

(19)



SUOMI - FINLAND  
(FI)

PATENTTI- JA REKISTERIHALLITUS  
PATENT- OCH REGISTERSTYRELSEN  
FINNISH PATENT AND REGISTRATION OFFICE

(10)

**FI/EP4004002 T3**

(12)

**EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS  
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT  
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION**

(45)

Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning -  
Translation available to the public

**04.10.2024**

(97)

Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för  
det europeiska patentet - Date of grant of European patent

**10.07.2024**

(51)

Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -  
International patent classification

**C07D 498/16** ( 2006 . 01 )

**C07D 519/00** ( 2006 . 01 )

**A61K 31/4188** ( 2006 . 01 )

**A61P 31/00** ( 2006 . 01 )

**A61P 35/00** ( 2006 . 01 )

**A61P 35/02** ( 2006 . 01 )

(96)

Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan -  
European patent application

**EP20768090.1**

(22)

Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date

**22.07.2020**

(97)

Patenttihakemuksen julkaisepäivä - Patentansökans  
publiceringsdag - Patent application available to the public

**01.06.2022**

(86)

Kansainvälinen hakemus - Internationell  
ansökan - International application

**22.07.2020 PCT/IB2020056875**

(30)

Etuoiikeus - Prioritet - Priority

22.07.2019 IN IN201921029556

10.12.2019 IN IN201921051086

29.01.2020 IN IN202021003961

(73)

Haltija - Innehavare - Holder

**1 • Lupin Limited ,** Kalpataru Inspire 3rd Floor Off Western Express Highway Santacruz (East) Maharashtra , Mumbai 400 055 , (IN)

(72)

Keksijä - Uppfinnare - Inventor

**1 • KARCHE, Navnath Popat ,** Lupin Research Park, Lupin Ltd. Survey No. 46 A 47 A, Village Nande Taluka Mulshi Maharashtra , Pune 412115 , (IN)

**2 • BANERJEE, Moloy ,** Lupin Research Park, Lupin Ltd. Survey No. 46 A 47 A, Village Nande Taluka Mulshi Maharashtra , Pune 412115 , (IN)

**3 • GUPTA, Nishant Ramnivasji ,** Lupin Research Park, Lupin Ltd. Survey No. 46 A 47 A, Village Nande Taluka Mulshi Maharashtra , Pune 412115 , (IN)

**4 • JADHAV, Ganesh Rajaram ,** Lupin Research Park, Lupin Ltd. Survey No. 46 A 47 A, Village Nande Taluka Mulshi Maharashtra , Pune 412115 , (IN)

**5 • VYAVAHARE, Vinod Popatrao ,** Lupin Research Park, Lupin Ltd. Survey No. 46 A 47 A, Village Nande Taluka Mulshi Maharashtra , Pune 412115 , (IN)

**6 • DAS, Amit Kumar ,** Lupin Research Park, Lupin Ltd. Survey No. 46 A 47 A, Village Nande Taluka Mulshi Maharashtra , Pune 412115 , (IN)

**7 • WALKE, Deepak Sahebrao ,** Lupin Research Park, Lupin Ltd. Survey No. 46 A 47 A, Village Nande Taluka Mulshi Maharashtra , Pune 412115 , (IN)

**8 • KALHAPURE, Vaibhav Madhukar ,** Lupin Research Park, Lupin Ltd. Survey No. 46 A 47 A, Village Nande Taluka Mulshi Maharashtra , Pune 412115 , (IN)

**9 • BHOSKAR, Smita Aditya ,** Lupin Research Park, Lupin Ltd. Survey No. 46 A 47 A, Village Nande Taluka Mulshi Maharashtra , Pune 412115 , (IN)

**10 • RAMDAS, Vidya ,** Lupin Research Park, Lupin Ltd. Survey No. 46 A 47 A, Village Nande Taluka Mulshi Maharashtra , Pune 412115 , (IN)

**11 • PALLE, Venkata P. ,** Lupin Research Park, Lupin Ltd. Survey No. 46 A 47 A, Village Nande Taluka Mulshi Maharashtra , Pune 412115 , (IN)

