



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2734522 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

C07D 487/04 (2006.01) A61P 31/00 (2006.01)

A61K 31/4985 (2006.01) A61P 35/00 (2006.01)

A61P 19/08 (2006.01) A61P 37/00 (2006.01)

A61P 29/00 (2006.01) C07D 519/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2019.04.08
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.10.31
(86)	European Application Nr.	12733505.7
(86)	European Filing Date	2012.07.11
(87)	The European Application's Publication Date	2014.05.28
(30)	Priority	2011.07.19, EP, 11174578 2011.07.19, US, 201161509397 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
	Designated Extension States:	BA ME
(73)	Proprietor	Merck Sharp & Dohme B.V., Waarderweg 39, 2031 BN Haarlem, Nederland
(72)	Inventor	BARF, Tjeerd A., St. Luciastraat 7, NL-5371AS Ravenstein, Nederland JANS, Christiaan, Gerardus, Johannes, Maria, Heggerank 134, NL-5342CC Cuijk, Nederland MAN, de Adrianus, Petrus, Antonius, N. V. Organon H.W. Van Heelstraat 4, NL-5327AH Hurwenen, Nederland OUBRIE, Arthur A., Saltshof 1106, NL-6604EB Wijchen, Nederland RAAIJMAKERS, Hans C.A., Eikakkerhoven 26, NL-5242KK Eindhoven, Nederland REWINKEL, Johannes, Bernardus, Maria, Molenweg 16, NL-5351EV Berghem, Nederland STERRENBURG, Jan-Gerard, Grote Omloop 18, NL-6871TE Renkum, Nederland WIJKMANS, Jacobus C.H.M., N. V. Organon Oss, NL-5345LR Hurwenen, Nederland
(74)	Agent or Attorney	PLOUGMANN VINGTOFT, Postboks 1003 Sentrum, 0104 OSLO, Norge

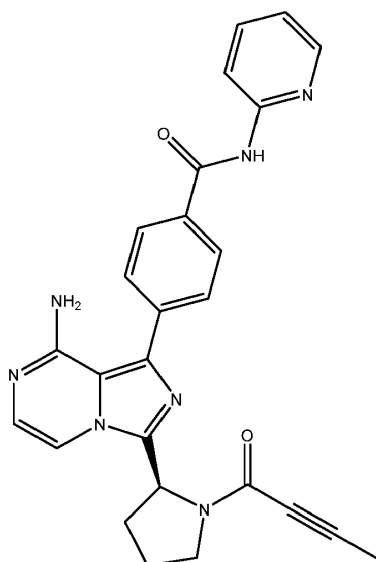
(54) Title **4-IMIDAZOPYRIDAZIN-1-YL-BENZAMIDES AND 4-IMIDAZOTRIAZIN-1-YL-BENZAMIDES AS BTK-INHIBITORS**

