

(19)



SUOMI - FINLAND  
(FI)

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

(10)

**FI/EP3976597 T3**

(12)

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

(45)

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

**25.09.2024**

(97)

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

**28.08.2024**

(51)

Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -  
International patent classification

**C07D 401/10** ( 2006 . 01 )

**C07D 403/10** ( 2006 . 01 )

**C07D 413/10** ( 2006 . 01 )

**C07D 417/10** ( 2006 . 01 )

**C07D 487/04** ( 2006 . 01 )

**C07D 513/04** ( 2006 . 01 )

**A61K 31/4709** ( 2006 . 01 )

**A61K 31/5025** ( 2006 . 01 )

**A61K 31/519** ( 2006 . 01 )

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

(96)

Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan -  
European patent application

**EP20733688.4**

(22)

Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date

**29.05.2020**

(97)

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

**06.04.2022**

(86)

Kansainvälinen hakemus - Internationell  
ansökan - International application

**29.05.2020 PCT/EP2020065024**

(30)

Etuoiikeus - Prioritet - Priority

31.05.2019 US US201962855144 P

30.09.2019 US US201962907833 P

(73)

Haltija - Innehavare - Holder

**1 • Janssen Pharmaceutica NV**, Turnhoutseweg 30, 2340 Beerse, (BE)

(72)

Keksijä - Uppfinnare - Inventor

**1 • BARBAY, J. Kent**, 1400 McKean Road, Spring House, Pennsylvania 19477, (US)

**2 • CHAI, Wenying**, 3210 Merryfield Row, San Diego, California 92121, (US)

**3 • ECCLES, Wendy**, 3210 Merryfield Row, San Diego, California 92121, (US)

**4 • HACK, Michael D.**, 3210 Merryfield Row, San Diego, California 92121, (US)

**5 • HERRMANN, Aaron T.**, 3210 Merryfield Row, San Diego, California 92121, (US)

**6 • JONES, William M.**, 1400 McKean Road, Spring House, Pennsylvania 19477, (US)

**7 • KRAWCZUK, Paul J.**, 1400 McKean Road, Spring House, Pennsylvania 19477, (US)

**8 • KREUTTER, Kevin D.**, 15 Fountain Road, Arlington, Massachusetts 02476, (US)

**9 • LEBSACK, Alec D.**, 3210 Merryfield Row, San Diego, California 92121, (US)

**10 • PIPPEL, Daniel J.**, 3210 Merryfield Row, San Diego, California 92121, (US)

**11 • ROVIRA, Alexander R.**, 3210 Merryfield Row, San Diego, California 92121, (US)

**12 • WOLIN, Ronald L.**, 3210 Merryfield Row, San Diego, California 92121, (US)

(74)

Asiamies - Ombud - Agent

**Zacco Sweden AB**, P.O. Box 5581 Löjtnantsgatan 21, 114 85 Stockholm, (SE)

(54)

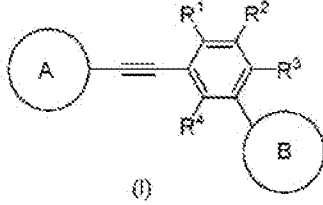
Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

**NF-KB:TÄ INDUSOIVAN KINAASIN PIENIMOLEKYLLISIÄ ESTÄJIÄ**

**SMALL MOLECULE INHIBITORS OF NF-KB INDUCING KINASE**

**Patenttivaatimukset**

1. Yhdiste, jolla on kaava (I), tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola,



5 jossa

R<sup>1</sup> on H tai CH<sub>3</sub>;

R<sup>2</sup> on H tai CH<sub>3</sub>;

R<sup>3</sup> on H, -C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-alkyyli, -OCH<sub>3</sub> tai -O-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-halogeenialkyyli;

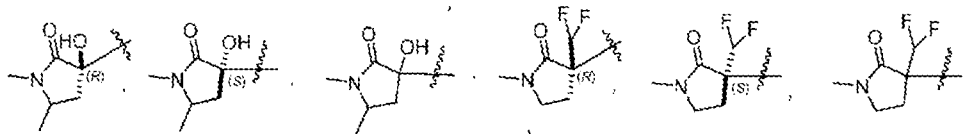
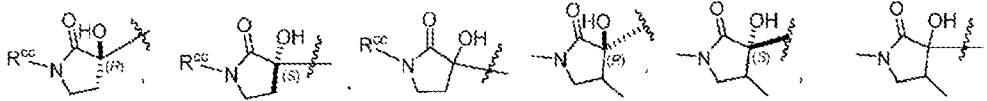
R<sup>4</sup> on H tai CH<sub>3</sub>;

10

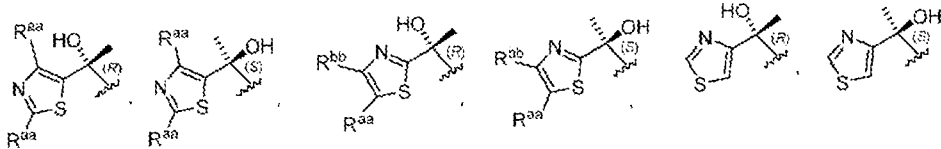
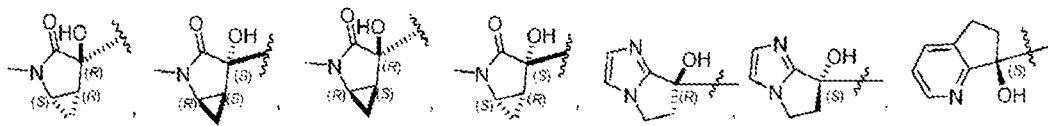
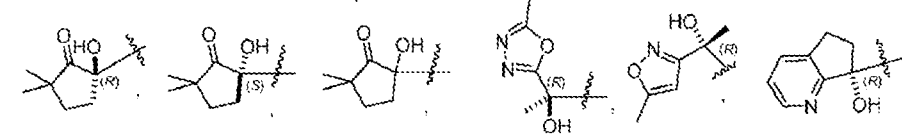
ryhmä



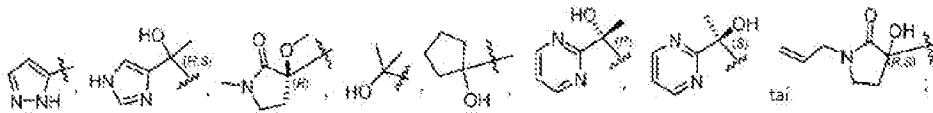
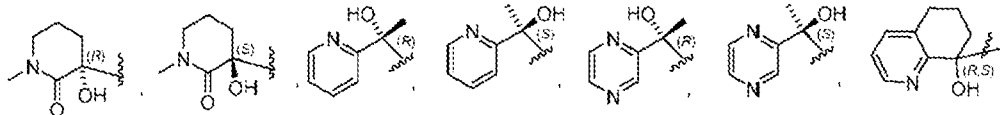
on