**12 • KAMBOJ, Rajender Kumar ,** Lupin Research Park, Lupin Ltd. Survey No. 46 A 47 A, Village Nande Taluka Mulshi Maharashtra , Pune 412115 , (IN)

(74)

Asiamies - Ombud - Agent

**Murgitroyd & Company ,** Mannerheimsvägen 12B , 00100 Helsingfors , (FI)

(54)

Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

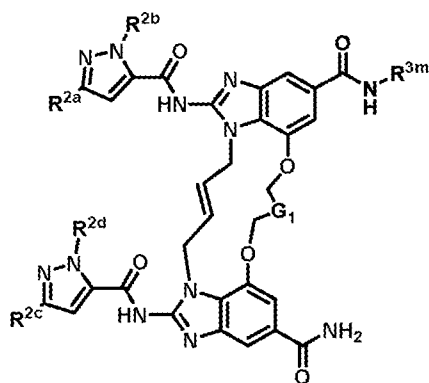
**Makrosyklisiä yhdisteitä STING-agonisteina ja menetelmiä ja niiden käyttötarkoituksia**

**Makrocycliska föreningar som STING-antagonister samt förfaranden och användningar därav**

**MACROCYCLIC COMPOUNDS AS STING AGONISTS AND METHODS AND USES THEREOF**

# Patenttivaatimukset:

1. Kaavan (II) yhdiste, sen tautomeerinen muoto, sen stereoisomeeri, sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, sen hydraatti tai sen solvaatti,



(II)

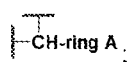
5

jolloin

$R^{3m}$  on valinnaisesti substituoitu sykloalkyyli, valinnaisesti substituoitu heterosyklyyli, valinnaisesti substituoitu heterosyklyylialkyyli, valinnaisesti substituoitu heteroaryylialkyyli ja valinnaisesti substituoitu aryylialkyyli;

10

$G_1$  on valittu toisistaan riippumatta joukosta  $-CH_2-$  tai



rengas A on valinnaisesti substituoitu heterosyklyyli ja valinnaisesti substituoitu heteroaryyli;

15

$R^{2a}$ ,  $R^{2b}$ ,  $R^{2c}$  ja  $R^{2d}$  on kukin valittu toisistaan riippumatta joukosta vety, valinnaisesti substituoitu  $C_1$ - $C_6$ -alkyyli ja valinnaisesti substituoitu monosyklinen  $C_3$ - $C_5$ -sykloalkyyli; kun 'alkyyli'-ryhmä on substituoitu, se on substituoitu 1–4 substituentilla, jotka on valittu toisistaan riippumatta joukosta halogeeni, okso ( $=O$ ), alkyyli, perhaloalkyyli, sykloalkyyli, aryyli, heteroaryyli, heterosyklyyli,  $-N(R^4)_2$ ,  $-C(=O)OH$ ,  $-N(H)-SO_2$ -alkyyli ja  $-OR^4$ ;

20

kun 'karbosykli'- tai 'sykloalkyyli'-ryhmä on substituoitu, se on substituoitu 1–4 substituentilla, jotka on valittu toisistaan riippumatta joukosta halogeeni, alkyyli, perhaloalkyyli, heteroaryyli, heterosyklyyli,  $-N(R^4)_2$ ,  $-C(=O)OH$  ja  $-OR^4$ ;

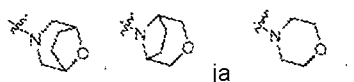
25

kun 'heterosykli'- tai 'heterosyklyyli'-ryhmä on substituoitu, se on substituoitu 1–4 substituentilla, jotka on valittu toisistaan riippumatta joukosta okso ( $=O$ ), halogeeni, syano, alkyyli, perhaloalkyyli, heterosyklyyli,  $-OR^4$ ,  $-OP(O)(OR^4)_2$ ,  $-P(O)(OR^4)_2$ ,  $-P(O)(OR^4)R^{4a}$ ,  $-SO_2R^{4a}$ ,  $-C(=O)OH$ ,  $-C(=O)N(H)R^4$ ,  $-C(=O)N(alkyyli)R^4$ ,  $-N(H)C(=O)R^{4a}$ ,  $-N(H)-SO_2$ -alkyyli,  $-N(H)R^4$  ja  $-N(alkyyli)R^4$ ;