(56) References
Cited: WO-A1-2011/095556, WO-A1-2010/126960, WO-A2-2008/121742

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

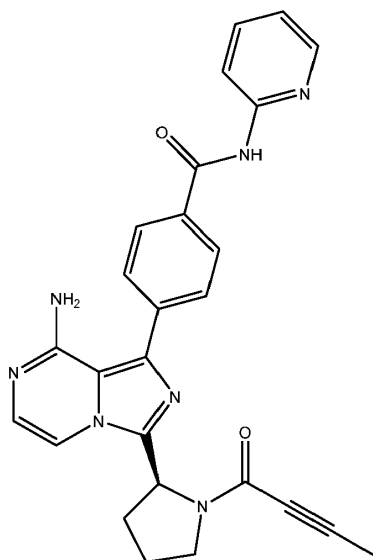
Patentkrav

1. Forbindelse som er en forbindelse som har strukturen:

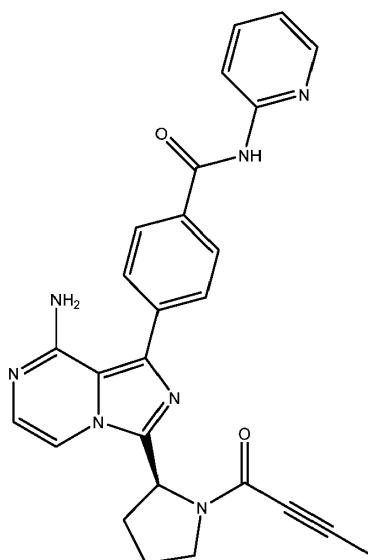


eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

2. Forbindelsen ifølge krav 1, som har strukturen:

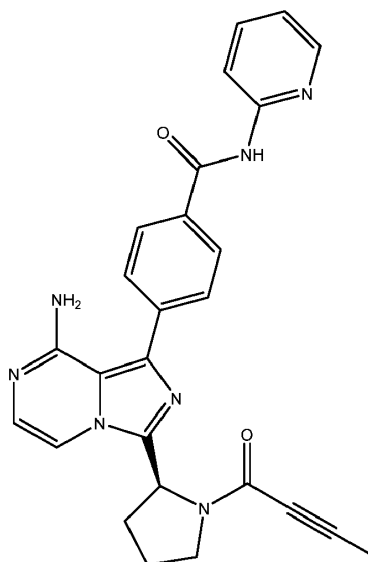


3. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori forbindelsen er et farmasøytisk akseptabelt salt av en forbindelse som har strukturen:



4. Forbindelsen ifølge krav 3, hvori det farmasøytisk akseptable saltet er valgt fra gruppen som består av acetat, askorbat, benzoat, benzensulfonat, bisulfat, borat, butyrat, citrat, kamferat, kamfersulfonat, fumarat, hydroklorid, hydrobromid, hydrojodid, laktat, maleat, metansulfonat, naftalensulfonat, nitrat, oksalat, fosfat, propionat, salicylat, suksinat, sulfat, tartarat, tiocyanat og toluensulfonat.

5. Forbindelse som er en forbindelse som har strukturen:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse i behandling.

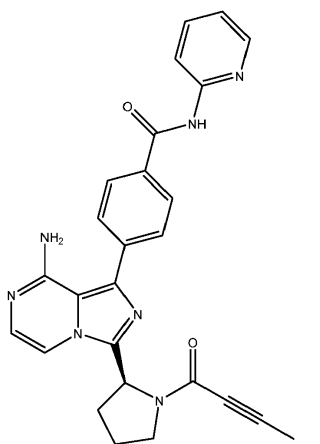
6. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 5, hvori forbindelsen er for anvendelse ved behandling av en Brutons tyrosinkinase (Btk) -mediert forstyrrelse valgt fra gruppen som består av revmatoid artritt, psoriasisartritt, infeksjøs artritt, progressiv kronisk artritt, deformerende leddgikt, slitasjegikt, traumatisk leddgikt, giktartitt, Reiters syndrom, polykondritt, akutt synovitt, spondylitt, glomerulonefritt med nefrotisk syndrom,

glomerulonefritt uten nefrotisk syndrom, autoimmune hematologiske forstyrrelser, hemolytisk anemi, aplastisk anemi, idiopatisk trombocytopeni, nøytropeni, autoimmun gastritt, autoimmune inflammatoriske tarmsykdommer, ulcerøs kolitt, Crohns sykdom, transplantat-mot-vert sykdom, allograftavvisning, kronisk tyroiditt, Graves' sykdom, sklerodermi, type I diabetes, type II diabetes, akutt aktiv hepatitt, kronisk aktiv hepatitt, pankreatitt, primær biliær cirrhose, myasthenia gravis, multippel sklerose, systemisk lupus erytematose, psoriasis, atopisk dermatitt, kontaktdermatitt, eksem, hudsolbrenthet, vaskulitt, Behcets sykdom, kronisk nyresvikt, Stevens-Johnson syndrom, inflammatorisk smerte, idiopatisk sprue, kakeksi, sarkoidose, Guillain-Barré syndrom, uveitt, konjunktivitt, kerato-konjunktivitt, otitis media, periodontal sykdom, pulmonal interstitial fibrose, astma, bronkitt, rhinitt, bihulebetennelse, pneumokoniose, lungesviktsyndrom, lungeemfysem, lungefibrose, silikose, kronisk inflammatorisk lungesykdom, kronisk obstruktiv lungesykdom, en proliferativ sykdom, ikke-Hodgkins lymfom, diffust storcellet B-cellelymfom, mantelcellelymfom, kronisk lymfatisk leukemi av B-celletype, akutt lymfoblastisk leukemi av moden B-celletype, B-cellelymfom som følge av kronisk aktiv B-cellereseptorsignalering og en beinforstyrrelse relatert til multippelt myelom.