15



20



R<sup>aa</sup> on H tai -CH<sub>3</sub>;



R<sup>6</sup> on H tai -C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyyli;

R<sup>7</sup> on H, -C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyyli, -SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -COCH<sub>3</sub>, -C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-halogeenialkyyli tai -CH<sub>2</sub>CN,

tai R<sup>6</sup> ja R<sup>7</sup> muodostavat yhdessä niihin sitoutuneen typhen kanssa ryhmän

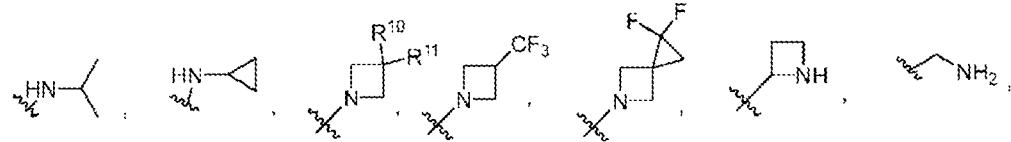
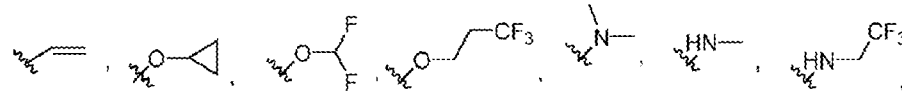
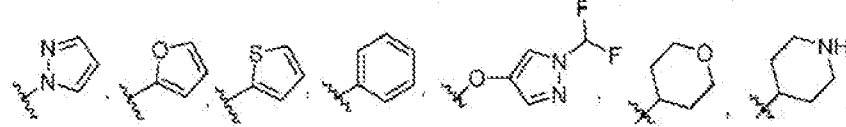


jossa m on 0 tai 1 ja p on 0 tai 1;

R<sup>8</sup> on H, F tai -C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyyli;

R<sup>9</sup> on H, F tai -C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyyli;

R<sup>e</sup> on H, -CD<sub>3</sub>, Br, -C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-alkyyli, -C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-sykloalkyyli,



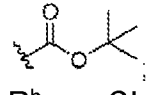
tai

-C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-alkyyli, joka on substituoitu 1-3 R<sup>9</sup>-ryhmällä, jolloin R<sup>9</sup> on -NH<sub>2</sub> tai F;

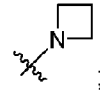
R<sup>10</sup> on H tai F;

R<sup>11</sup> on H tai F;

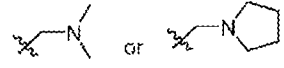
R<sup>f</sup> on H, -CH<sub>3</sub> tai



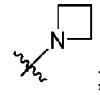
R<sup>h</sup> on -CH<sub>3</sub>, -NH<sub>2</sub> tai



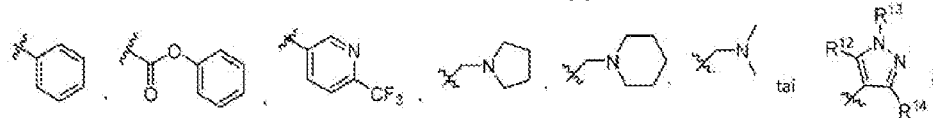
R<sup>i</sup> on H, -CH<sub>3</sub>, -CN, Br,



R<sup>j</sup> on -NH<sub>2</sub> tai



R<sup>k</sup> on H, -CF<sub>3</sub>, I, Cl, Br, -CN, -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyyli,

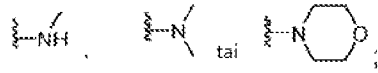


R<sup>12</sup> on H tai -CH<sub>3</sub>;

R<sup>13</sup> on H, -CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>(C)(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>OH, -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>CN tai -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>;

R<sup>14</sup> on H tai -CH<sub>3</sub>;

R<sup>l</sup> on H, -C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyyli, -CF<sub>3</sub>,



R<sup>m</sup> on H tai -CH<sub>3</sub>;

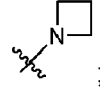
R<sup>n</sup> on -NH<sub>2</sub>;

5 R<sup>o</sup> on H tai -CH<sub>3</sub>;

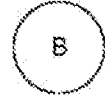
R<sup>p</sup> on H tai -CH<sub>3</sub>;

R<sup>q</sup> on H, -CN, F, Cl, -OCH<sub>3</sub>, -CF<sub>3</sub> tai -CH<sub>3</sub>; ja

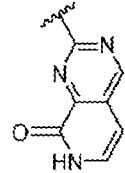
R<sup>s</sup> on -NH<sub>2</sub> tai



10 edellyttäen, että kun ryhmä



on

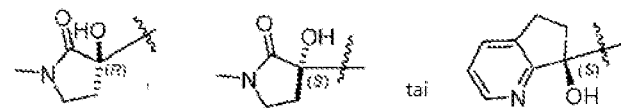


ja kukin R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> ja R<sup>4</sup> on H, ryhmä

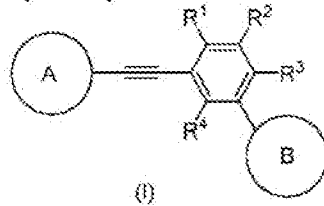


15 on

on



20 **2.** Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, jolla on kaava (I), tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola,



jossa

i)

25 R<sup>1</sup> on H tai CH<sub>3</sub>;

R<sup>2</sup> on H tai CH<sub>3</sub>;

R<sup>3</sup> on H, -C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-alkyyli, -OCH<sub>3</sub> tai -O-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-halogeenialkyyli;

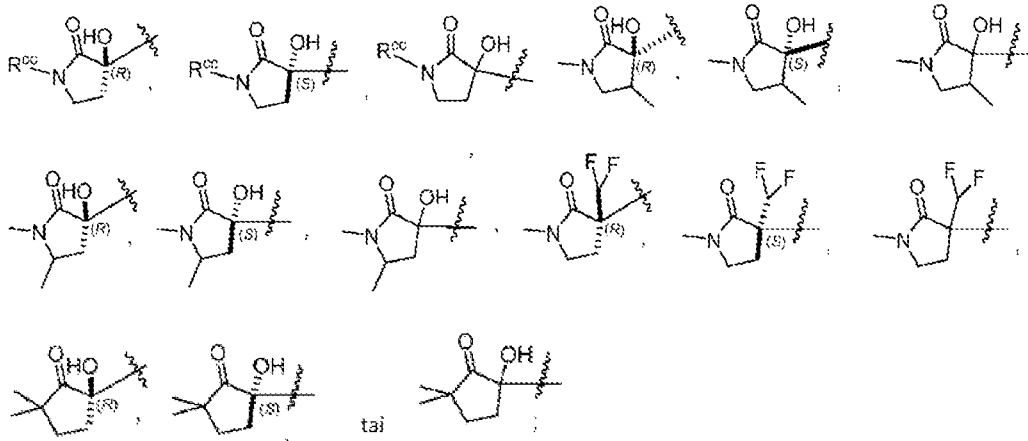
R<sup>4</sup> on H tai CH<sub>3</sub>;