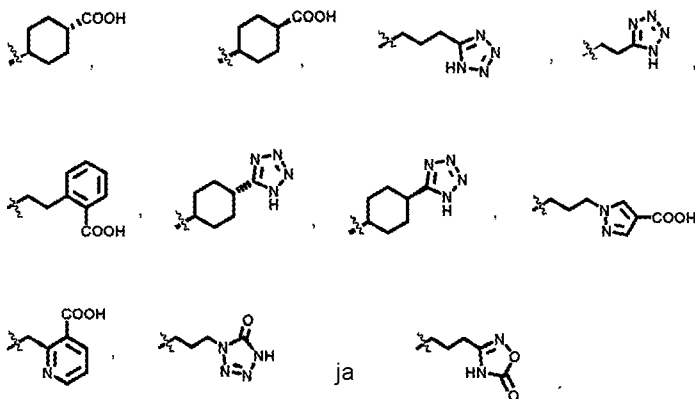
kun 'aryyli'-ryhmä on substituoitu, se on substituoitu 1–4 substituentilla, jotka on

- valittu joukosta halogeeni, syano, alkyyli, perhaloalkyyli, sykloalkyyli, heterosyklyyli, -O-alkyyli, -O-perhaloalkyyli, -N(alkyyli)alkyyli, -N(H)alkyyli, -SO<sub>2</sub>-alkyyli, -N(alkyyli)C(=O)alkyyli, -N(H)C(=O)alkyyli, -C(=O)N(alkyyli)alkyyli, -C(=O)N(H)alkyyli, -C(=O)NH<sub>2</sub>, -SO<sub>2</sub>N(alkyyli)alkyyli, -SO<sub>2</sub>N(H)alkyyli, -SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -OP(O)(OR<sup>4</sup>)<sub>2</sub>, -P(O)(OR<sup>4</sup>)<sub>2</sub>, -P(O)(OR<sup>4</sup>)R<sup>4a</sup> ja -C(=O)OH;
- 5 kun 'heteroaryyli'-ryhmä on substituoitu, se on substituoitu 1–4 substituentilla, jotka on valittu joukosta halogeeni, syano, alkyyli, perhaloalkyyli, sykloalkyyli, heterosyklyyli, -O-alkyyli, -O-perhaloalkyyli, -N(alkyyli)alkyyli, -N(H)alkyyli, -SO<sub>2</sub>-alkyyli, -N(alkyyli)C(=O)alkyyli, -N(H)C(=O)alkyyli, -C(=O)N(alkyyli)alkyyli, -C(=O)N(H)alkyyli, -C(=O)NH<sub>2</sub>, -SO<sub>2</sub>N(alkyyli)alkyyli, -SO<sub>2</sub>N(H)alkyyli, -SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, -OP(O)(OR<sup>4</sup>)<sub>2</sub>, -P(O)(OR<sup>4</sup>)<sub>2</sub>, -P(O)(OR<sup>4</sup>)R<sup>4a</sup> ja -C(=O)OH;
- 10 kukin R<sup>4</sup> on valittu toisistaan riippumatta joukosta vety, alkyyli ja sykloalkyyli; kukin R<sup>4a</sup> on valittu toisistaan riippumatta joukosta alkyyli ja sykloalkyyli.

