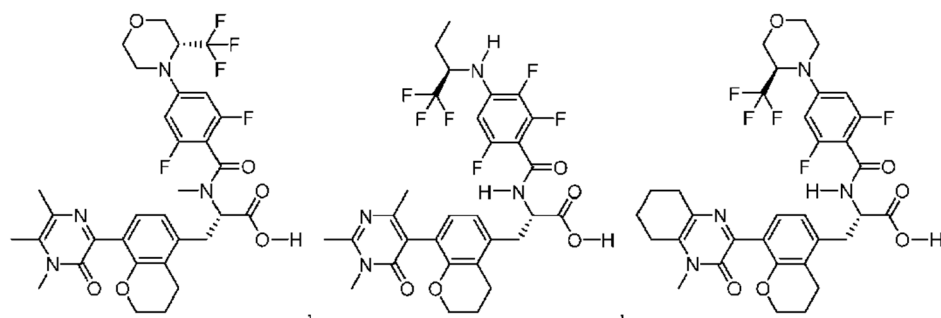


5



3873897

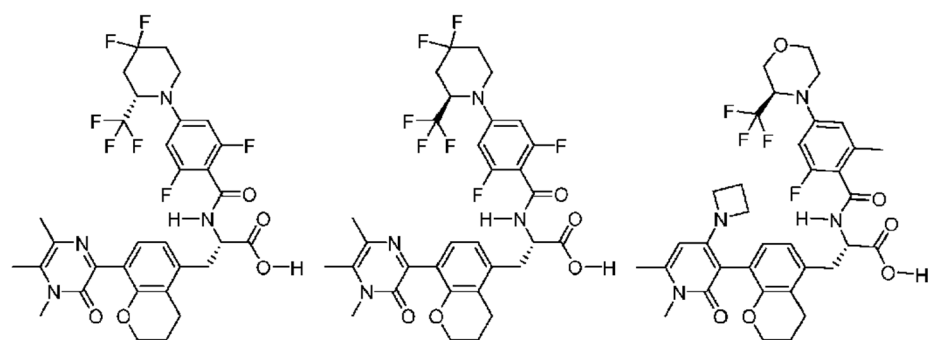
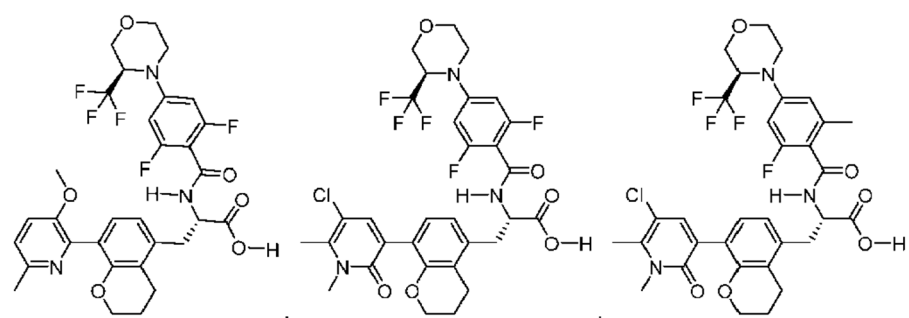
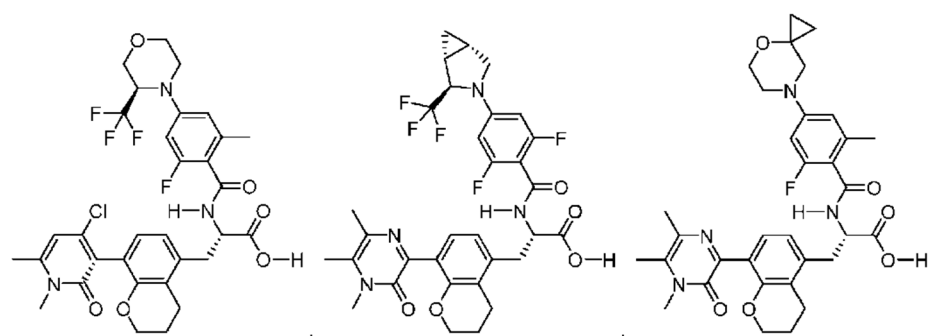
21