ryhmä



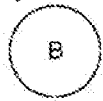
30 on

on

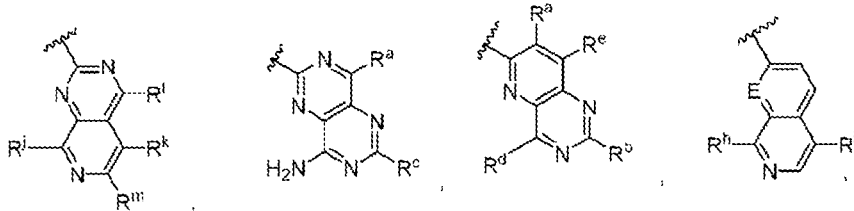


5

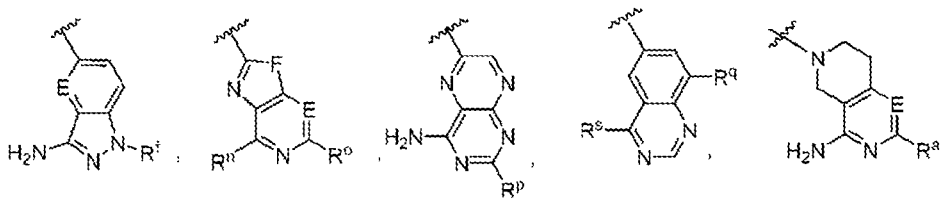
R<sup>cc</sup> on -CH<sub>3</sub>, -CD<sub>3</sub> tai -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>;  
ryhmä



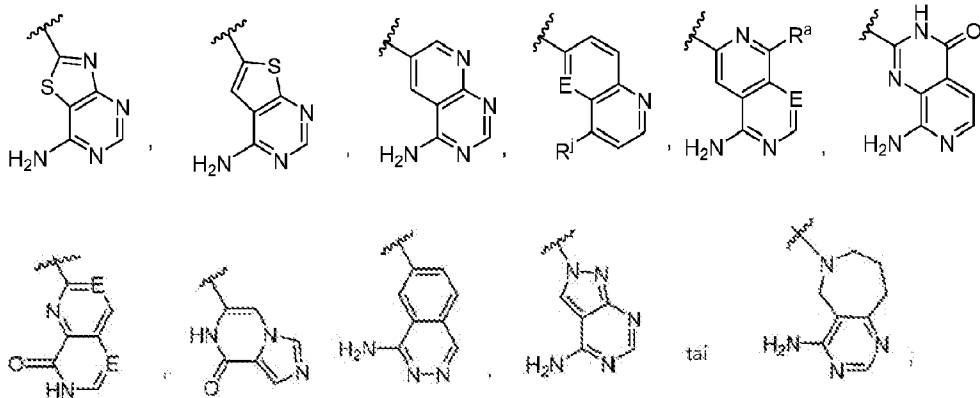
on



10

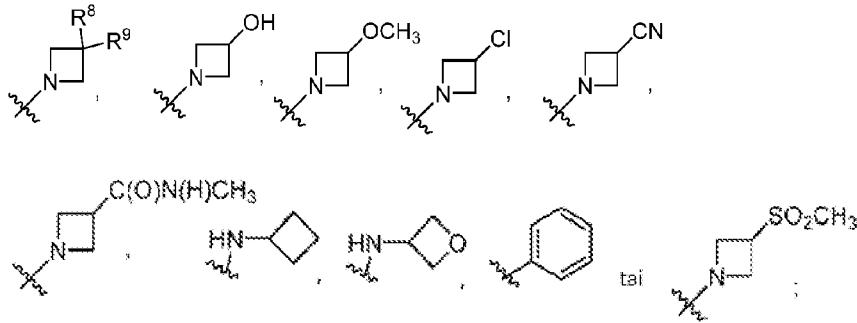


15



20

E on N tai CH;  
F on O, S, NH tai NCH<sub>3</sub>;  
R<sup>a</sup> on H tai -CH<sub>3</sub>;  
R<sup>b</sup> on H, D, -OH, F, -C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-alkyyli, -CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>, -C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-halogeenialkyyli, -NH<sub>2</sub>,  
syklopropyyli tai -CH<sub>2</sub>OH;  
R<sup>c</sup> on H, D tai -CH<sub>3</sub>;  
R<sup>d</sup> on H, -CN, -CF<sub>3</sub>, -C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-alkyyli, -C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-sykloalkyyli, -O-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyyli, -  
N(R<sup>6</sup>)R<sup>7</sup>,



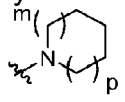
jossa

5

R<sup>6</sup> on H tai -C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyyli;

R<sup>7</sup> on H, -C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyyli, -SO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -COCH<sub>3</sub>, -C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-halogeenialkyyli tai -CH<sub>2</sub>CN,

tai R<sup>6</sup> ja R<sup>7</sup> muodostavat yhdessä niihin sitoutuneen typen kanssa ryhmän



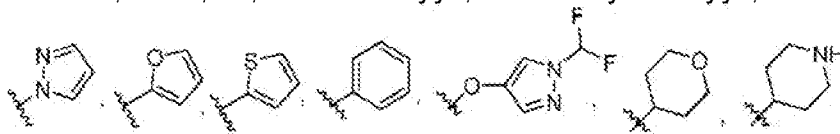
10

jossa m on 0 tai 1 ja p on 0 tai 1;

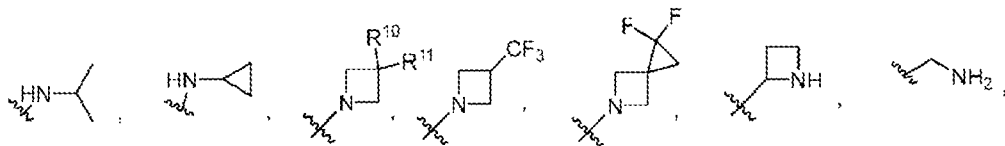
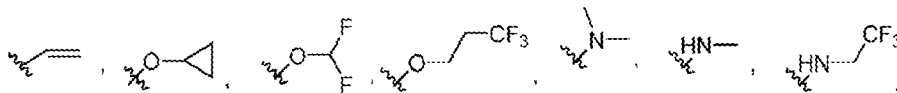
R<sup>8</sup> on H, F tai -C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyyli;

R<sup>9</sup> on H, F tai -C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alkyyli;

R<sup>e</sup> on H, -CD<sub>3</sub>, Br, -C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-alkyyli, -C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-sykloalkyyli,