- 15 2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, jolloin rengas A on valittu joukosta



3. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, jolloin R<sup>3m</sup> on valittu joukosta



- 25 4. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, jolloin yhdiste on valittu joukosta:  
(1S,4S)-4-((E)-12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetraatsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)sykloheksaani-1-karboksyylihappo (yhdiste 1);
- 30 (1R,4R)-4-((E)-12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetraatsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)sykloheksaani-1-karboksyylihappo (yhdiste 2);

- (E)-N-(3-(1H-tetratsol-5-yyli)propyyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 3);
- 5 (E)-N-(2-(1H-tetratsol-5-yyli)etyyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 4);
- (E)-2-(2-(12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)etyyli)bentsoehappo (yhdiste 5);
- 10 (E)-N-((1R,4R)-4-(1H-tetratsol-5-yyli)sykloheksyyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 6);
- (E)-N-((1S,4S)-4-(1H-tetratsol-5-yyli)sykloheksyyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 7);
- 15 (E)-1-(3-(12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)propyyli)-1H-pyratsoli-4-karboksyylihappo (yhdiste 8);
- 20 (E)-2-((12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)metyyli)nikotiinihappo (yhdiste 9);
- (E)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-N-(3-(5-okso-4,5-dihydro-1H-tetratsol-1-yyli)propyyli)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-
- 25 2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 10);
- (E)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-N-(3-(5-okso-4,5-dihydro-1,2,4-oksadiatsol-3-yyli)propyyli)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-
- 30 2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 11);
- (8S,E)-N4-((1R,4S)-4-(1H-tetratsol-5-yyli)sykloheksyyli)-8-(3-oksa-8-atsabisyklo[3.2.1]oktan-8-yyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste
- 35 12);
- (8R,E)-N4-((1R,4R)-4-(1H-tetratsol-5-yyli)sykloheksyyli)-8-(3-oksa-8-atsabisyklo[3.2.1]oktan-8-yyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-

- karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 13);
- 5 (1S,4R)-4-((8S,E)-8-(3-oksa-8-atsabisyklo[3.2.1]oktan-8-yyli)-12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)sykloheksaani-1-karboksyylihappo (yhdiste 14);
- 10 (1R,4R)-4-((8R,E)-8-(3-oksa-8-atsabisyklo[3.2.1]oktan-8-yyli)-12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)sykloheksaani-1-karboksyylihappo (yhdiste 15);
- 15 (8S,E)-N4-(3-(1H-tetratsol-5-yyli)propyyli)-8-(3-oksa-8-atsabisyklo[3.2.1]oktan-8-yyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 16);
- (8R,E)-N4-(3-(1H-tetratsol-5-yyli)propyyli)-8-(3-oksa-8-atsabisyklo[3.2.1]oktan-8-yyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka(3,2,1-cd:8,9,10-c'd')di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 17);
- 20 1-(3-((8S,E)-8-(3-oksa-8-atsabisyklo[3.2.1]oktan-8-yyli)-12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)propyyli)-1H-pyratsoli-4-karboksyylihappo (yhdiste 18);
- 25 1-(3-((8R,E)-8-(3-oksa-8-atsabisyklo[3.2.1]oktan-8-yyli)-12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)propyyli)-1H-pyratsoli-4-karboksyylihappo (yhdiste 19);
- 30 (1R,4R)-4-((E)-8-(8-oksa-3-atsabisyklo[3.2.1]oktan-3-yyli)-12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)sykloheksaani-1-karboksyylihappo (yhdiste 20);
- (E)-N-(3-(1H-tetratsol-5-yyli)propyyli)-8-(8-oksa-3-atsabisyklo[3.2.1]oktan-3-yyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 21);
- 35 (E)-N-((1R,4R)-4-(1H-tetratsol-5-yyli)sykloheksyyli)-8-(8-oksa-3-atsabisyklo[3.2.1]oktan-3-yyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-

- karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 22);
- 5 (E)-1-(3-(8-(8-oksa-3-atsabisyklo[3.2.1]oktan-3-yyli)-12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)propyyli)-1H-pyratsoli-4-karboksyylihappo (yhdiste 23);
- 10 (E)-N-((1R,4R)-4-(1H-tetratsol-5-yyli)sykloheksyyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8-morfolino-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 24);
- 15 (E)-N-(3-(1H-tetratsol-5-yyli)propyyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8-morfolino-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 25);
- (1R,4R)-4-((E)-12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8-morfolino-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)sykloheksaani-1-karboksyylihappo (yhdiste 26);
- 20 (E)-1-(3-(12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8-morfolino-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)propyyli)-1H-pyratsoli-4-karboksyylihappo (yhdiste 27);
- 25 (E)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-N-(2-morfolinoetyyli)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 28);
- (E)-(12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karbonyyli)glysiini (yhdiste 29);
- 30 (E)-N-(2-(8-oksa-3-atsabisyklo[3.2.1]oktan-3-yyli)etyyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka(3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 30);
- 35 (E)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-N-(3-morfolinopropyyli)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 32);