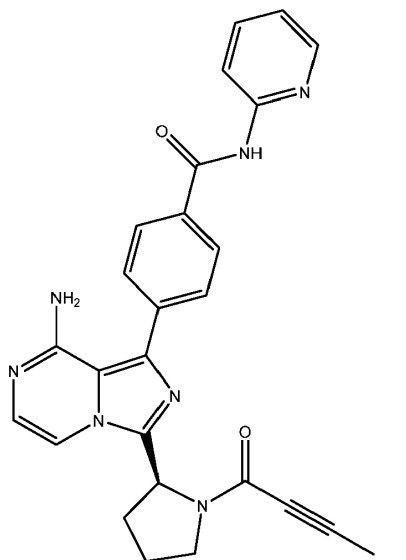
7. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 5, hvori forbindelsen er for anvendelse ved behandling av en Brutons tyrosinkinase (Btk) mediert forstyrrelse hvori den Btk-medierte forstyrrelsen er kronisk lymfatisk leukemi av B-celletype.

8. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 5, hvori forbindelsen er for anvendelse ved behandling av en Brutons tyrosinkinase (Btk) mediert forstyrrelse hvori den Btk-medierte forstyrrelsen er mantelcellelymfom.

9. Forbindelsen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 5 til 8, hvori forbindelsen har strukturen:

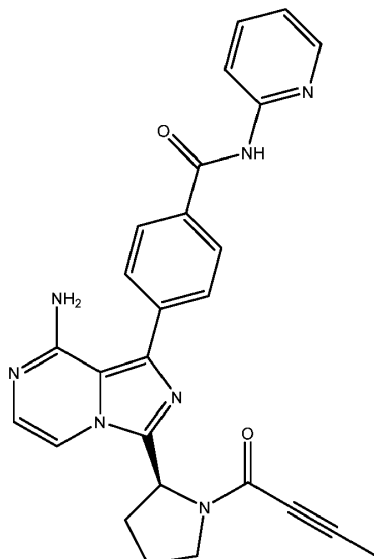


10. Forbindelsen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 5 til 8, hvori forbindelsen er et farmasøytisk akseptabelt salt av en forbindelse som har strukturen:



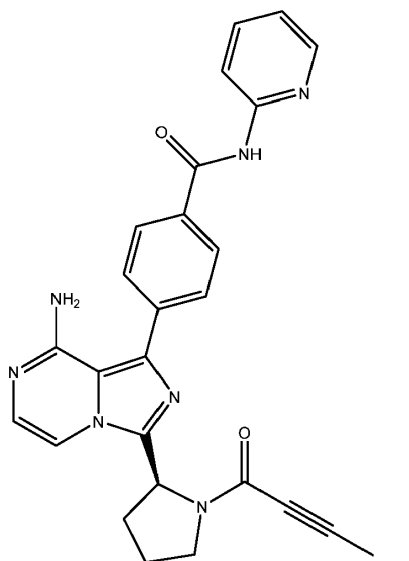
11. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 10, hvori det farmasøytisk akseptable saltet er valgt fra gruppen som består av acetat, askorbat, benzoat, benzensulfonat, bisulfat, borat, butyrat, citrat, kamferat, kamfersulfonat, fumarat, hydroklorid, hydrobromid, hydrojodid, laktat, maleat, metansulfonat, naftalensulfonat, nitrat, oksalat, fosfat, propionat, salicylat, suksinat, sulfat, tartarat, tiocyanat og toluensulfonat.