15



20

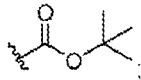
tai

-C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-alkyyli, joka on substituoitu 1-3 R<sup>9</sup>-ryhmällä, jolloin R<sup>9</sup> on -NH<sub>2</sub> tai F;

R<sup>10</sup> on H tai F;

R<sup>11</sup> on H tai F;

R<sup>f</sup> on H, -CH<sub>3</sub> tai

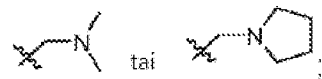


25

R<sup>h</sup> on -CH<sub>3</sub>, -NH<sub>2</sub> tai



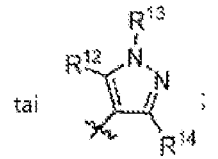
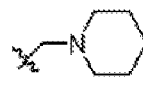
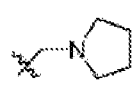
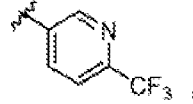
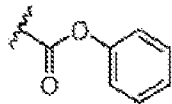
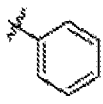
R<sup>i</sup> on H, -CH<sub>3</sub>, -CN, Br,



R<sup>j</sup> on -NH<sub>2</sub> tai



R<sup>k</sup> on H, -CF<sub>3</sub>, I, Cl, Br, -CN, -C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyyli,



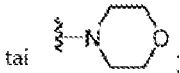
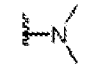
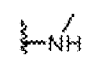
5

R<sup>12</sup> on H tai -CH<sub>3</sub>;

R<sup>13</sup> on H, -CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>(C)(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>OH, -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>CN tai -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>;

R<sup>14</sup> on H tai -CH<sub>3</sub>;

R<sup>l</sup> on H, -C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyyli, -CF<sub>3</sub>,



10

R<sup>m</sup> on H tai -CH<sub>3</sub>;

R<sup>n</sup> on -NH<sub>2</sub>;

R<sup>o</sup> on H tai -CH<sub>3</sub>;

R<sup>p</sup> on H tai -CH<sub>3</sub>;

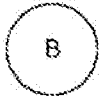
R<sup>q</sup> on H, -CN, F, Cl, -OCH<sub>3</sub>, -CF<sub>3</sub> tai -CH<sub>3</sub>; ja

15

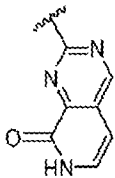
R<sup>s</sup> on -NH<sub>2</sub> tai



edellyttäen, että kun ryhmä



on

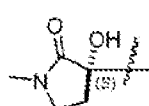
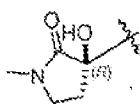


20

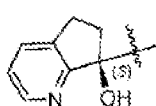
ja kukin R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> ja R<sup>4</sup> on H, ryhmä



on



tai



25

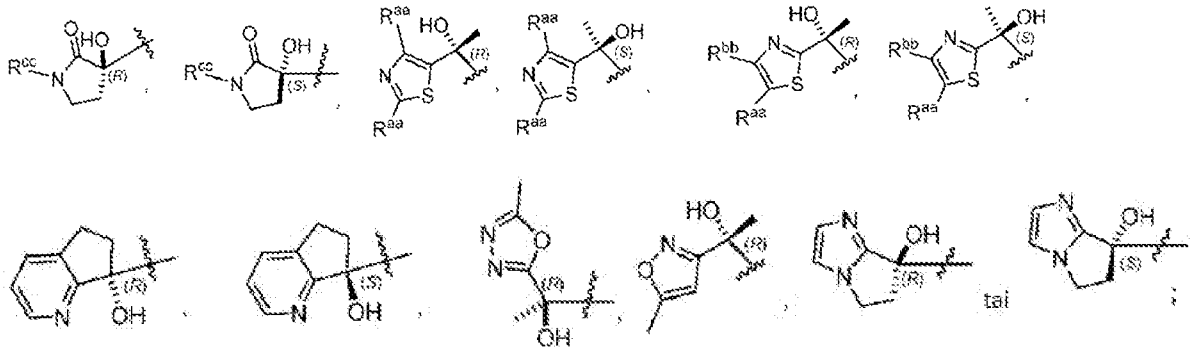
tai

ii)

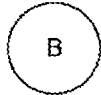
ryhmä



on

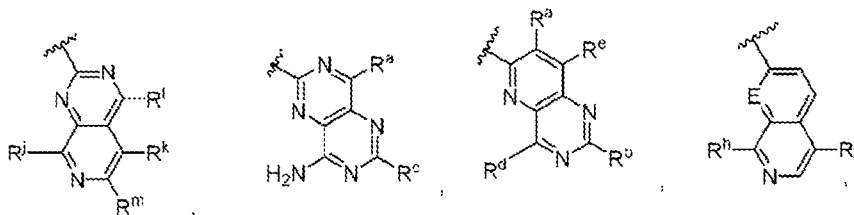


ja ryhmä

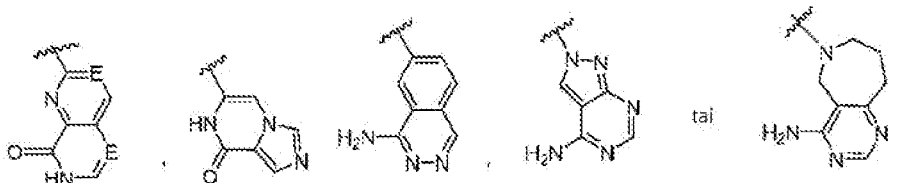
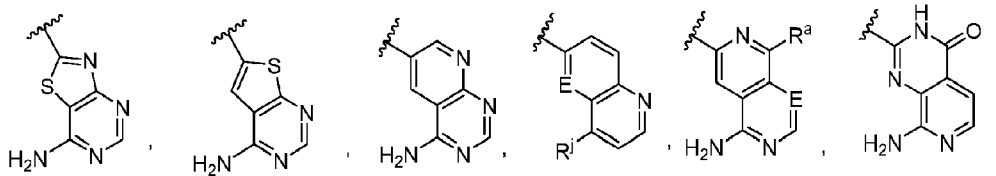
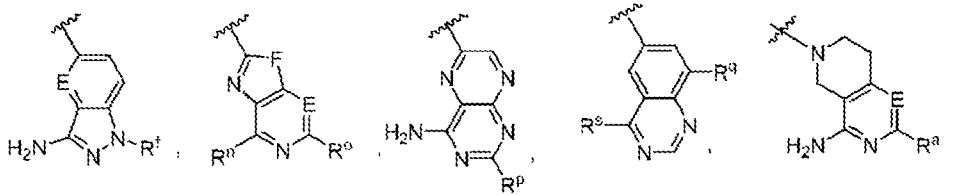