- (E)-N-(3-(8-oksa-3-atsabisyklo[3.2.1]oktan-3-yyli)propyyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 33);
- 5 (E)-N-(4-(8-oksa-3-atsabisyklo[3.2.1]oktan-3-yyli)butyyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 34);
- 10 (E)-(2-(4-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-12-karboksamido)etyyli)-L-proliini (yhdiste 35);
- (E)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-N-(3-(4-(metyylisulfonyyli)piperatsin-1-yyli)propyyli)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-
- 15 dikarboksamidi (yhdiste 36);
- (E)-N-(3-(4,4-difluoripiperidin-1-yyli)propyyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 37);
- 20 (E)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-N-(4-morfolinobutyyli)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 38);
- (E)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-N-(3-(4-fluoripiperidin-1-yyli)propyyli)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-
- 25 atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 39);
- (R,E)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-N-(3-(3-fluoripyrrolidin-1-yyli)propyyli)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi
- 30 (yhdiste 41);
- (S,E)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-N-(3-(3-fluoripyrrolidin-1-yyli)propyyli)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi
- (yhdiste 42);
- 35 (E)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-N-(3-(4-(metyylisulfonyyli)piperidin-1-yyli)propyyli)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-

- dikarboksamidi (yhdiste 44);
- 5 (E)-N-(3-(3,3-difluoripyrrolidin-1-yyli)propyyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetraatsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 45);
- (E)-N-(3-((2R,6S)-2,6-dimetyylimorfolino)propyyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetraatsasyklopentadeka(3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 46);
- 10 (E)-N-(3-(1,1-dioksidotiomorfolino)propyyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetraatsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 47);
- 15 (E)-N-(3-(1H-imidatsol-1-yyli)propyyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetraatsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 48);
- (E)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-N-(3-(pyridin-2-yyli)propyyli)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetraatsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 50);
- 20 (E)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-N-(3-(4-(trifluorimetyyli)piperidin-1-yyli)propyyli)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetraatsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 51);
- 25 (E)-N-(3-(3,3-dimetyylimorfolino)propyyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetraatsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 52);
- 30 (E)-N,N'-(12-karbamoyyli-4-(1H-tetratsol-5-yyli)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetraatsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-1,15-diiyli)bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamidi (yhdiste 54);
- (1S,3S)-3-((E)-12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetraatsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)syklobutaani-1-karboksyylihappo (yhdiste 55);
- 35 (1R,3R)-3-((E)-12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-

- karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)syklobutaani-1-karboksyylihappo (yhdiste 56);
- (E)-1-((12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)metyyli)syklopropaani-1-karboksyylihappo (yhdiste 57);
- (E)-2-(2-(12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)etyyli)nikotiinihappo (yhdiste 58);
- (E)-2-(3-(12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)propyyli)bentsoehappo (yhdiste 59);
- (E)-N-(3-(4-etoksi-4-oksidio-1,4-atsafosfinan-1-yyli)propyyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 60).
5. Jonkin patenttivaatimuksista 1–4 mukainen yhdiste, jolloin yhdiste on valittu joukosta:
- (1S,4S)-4-((E)-12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)sykloheksaani-1-karboksyylihappo (yhdiste 1);
- (1R,4R)-4-((E)-12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)sykloheksaani-1-karboksyylihappo (yhdiste 2);
- (E)-N-(3-(1H-tetratsol-5-yyli)propyyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 3);
- (E)-N-(2-(1H-tetratsol-5-yyli)etyyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 4);
- (E)-2-(2-(12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)etyyli)bentsoehappo (yhdiste 5);