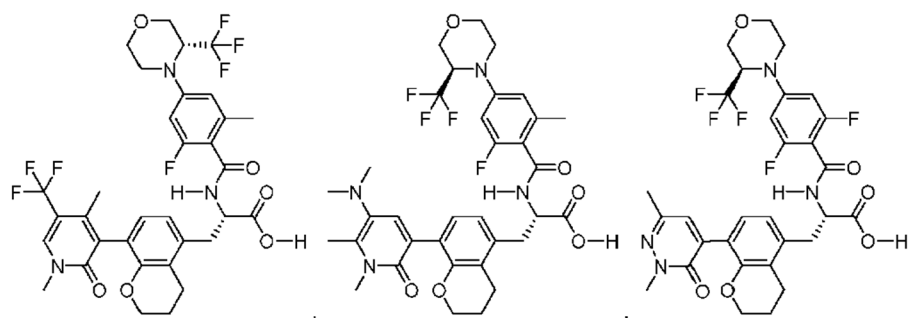
5

3873897

22

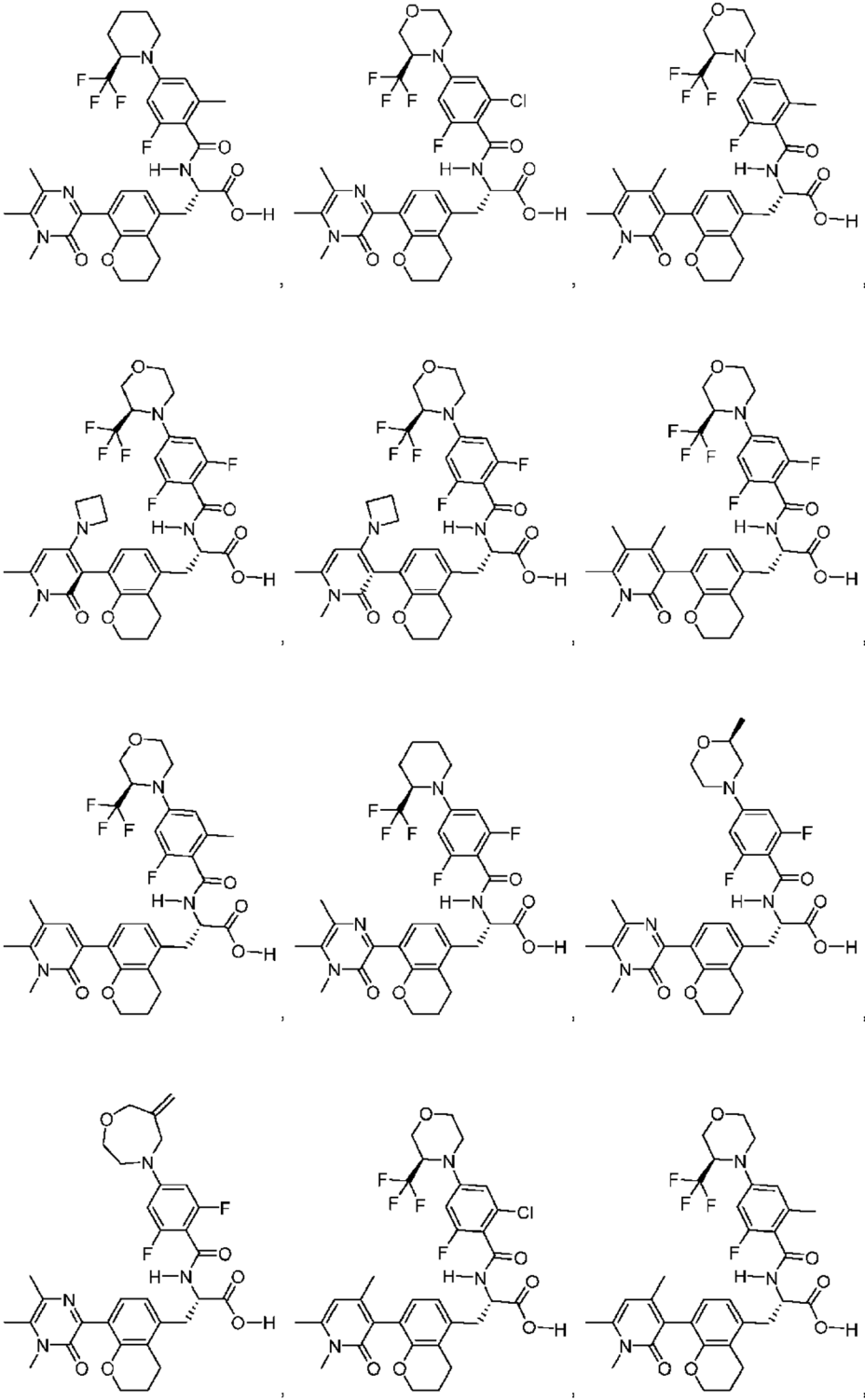


5