5

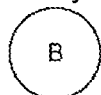
on



10

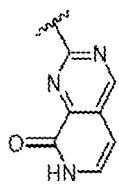


edellyttäen, että kun mainittu ryhmä



15

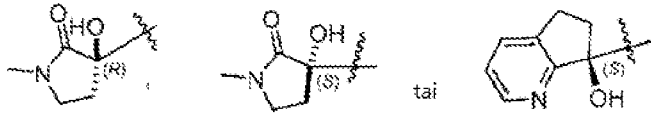
on



ja  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  ja  $R^4$  ovat H, mainittu ryhmä



on

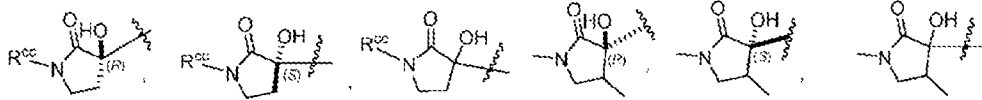


tai

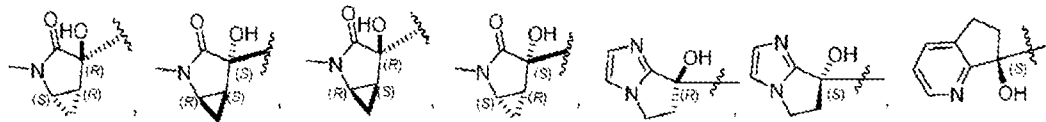
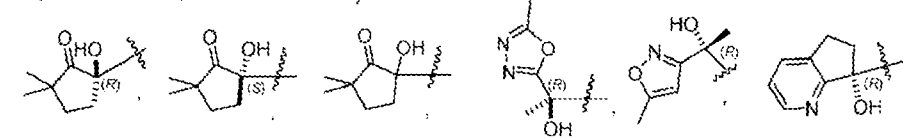
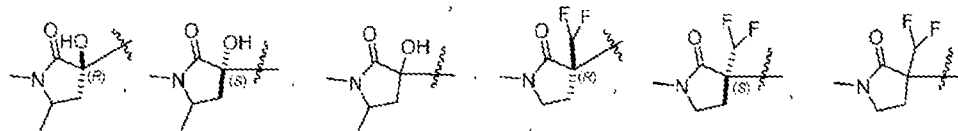
5  
tai  
iii)  
ryhmä



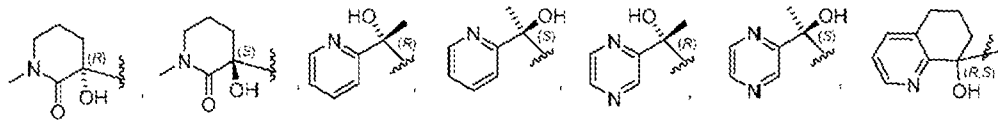
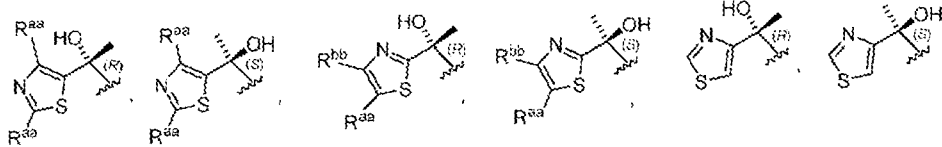
on