- (E)-N-((1R,4R)-4-(1H-tetratsol-5-yyli)sykloheksyyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetraatsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 6);
- 5 (E)-N-((1S,4S)-4-(1H-tetratsol-5-yyli)sykloheksyyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetraatsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 7);
- (E)-1-(3-(12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetraatsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)propyyli)-1H-pyratsoli-4-karboksyylihappo
- 10 (yhdiste 8);
- (E)-2-((12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetraatsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)metyyli)nikotiinihappo (yhdiste 9);
- (E)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-N-(3-(5-okso-4,5-
- 15 dihydro-1H-tetratsol-1-yyli)propyyli)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetraatsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 10);
- (E)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-N-(3-(5-okso-4,5-
- 20 dihydro-1,2,4-oksadiatsol-3-yyli)propyyli)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetraatsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 11);
- (8S,E)-N4-((1R,4S)-4-(1H-tetratsol-5-yyli)sykloheksyyli)-8-(3-oksa-8-
- 25 atsabisyklo[3.2.1]oktan-8-yyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetraatsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 12);
- (8R,E)-N4-((1R,4R)-4-(1H-tetratsol-5-yyli)sykloheksyyli)-8-(3-oksa-8-
- 30 atsabisyklo[3.2.1]oktan-8-yyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetraatsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 13);
- (1S,4R)-4-((8S,E)-8-(3-oksa-8-atsabisyklo[3.2.1]oktan-8-yyli)-12-karbamoyyli-1,15-
- 35 bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetraatsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)sykloheksaani-1-karboksyylihappo (yhdiste 14);
- (1R,4R)-4-((8R,E)-8-(3-oksa-8-atsabisyklo[3.2.1]oktan-8-yyli)-12-karbamoyyli-1,15-
- bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-

- dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)sykloheksaani-1-karboksyyliahappo (yhdiste 15);  
 (8S,E)-N4-(3-(1H-tetratsol-5-yyli)propyyli)-8-(3-oksa-8-atsabisyklo[3.2.1]oktan-8-yyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-  
 5 7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 16);  
 (8R,E)-N4-(3-(1H-tetratsol-5-yyli)propyyli)-8-(3-oksa-8-atsabisyklo[3.2.1]oktan-8-yyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-  
 10 7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 17);  
 1-(3-((8S,E)-8-(3-oksa-8-atsabisyklo[3.2.1]oktan-8-yyli)-12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-  
 2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)propyyli)-1H-pyratsoli-4-karboksyyliahappo (yhdiste 18);  
 15 1-(3-((8R,E)-8-(3-oksa-8-atsabisyklo[3.2.1]oktan-8-yyli)-12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-  
 2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)propyyli)-1H-pyratsoli-4-karboksyyliahappo (yhdiste 19);  
 (1R,4R)-4-((E)-8-(8-oksa-3-atsabisyklo[3.2.1]oktan-3-yyli)-12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-  
 20 dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)sykloheksaani-1-karboksyyliahappo (yhdiste 20);  
 (E)-N-(3-(1H-tetratsol-5-yyli)propyyli)-8-(8-oksa-3-atsabisyklo[3.2.1]oktan-3-yyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-  
 25 6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 21);  
 (E)-N-((1R,4R)-4-(1H-tetratsol-5-yyli)sykloheksyyli)-8-(8-oksa-3-atsabisyklo[3.2.1]oktan-3-yyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-  
 30 atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 22);  
 (E)-1-(3-(8-(8-oksa-3-atsabisyklo[3.2.1]oktan-3-yyli)-12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-  
 35 2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)propyyli)-1H-pyratsoli-4-karboksyyliahappo (yhdiste 23);  
 (E)-N-((1R,4R)-4-(1H-tetratsol-5-yyli)sykloheksyyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8-morfolino-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-