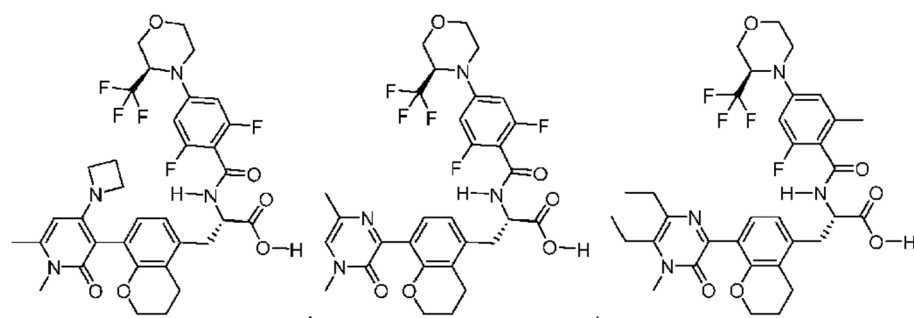
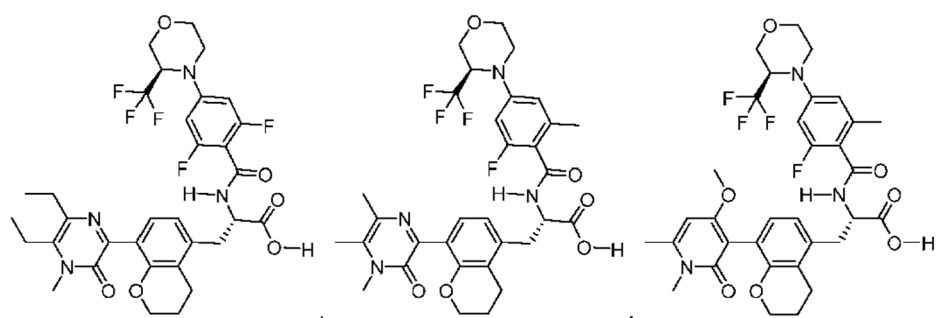
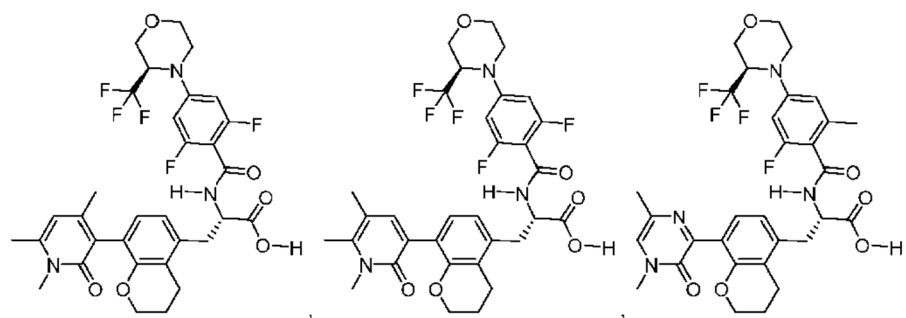
3873897

