



(12) Translation of
european patent specification

(11) NO/EP 2651922 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 403/06 (2006.01)
A61K 31/437 (2006.01)
A61P 31/12 (2006.01)
C07D 471/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2016.07.18
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2016.02.24
(86)	European Application Nr.	11794793.7
(86)	European Filing Date	2011.12.16
(87)	The European Application's Publication Date	2013.10.23
(30)	Priority	2010.12.16, EP, 10195468
(84)	Designated Contracting States:	AL AT BE BG CH CY CZ DE DK EE ES FI FR GB GR HR HU IE IS IT LI LT LU LV MC MK MT NL NO PL PT RO RS SE SI SK SM TR
	Designated Extension States:	BA ME
(73)	Proprietor	Janssen Sciences Ireland UC, Eastgate Village, Eastgate, Little Island, County Cork, IE-Ireland
(72)	Inventor	COOYMANS, Ludwig Paul, Grote Beekstraat 24, B-2340 Beerse, BE-Belgia DEMIN, Samuël Dominique, Professor Claraplein 14, Bus 308, B-2018 Antwerpen, BE-Belgia HU, Lili, Vrouw van Mechelenstraat 28, B-2800 Mechelen, BE-Belgia JONCKERS, Tim Hugo Maria, Pastoor Wouterstraat 19, bus 5, B-2650 Edegem, BE-Belgia RABOISSON, Pierre Jean-Marie Bernard, Rue Jolie 3, B-1331 Rosieres, BE-Belgia TAHRI, Abdellah, Rue Maurice Albert Raskin 30, B-1070 Anderlecht, BE-Belgia VENDEVILLE, Sandrine Marie Helene, Rue du Bémel 142, B-1150 Woluwe-Saint-Pierre, BE-Belgia
(74)	Agent or Attorney	Tandbergs Patentkontor AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

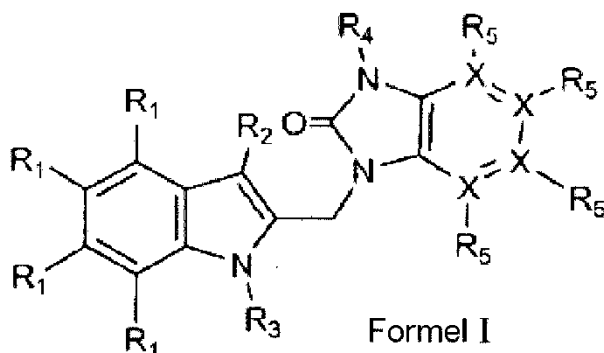
(54) Title **INDOLES AS RESPIRATORY SYNCYTIAL VIRUS ANTIVIRAL AGENTS**

(56) References
Cited: WO-A1-01/12600
 WO-A1-01/95910

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

Patentkrav

1. En forbindelse med formel (I), en *N*-oksid, addisjonssalt, kvaternært amin, metallkompleks eller en stereokjemisk isomer form derav;



karakterisert ved at hver X er uavhengig C eller N;

R₁ er valgt fra gruppen bestående av H, halogen, C₁-C₆alkoksy, CF₃ og OCF₃;

- 10 R₂ er valgt fra gruppen bestående av H, halogen, C₁-C₆alkyl, C₃-C₇cykloalkyl, C₁-C₆alkoksy og CO(R₇);

R₃ er -(CR₈R₉)_n-R₁₀;

- R₄ er valgt fra gruppen bestående av H, C₁-C₁₀alkyl, C₃-C₇cykloalkyl, C₂-C₁₀alkenyl, SO₂-R₈, CH₂CF₃SO₂CH₃ eller en 4- til 6-leddet mettet ring som inneholder et
15 oksygenatom;

R₅ er til stede hvor X er C, og er valgt fra gruppen bestående av H, C₁-C₆alkyl, C₃-C₇cykloalkyl, C₁-C₆alkoksy, CO(R₇), CF₃ og halogen;

R₅ er fraværende hvor X er N;

- R₇ er valgt fra gruppen bestående av OH, O(C₁-C₆alkyl), NH₂, NHSO₂N(C₁-C₆alkyl)₂,
20 NHSO₂NHCH₃, NHSO₂(C₁-C₆alkyl), NHSO₂(C₃-C₇sykloalkyl) og N(C₁-C₆-alkyl)₂, NR₈R₉, NR₉R₁₀;

n er et helt tall fra 2 til 6;

- R₈ og R₉ er hver uavhengig valgt fra H, C₁-C₁₀alkyl, C₃-C₇sykloalkyl, eller R₈ og R₉ tatt
sammen danner en 4- til 6-leddet alifatisk ring som eventuelt inneholder ett eller flere
25 heteroatomer utvalgt fra gruppen N, S, O;

R₁₀ er valgt fra gruppen bestående av H, C₁-C₆alkyl, OH, CN, F, CF₂H, CF₃, C(=NOH)NH₂, CONR₈R₉COOR₈, CONR₈SO₂R₉, CON(R₈)SO₂N(R₈R₉), NR₈R₉, NR₈COOR₉, OCOR₈, NR₈SO₂R₉, SO₂NR₈R₉, SO₂R₈ eller en 4- til 6-leddet mettet ring som inneholder et oksygenatom.

2. Forbindelse ifølge krav 1,

hvor

R₄ er valgt fra gruppen bestående av H, C₁-C₁₀alkyl, C₃-C₇cykloalkyl, C₂-C₁₀alkenyl, SO₂-R₈, eller en 4- til 6-leddet mettet ring som inneholder et oksygenatom.