- 2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 24);
- (E)-N-(3-(1H-tetratsol-5-yyli)propyyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8-morfolino-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 25);
- (1R,4R)-4-((E)-12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8-morfolino-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)sykloheksaani-1-karboksyylihappo (yhdiste 26);
- (E)-1-(3-(12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8-morfolino-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)propyyli)-1H-pyratsoli-4-karboksyylihappo (yhdiste 27).
6. Jonkin patenttivaatimuksista 1–4 mukainen yhdiste, jolloin yhdiste on valittu joukosta:
- (1R,4R)-4-((E)-12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)sykloheksaani-1-karboksyylihappo (yhdiste 2);
- (E)-N-((1R,4R)-4-(1H-tetratsol-5-yyli)sykloheksyyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 6);
- (E)-1-(3-(12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)propyyli)-1H-pyratsoli-4-karboksyylihappo (yhdiste 8);
- (8S,E)-N4-((1R,4S)-4-(1H-tetratsol-5-yyli)sykloheksyyli)-8-(3-oksa-8-atsabisyklo[3.2.1]oktan-8-yyli)-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4,12-dikarboksamidi (yhdiste 12);
- (1S,4R)-4-((8S,E)-8-(3-oksa-8-atsabisyklo[3.2.1]oktan-8-yyli)-12-karbamoyyli-1,15-bis(1-etyyli-3-metyyli-1H-pyratsoli-5-karboksamido)-8,9,16,19-tetrahydro-7H-6,10-dioksa-2,14,15a,19a-tetra-atsasyklopentadeka[3,2,1-cd:8,9,10-c'd']di-indeeni-4-karboksamido)sykloheksaani-1-karboksyylihappo (yhdiste 14).

7. Farmaseuttinen koostumus, joka käsittää jonkin patenttivaatimuksista 1–6 mukaista kaavan (II) yhdistettä tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävää suolaa ja vähintään yhtä tai useampaa farmaseuttisesti hyväksyttävää apuainetta.
- 5 8. Jonkin patenttivaatimuksista 1–6 mukainen kaavan II yhdiste käytettäväksi sellaisen sairauden tai tilan hoidossa, jossa STING:n aktivointi on hyödyllistä sen tarpeessa olevalla yksilöllä, joka käyttö käsittää sen, että annetaan yksilölle terapeuttisesti tehokas määrä jonkin patenttivaatimuksista 1–6 mukaista kaavan (II) yhdistettä tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävää suolaa.
- 10 9. Jonkin patenttivaatimuksista 1–6 mukainen kaavan II yhdiste käytettäväksi sairauden tai tilan hoidossa patenttivaatimuksen 8 mukaisesti, jolloin sairaus tai tila on syöpä tai yksi tai useampia infektiosairauksia.
- 15 10. Jonkin patenttivaatimuksista 1–6 mukainen kaavan II yhdiste käytettäväksi sairauden tai tilan hoidossa patenttivaatimuksen 8 mukaisesti, jolloin sairaus tai tila on syöpä ja jolloin syöpä on yksi tai useampia kiinteitä kasvaimia, leukemia, lymfooma tai niiden yhdistelmä.
- 20 11. Jonkin patenttivaatimuksista 1–6 mukainen kaavan II yhdiste käytettäväksi sairauden tai tilan hoidossa patenttivaatimuksen 8 mukaisesti, jolloin sairaus tai tila on yksi tai useampia infektiosairauksia, jolloin infektiosairaus on virusinfektio, bakteeri-infektio tai niiden yhdistelmä.
- 25 12. Jonkin patenttivaatimuksista 1–6 mukainen kaavan II yhdiste käytettäväksi syövän hoidossa patenttivaatimuksen 10 mukaisesti, jolloin syöpä on valittu joukosta aivosyöpä, munuaissyöpä, kivessyöpä, virtsaputken syöpä, peräsuolisyöpä, munanjohdinsyöpä, penissyöpä, emätinsyöpä, mahasyöpä, ihosyöpä, maksasyöpä, maha-suolikanavan stroomakasvaimet, uroteelisyöpä, kilpirauhassyöpä,
- 30 lisäkilpirauhassyöpä, lisämunuaissisyöpä, luusyöpä, suusyöpä, munasarjasyöpä, kohtusyöpä, pään ja kaulan okasolukarsinooma, kohdun limakalvon syöpä, sappirakkosyöpä, munuaissyöpä, virtsarakkosyöpä, orofyrangeaalisyöpä, imusolmukeisyöpä, glioblastooma, astrozytooma, glioblastooma multiforme tai pehmytkudossarkoomat, fibrosarkooma, kondrosarkooma, hemangiooma,
- 35 teratooma, lipooma, myksooma, fibrooma, rabdomyooma, teratooma, kolangiokarsinooma, myelooma, Ewingin sarkooma, myelooma, Hodgkinin tauti, non-Hodgkinin lymfooma, follikulaarinen lymfooma, manttelisolulymfooma, Burkittin