23

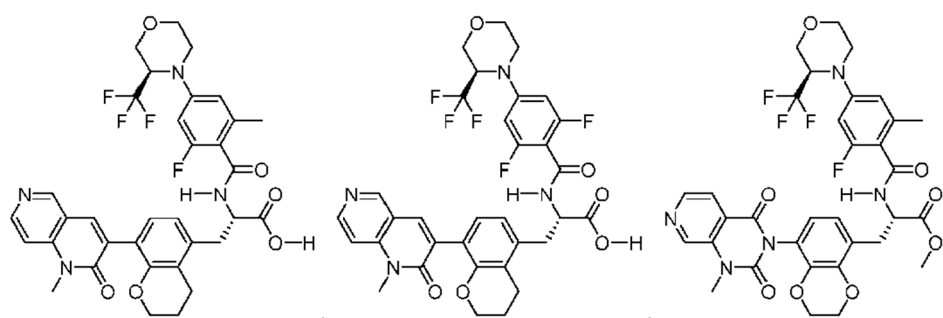


3873897

24

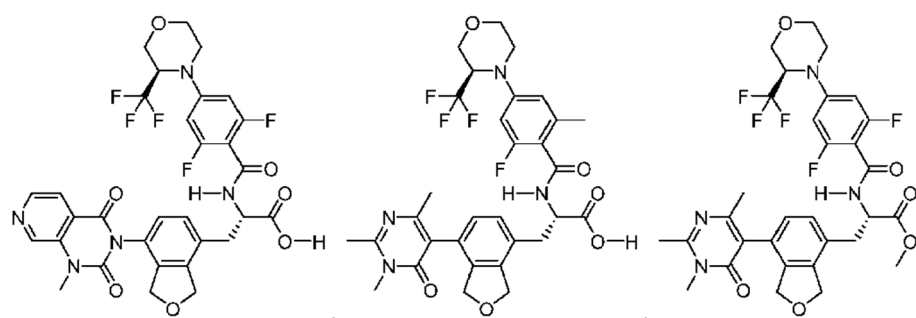
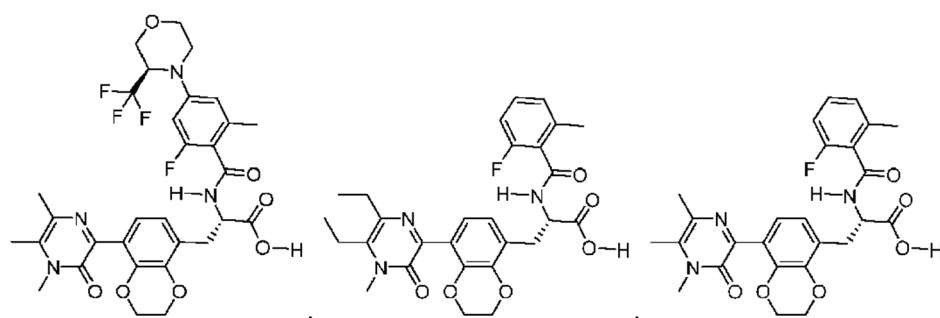
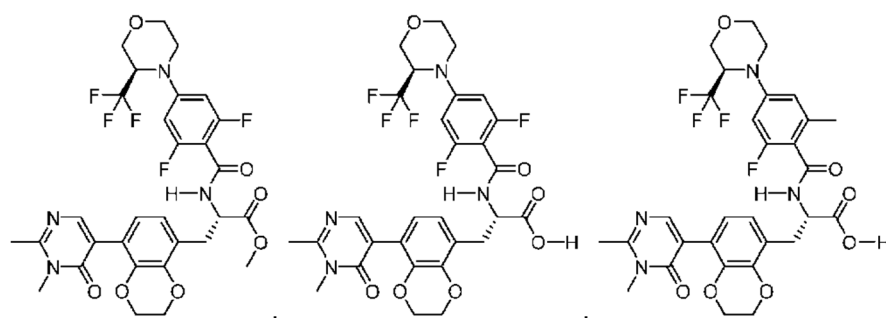
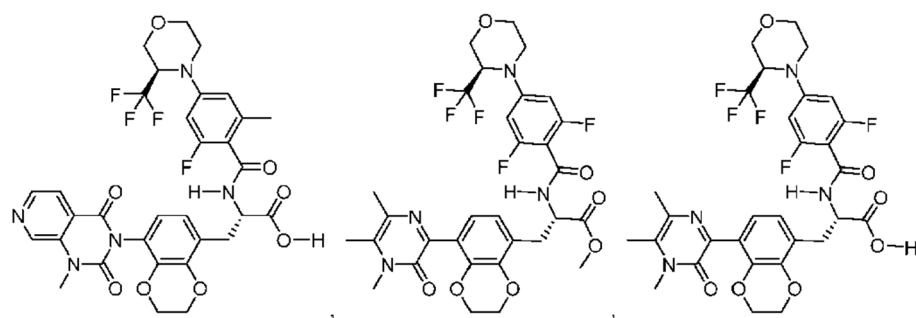