10

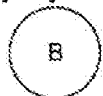


15

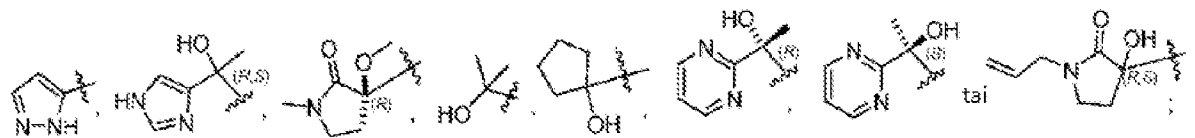


20

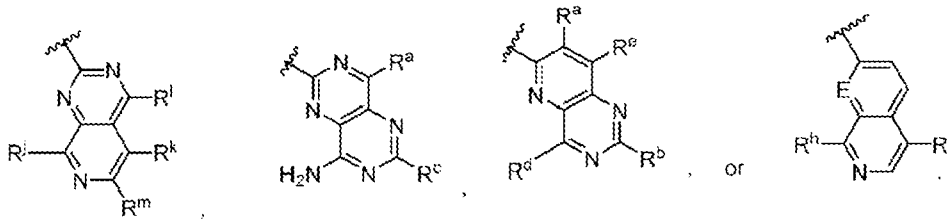
ja ryhmä



on tai



tai

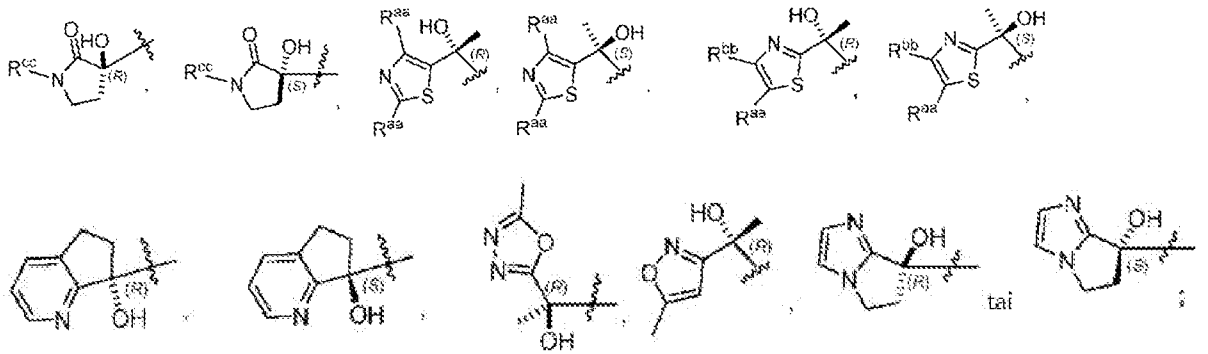


iv)  
ryhmä

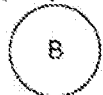


5

on

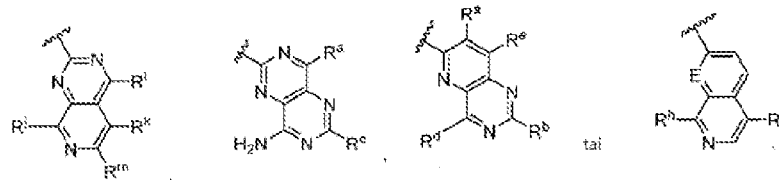


ja ryhmä



10

on



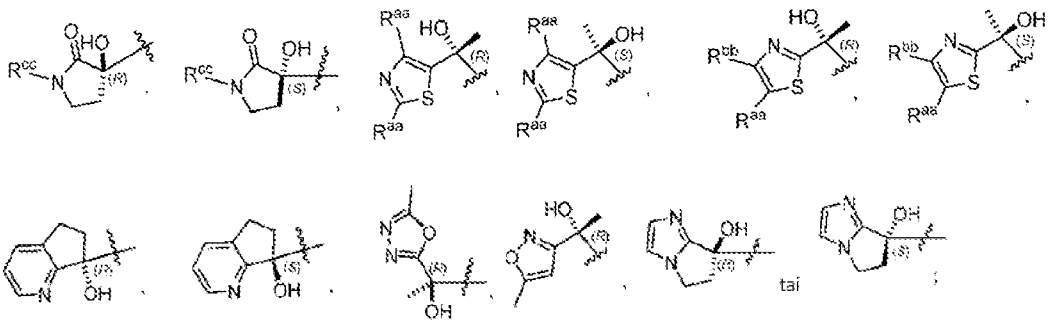
tai

v)  
ryhmä



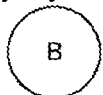
15

on

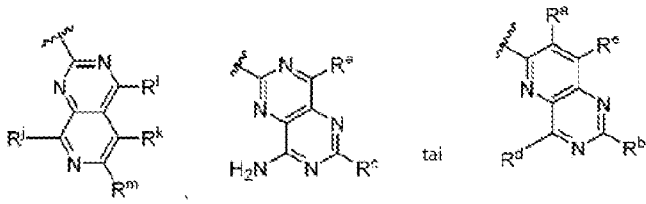


20

ja ryhmä



on



tai

vi)

5

R<sup>1</sup> on H;

R<sup>2</sup> on H;

R<sup>3</sup> on H;

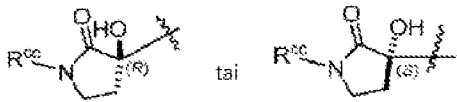
R<sup>4</sup> on H;

ryhmä

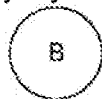


10

on

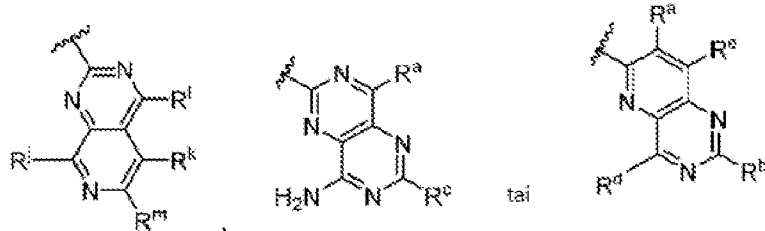


ja ryhmä



15

on



tai

vii)

20

R<sup>1</sup> on H;

R<sup>2</sup> on H;

R<sup>3</sup> on H tai -C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-alkyyli;

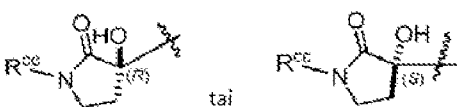
R<sup>4</sup> on H;

ryhmä

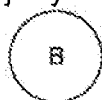


25

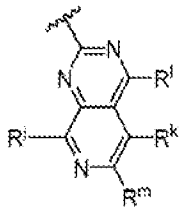
on



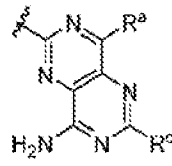
ja ryhmä



on



tai



tai

viii)

5

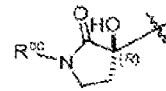
R<sup>1</sup> on H;  
 R<sup>2</sup> on H;  
 R<sup>3</sup> on H tai -C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-alkyyli;  
 R<sup>4</sup> on H;

ryhmä

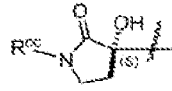
10



on

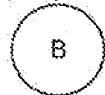


tai

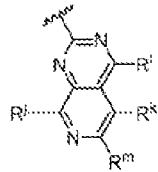


ja ryhmä

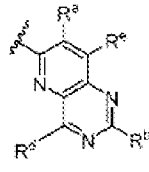
15



on



tai



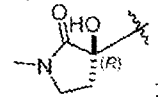
3. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, jossa ryhmä

20



on

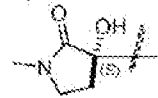
a)



25

tai

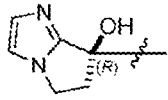
b) on



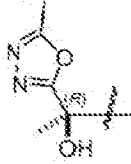
tai

30

c) on



tai  
d) on

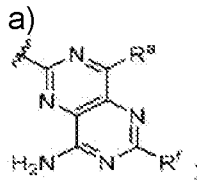


5

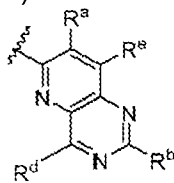
4. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, jossa ryhmä



10 on



tai  
b) on



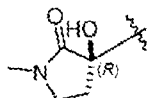
15

5. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, jossa

20 a) ryhmä



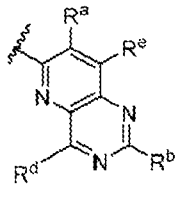
on



ja ryhmä



25 on

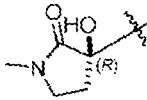


tai  
b) ryhmä

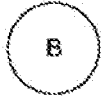


5

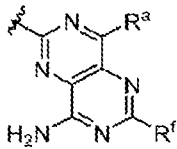
on



ja ryhmä



on

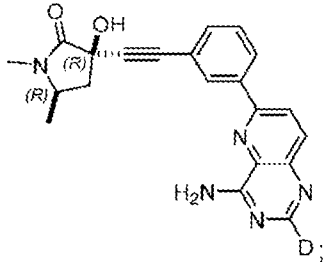


10

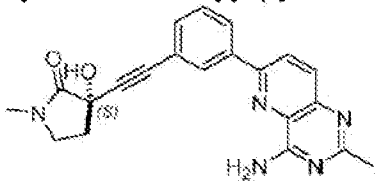
6. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, jolloin mainittu yhdiste on valittu seuraavista:

15

(3*R*,5*R*)-3-((3-(4-aminopyrido[3,2-*d*]pyrimidin-6-yyli-2-*d*)fenylyli)etyynyli)-3-hydroksi-1,5-dimetyylipyrrolidin-2-oni, jolla on kaava

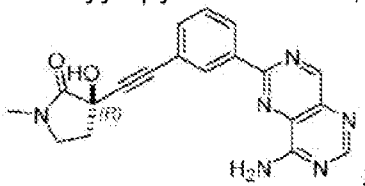


(*S*)-3-((3-(4-amino-2-metyylipyrido[3,2-*d*]pyrimidin-6-yyli)fenylyli)etyynyli)-3-hydroksi-1-metyylipyrrolidin-2-oni, jolla on kaava

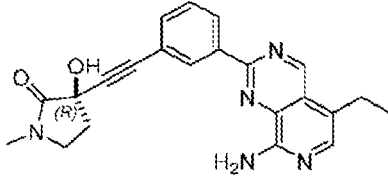


20

(*R*)-3-[2-[3-(4-aminopyrimido[5,4-*d*]pyrimidin-6-yyli)fenylyli]etyynyli]-3-hydroksi-1-metyyli-pyrrolidin-2-oni, jolla on kaava