5

3. Forbindelse ifølge krav 1 eller 2, hvor R₁ er valgt fra gruppen bestående av H, halogen.

4. Forbindelse ifølge hvilket som helst av de foregående krav, hvor R₁ i *para*-stilling til

10 N-R₃ er valgt fra gruppen bestående av H, halogen, og alle andre R₁ er H.

5. Forbindelse ifølge hvilket som helst av de foregående krav, hvor R₁ er valgt fra gruppen bestående av brom og klor.

15 6. Forbindelse ifølge hvilket som helst av de foregående krav, hvor R₂ er valgt fra gruppen bestående av H, halogen og CO(R₇).

7. Forbindelse ifølge hvilket som helst av de foregående krav, hvor R₂ er valgt fra gruppen bestående av H, I og CONH₂.

20

8. Forbindelse ifølge hvilket som helst av de foregående krav, hvor R₃ består av en -(CR₈R₉)_n-kjede hvor R₈ og R₉ er H og n er 2-4.

9. Forbindelse ifølge hvilket som helst av de foregående krav, hvor R₁₀ er valgt fra

25 gruppen bestående av F, CF₃, OH, SO₂R₈ og CN, og R₈ fortrinnsvis er metyl.

10. Forbindelse ifølge hvilket som helst av de foregående krav, hvor R₄ er C₃-C₇-cykloalkyl, fortrinnsvis cyklopropyl eller CH₂CF₃.

30 11. Forbindelse ifølge hvilket som helst av de foregående krav, hvor R₄ er isopropyl.

12. Forbindelse ifølge hvilket som helst av de foregående krav, hvor R₄ er oksetan-3-yl.

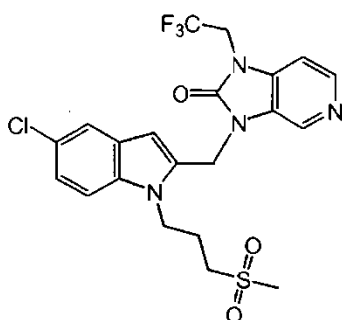
35 13. Forbindelse ifølge hvilket som helst av de foregående krav, hvor X i *para*-stilling til N-R₄ er C, og R₅ på X-en er F.

14. Forbindelse ifølge hvilket som helst av de foregående krav, hvor én X er N og de andre X-ene er C, og N er fortrinnsvis i *para*-stilling til N-R₄.

15. Forbindelse ifølge hvilket som helst av de foregående krav, hvor høyst én R₅ er valgt fra gruppen bestående av C₁-C₆alkyl, C₁-C₆alkoksy og halogen, og den andre R₅ er H.

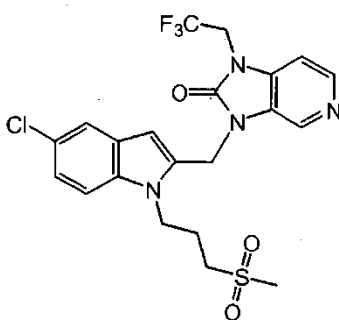
16. Forbindelse ifølge hvilket som helst av de foregående krav, hvor alle R₅ er H.

17. Forbindelsen som angitt i krav 1, hvor forbindelsen er



eller et N-oksid, addisjonssalt, kvaternært amin eller metallkompleks derav.

18. Forbindelse ifølge krav 17, hvor forbindelsen er



19. En forbindelse som angitt i hvilket som helst av kravene 1 til 18, for anvendelse som en medisin.

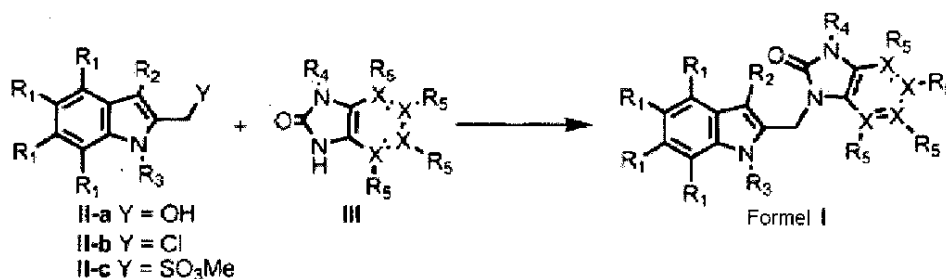
20. En farmasøytisk sammensetning omfattende en farmasøytisk akseptabel bærer, og som aktiv ingrediens en terapeutisk effektiv mengde av en forbindelse som angitt i hvilket som helst av kravene 1 til 18.

21. Fremgangsmåte for fremstilling av et farmasøytisk preparat som angitt i krav 20, idet fremgangsmåten omfatter nøye blanding av en farmasøytisk akseptabel bærer sammen med en terapeutisk effektiv mengde av en forbindelse som angitt i hvilket som helst av kravene 1 til 18.

5

22. Forbindelse som angitt i hvilket som helst av kravene 1 til 18, for anvendelse som et medikament for inhibering av RSV-replikasjon.

23. Fremgangsmåte for fremstilling av en forbindelse som angitt i hvilket som helst av kravene 1 til 16, idet fremgangsmåten omfatter kobling av en forbindelse valgt fra gruppen bestående av II-a, II-b og II-c med en forbindelse III, som resulterer i derivater av formel (I) der alle substituentene R og X har en betydning i samsvar med krav 1



15

24. Anvendelse av en forbindelse som angitt i hvilket som helst av kravene 1 til 18, for fremstilling av et medikament for inhibering av RSV-replikasjon.