5



3873897

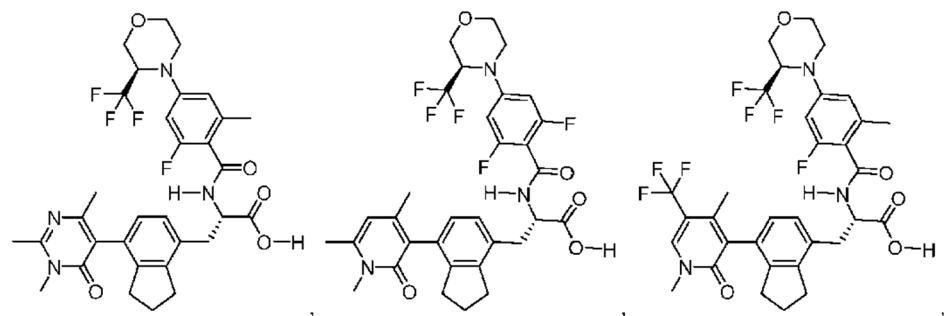
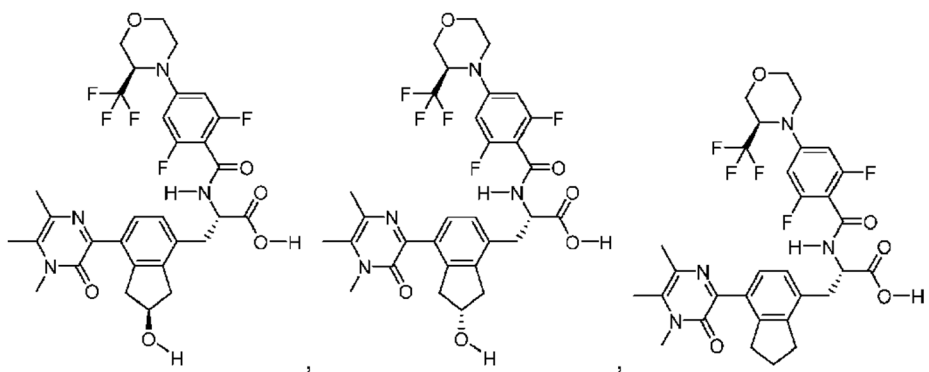
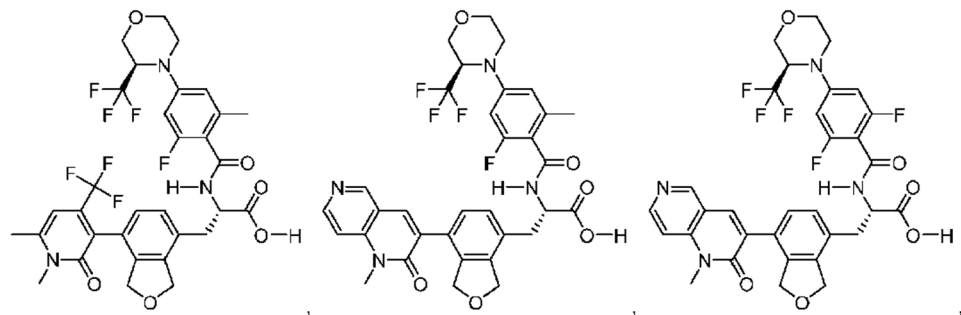
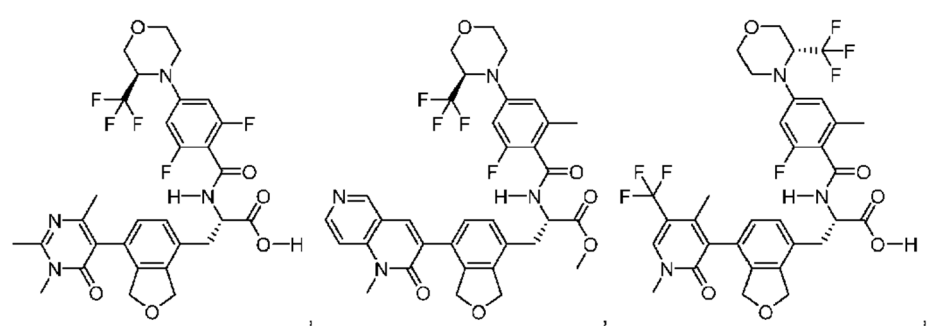
25