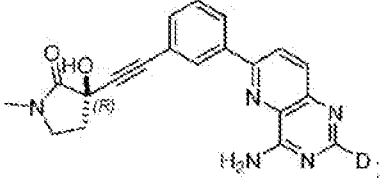


(R)-3-((3-(8-amino-5-etyylipyrido[3,4-d]pyrimidin-2-yyli)fenyyl)etyynyli)-3-hydroksi-1-metyylipyrrolidin-2-oni, jolla on kaava

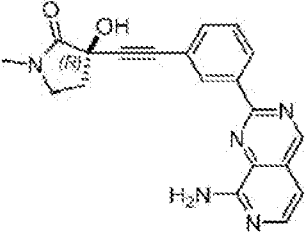


5

(R)-3-((3-(4-aminopyrido[3,2-d]pyrimidin-6-yyli-2-d)fenyyl)etyynyli)-3-hydroksi-1-metyylipyrrolidin-2-oni, jolla on kaava

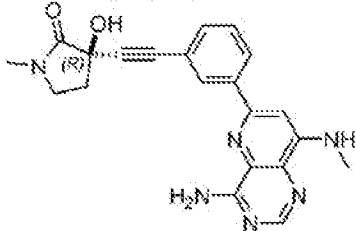


(R)-3-[2-[3-(8-aminopyrido[3,4-d]pyrimidin-2-yyli)fenyyl]etyynyli]-3-hydroksi-1-metyyli-pyrrolidin-2-oni, jolla on kaava

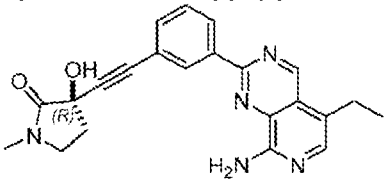


10

(R)-3-[2-[3-[4-amino-8-(metyyliamino)pyrido[3,2-d]pyrimidin-6-yyli]fenyyl]etyynyli]-3-hydroksi-1-metyyli-pyrrolidin-2-oni, jolla on kaava

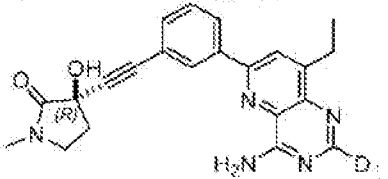


(R)-3-((3-(8-amino-5-etyylipyrido[3,4-d]pyrimidin-2-yyli)fenyyl)etyynyli)-3-hydroksi-1-metyylipyrrolidin-2-oni, jolla on kaava

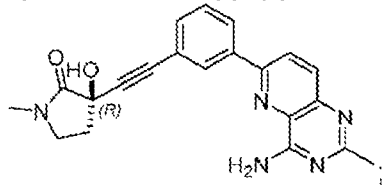


15

(R)-3-((3-(4-amino-8-etyylipyrido[3,2-d]pyrimidin-6-yyli-2-d)fenyyl)etyynyli)-3-hydroksi-1-metyylipyrrolidin-2-oni, jolla on kaava

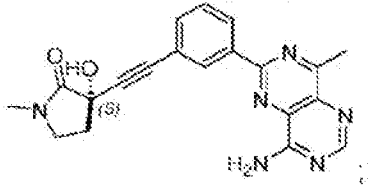


(R)-3-((3-(4-amino-2-metyylipyrido[3,2-d]pyrimidin-6-yyli)fennyli)etyynyli)-3-hydroksi-1-metyylipyrrolidin-2-oni, jolla on kaava

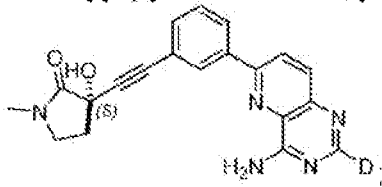


5

(S)-3-((3-(8-amino-4-metyylipirimido[5,4-d]pyrimidin-2-yyli)fennyli)etyynyli)-3-hydroksi-1-metyylipyrrolidin-2-oni, jolla on kaava

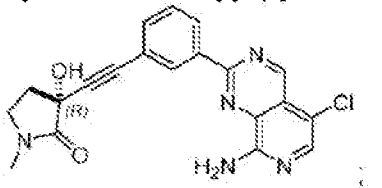


(S)-3-((3-(4-aminopyrido[3,2-d]pyrimidin-6-yyli-2-d)fennyli)etyynyli)-3-hydroksi-1-metyylipyrrolidin-2-oni, jolla on kaava

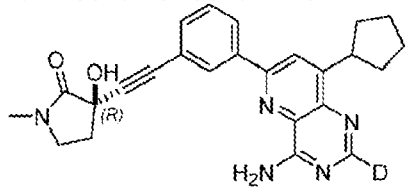


10

(R)-3-((3-(8-amino-5-klooripyrido[3,4-d]pyrimidin-2-yyli)fennyli)etyynyli)-3-hydroksi-1-metyylipyrrolidin-2-oni, jolla on kaava

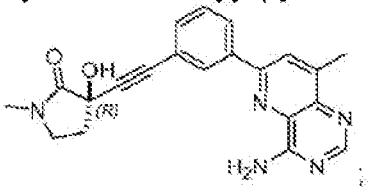


(R)-3-((3-(4-amino-8-syklopentyylipyrido[3,2-d]pyrimidin-6-yyli-2-d)fennyli)etyynyli)-3-hydroksi-1-metyylipyrrolidin-2-oni, jolla on kaava

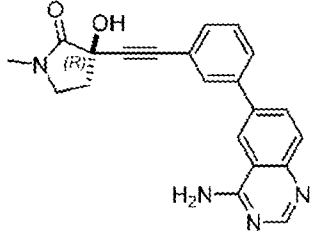


15

(R)-3-((3-(4-amino-8-metyylipyrido[3,2-d]pyrimidin-6-yyli)fennyli)etyynyli)-3-hydroksi-1-metyylipyrrolidin-2-oni, jolla on kaava

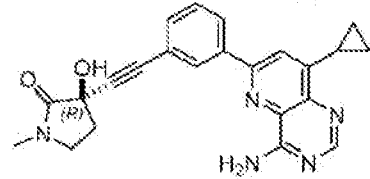


(*R*)-3-[2-[3-(4-aminokinatsolin-6-yyli)fenyyli]etyynyli]-3-hydroksi-1-metyylipyrrolidin-2-oni, jolla on kaava

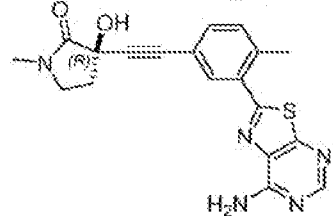


5

(*R*)-3-((3-(4-amino-8-syklopropylpyrido[3,2-*d*]pyrimidin-6-yyli)fenyyli)etyynyli)-3-hydroksi-1-metyylipyrrolidin-2-oni, jolla on kaava