- lymfooma, lymfoblastinen T-solulymfooma, marginaalivyyhkelymfooma, kutaaninen T-solulymfooma, CNS-lymfooma, pieni lymfosyyttinen lymfooma, lymfoplasmasyyttinen lymfooma, diffuusi suurisoluinen lymfooma (DLBCL), perifeerinen T-solulymfooma, anaplastinen suurisoluinen lymfooma, primaarinen
- 5 mediastinaalinen lymfooma, mykosis fungoides, pilkkoutumaton pienisoluinen lymfooma, lymfoblastinen lymfooma, immunoblastinen lymfooma, primaarinen effuusiolympooma, HIV:hen liittyvät (tai AIDS:iin liittyvät) lymfoomat, lymfoblastinen T-soluleukemia, krooninen myeloinen leukemia, akuutti lymfoblastinen T-soluleukemia, lymfoblastinen T-soluleukemia, akuutti myeloblastinen leukemia,
- 10 karvasoluleukemia, krooninen neutrofiilinen leukemia, manttelisoluleukemia, akuutti megakaryosyyttinen leukemia, multippeli myelooma, megakaryoblastinen leukemia, erytroleukemia, plasmasytooma, promyelosyyttinen leukemia, krooninen myelomonosyyttinen leukemia, myelodysplastinen oireyhtymä, myelofibroosi, krooninen myeloinen leukemia, polysytemia vera, trombosytemia, krooninen
- 15 lymfosyyttinen leukemia, prolymfosyyttinen leukemia, karvasoluleukemia, Waldenströmin makroglobulinemia, Castlemanin tauti, krooninen neutrofiilinen leukemia, immunoblastinen suurisoluinen leukemia ja plasmasytooma.
13. Jonkin patenttivaatimuksista 1–6 mukainen kaavan II yhdiste käytettäväksi
- 20 virusinfektion hoidossa patenttivaatimuksen 11 mukaisesti, jolloin virusinfektio on HIV-, HPV-, HCV-, HBV-, alfavirus-, rotavirus- tai influenssainfektio.
14. Jonkin patenttivaatimuksista 1–6 mukainen kaavan II yhdiste käytettäväksi
- 25 sairauden tai tilan hoidossa patenttivaatimuksen 8 mukaisesti, jolloin yhdistettä käytetään yhden tai useamman lisäterapian yhteydessä.
15. Jonkin patenttivaatimuksista 1–6 mukainen kaavan II yhdiste käytettäväksi
- 30 sairauden tai tilan hoidossa yhden tai useamman lisäterapian yhteydessä patenttivaatimuksen 14 mukaisesti, jolloin lisäterapiat ovat kemoterapia, immunoterapia, radioterapia tai niiden yhdistelmä.
16. Jonkin patenttivaatimuksista 1–6 mukainen kaavan II yhdiste käytettäväksi
- 35 sairauden tai tilan hoidossa patenttivaatimuksen 8 mukaisesti, jolloin yhdistettä käytetään rokotteen adjuvanttina.
17. Koostumus, joka käsittää (i) jonkin patenttivaatimuksista 1–6 mukaista kaavan (II) yhdistettä tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävää suolaa, ja {ii} yhtä tai useampaa

antigeeniä, yhtä tai useampaa antigeenikoostumusta tai niiden yhdistelmää.