5

3873897

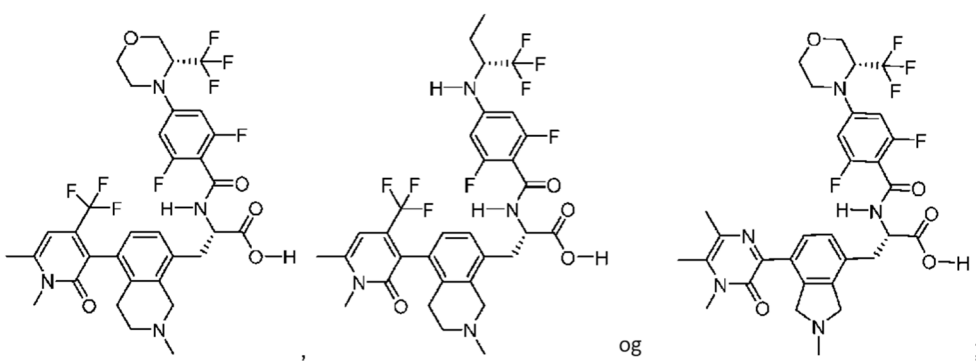
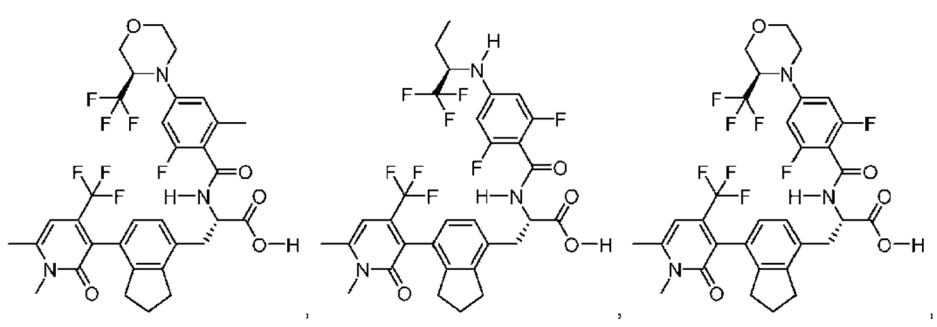
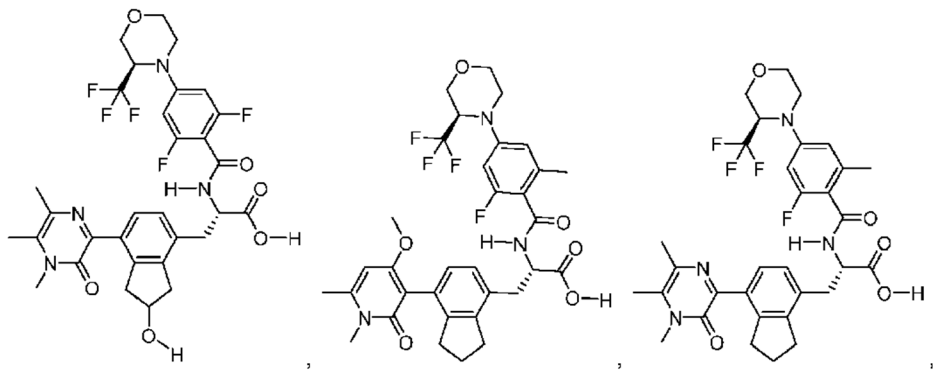
26