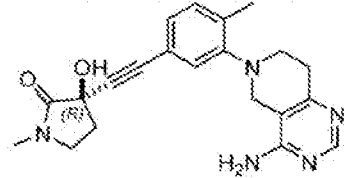


(*R*)-3-((3-(7-aminotiatsolo[5,4-*d*]pyrimidin-2-yyli)-4-metyylifenyyli)etyynyli)-3-hydroksi-1-metyylipyrrolidin-2-oni, jolla on kaava

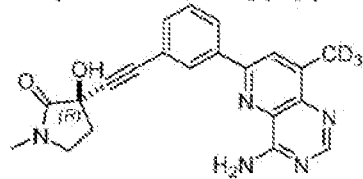


10

(*R*)-3-((3-(4-amino-7,8-dihydropyrido[4,3-*d*]pyrimidin-6(5*H*)-yyli)-4-metyylifenyyli)etyynyli)-3-hydroksi-1-metyylipyrrolidin-2-oni, jolla on kaava



(*R*)-3-((3-(4-amino-8-(metyyli-*d*<sub>3</sub>)pyrido[3,2-*d*]pyrimidin-6-yyli)fenyyli)etyynyli)-3-hydroksi-1-metyylipyrrolidin-2-oni, jolla on kaava



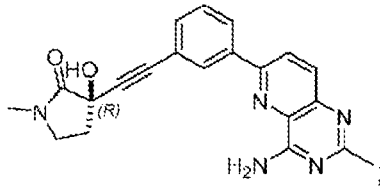
15

ja  
sen farmaseuttisesti hyväksyttävät suolat.

20

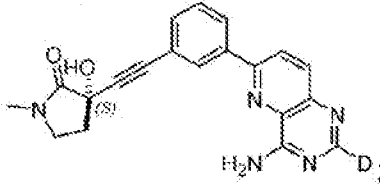
7. Patenttivaatimuksen 6 mukainen yhdiste, jolloin mainittu yhdiste on valittu seuraavista:

(*R*)-3-((3-(4-amino-2-metyylipyrido[3,2-*d*]pyrimidin-6-yyli)fenyyli)etyynyli)-3-hydroksi-1-metyylipyrrolidin-2-oni, jolla on kaava



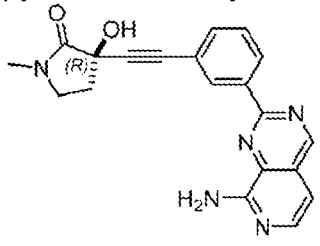
ja niiden farmaseuttisesti hyväksyttävät suolat.

- 5 **8.** Patenttivaatimuksen 6 mukainen yhdiste, jolloin mainittu yhdiste on valittu seuraavista:  
 (S)-3-((3-(4-aminopyrido[3,2-d]pyrimidin-6-yyli-2-d)fenyyli)etyynyli)-3-hydroksi-1-metyylipyrrolidin-2-oni, jolla on kaava



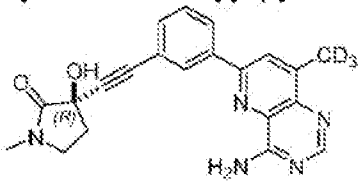
- 10 ja sen farmaseuttisesti hyväksyttävät suolat.

- 15 **9.** Patenttivaatimuksen 6 mukainen yhdiste, jolloin mainittu yhdiste on valittu seuraavista:  
 (R)-3-[2-[3-(8-aminopyrido[3,4-d]pyrimidin-2-yyli)fenyyli]etyynyli]-3-hydroksi-1-metyylipyrrolidin-2-oni, jolla on kaava



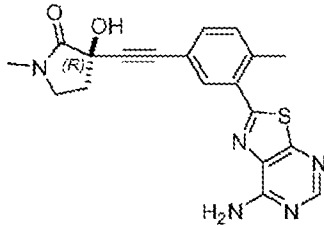
ja sen farmaseuttisesti hyväksyttävät suolat.

- 20 **10.** Patenttivaatimuksen 6 mukainen yhdiste, jolloin mainittu yhdiste on valittu seuraavista:  
 (R)-3-((3-(4-amino-8-(metyyli-d<sub>3</sub>)pyrido[3,2-d]pyrimidin-6-yyli)fenyyli)etyynyli)-3-hydroksi-1-metyylipyrrolidin-2-oni, jolla on kaava

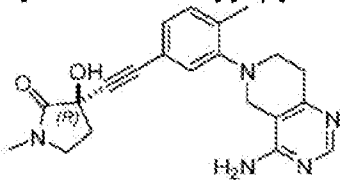


- 25 ja niiden farmaseuttisesti hyväksyttävät suolat.

**11.** Patenttivaatimuksen 6 mukainen yhdiste, jolloin mainittu yhdiste on valittu (R)-3-((3-(7-amiotiatsolo[5,4-d]pyrimidin-2-yyli)-4-metyylifenyyli)etyynyli)-3-hydroksi-1-metyylipyrrolidin-2-onista, jolla on kaava



- 5 **12.** Patenttivaatimuksen 6 mukainen yhdiste, jolloin mainittu yhdiste on valittu (*R*)-3-((3-(4-amino-7,8-dihydropyrido[4,3-*d*]pyrimidin-6(5*H*)-yyli)-4-metyylifenylyli)etyynyli)-3-hydroksi-1-metyylipyrrolidin-2-onista, jolla on kaava



- 10 **13.** Lääkekoostumus, joka käsittää terapeuttisesti tehokkaan määrän vähintään yhtä jonkin patenttivaatimuksen 1–12 mukaista yhdistettä tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävää suolaa.

- 15 **14.** Jonkin patenttivaatimuksen 1–12 mukainen yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola käytettäväksi menetelmässä, jolla hoidetaan hoidettavaa, jolla on tai jolla on diagnosoitu sairaus, häiriö tai tautitila, jota välittää NIK-aktiivisuus, jolloin  
20 menetelmä käsittää tehokkaan määrän yhdistettä antamisen sen tarpeessa olevalle hoidettavalle ja jolloin sairaus, häiriö tai tautitila valitaan syövästä, tulehdushäiriöistä, autoimmuunihäiriöistä, immunodermatologisista häiriöistä ja aineenvaihduntahäiriöistä.

- 25 **15.** Patenttivaatimuksen 14 mukaisesti käytettävä yhdiste, jolloin sairaus, häiriö tai tautitila on valittu SLE:stä, RA:sta, GvHD:stä, siirteen hyljinnästä, Sjögrenin oireyhtymästä, pemphigus vulgariksesta, palmoplantaarisesta pustuloosista, hidradenitis suppurativasta, liikalihavuudesta ja diabeteksesta.