5

3873897

27

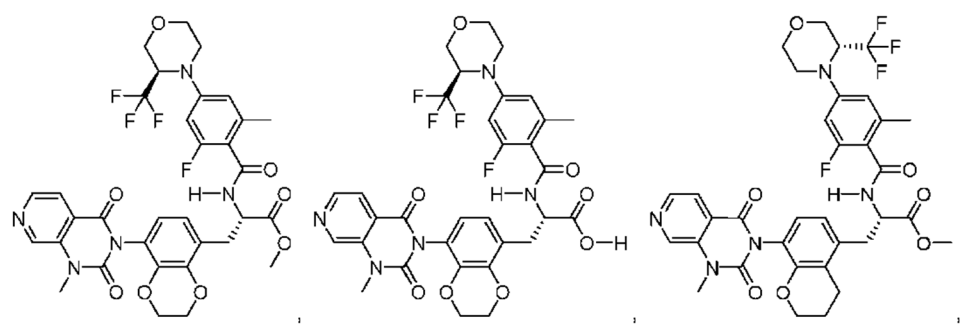


5

og

eller

(C)

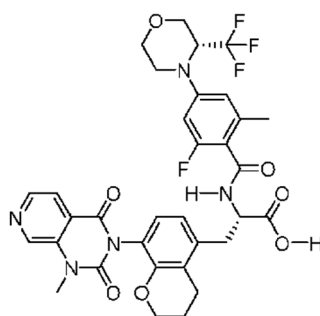


10

og

3873897

28



11. Farmasøytisk sammensetning omfattende en forbindelse ifølge ethvert av kravene 1 til 10, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og minst én farmasøytisk akseptabel bærer.

5

12. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 11, videre omfattende ett eller flere ytterligere terapeutiske midler.

13. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 12, hvor det ene eller de flere ytterligere terapeutiske midlene uavhengig er valgt fra JAK-tyrosinkinasehemmere, TLP2-(Tumor Progression Locus 2)-hemmere og IRAK4-hemmere.

10

14. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 12, hvor det ytterligere terapeutiske middelet er en JAK-tyrosinkinasehemmer og hvor JAK-tyrosinkinasehemmeren er filgotinib.

15

15. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 10, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, eller sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 11 til 14 for bruk i en fremgangsmåte for behandling av en inflammatorisk sykdom eller tilstand mediert av $\alpha 4 \beta 7$ -integrin.