12. Kombinasjon av en forbindelse som er en forbindelse som har strukturen:

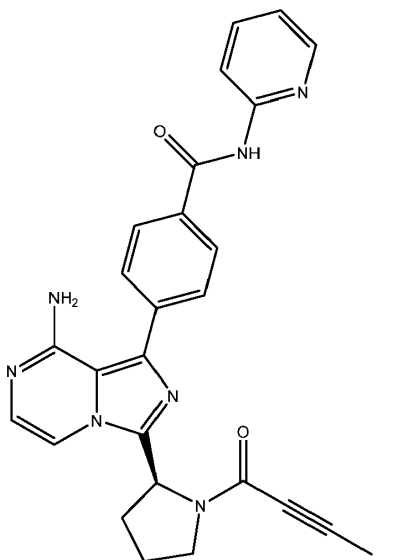


eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og et ytterligere legemiddel.

13. Kombinasjonen ifølge krav 12, hvori forbindelsen har strukturen:

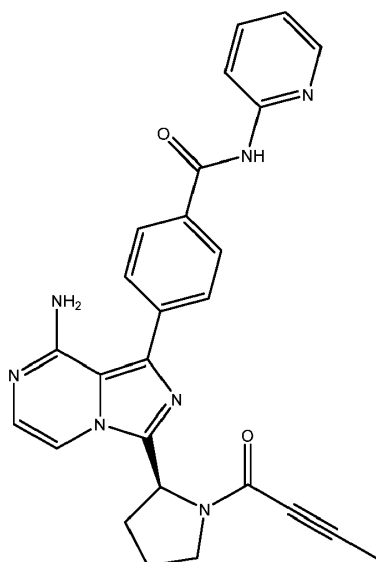


14. Kombinasjonen ifølge krav 12, hvori forbindelsen er et farmasøytisk akseptabelt salt av en forbindelse som har strukturen:



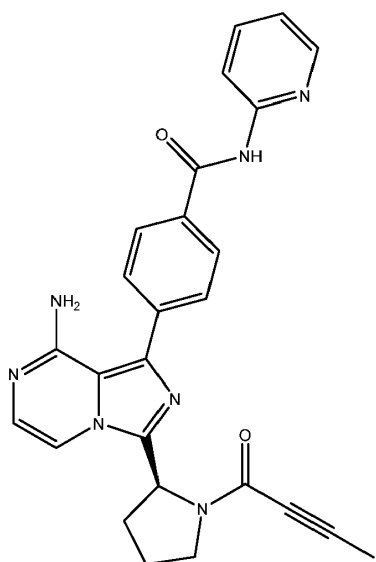
15. Kombinasjonen ifølge krav 14, hvori det farmasøytisk akseptable saltet er valgt fra gruppen som består av acetat, askorbat, benzoat, benzensulfonat, bisulfat, borat, butyrat, citrat, kamferat, kamfersulfonat, fumarat, hydroklorid, hydrobromid, hydrojodid, laktat, maleat, metansulfonat, naftalensulfonat, nitrat, oksalat, fosfat, propionat, salicylat, suksinat, sulfat, tartarat, tiocyanat og toluensulfonat.

16. Farmasøytisk sammensetning som omfatter en forbindelse som er en forbindelse som har strukturen:

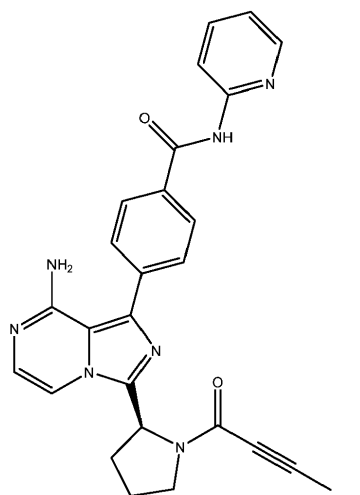


eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og et farmasøytisk akseptabelt hjelpestoff.

17. Sammensetningen ifølge krav 16, hvori forbindelsen har strukturen:



18. Sammensetningen ifølge krav 16, hvori forbindelsen er et farmasøytisk akseptabelt salt av en forbindelse som har strukturen:



19. Sammensetningen ifølge krav 16, hvori det farmasøytisk akseptable saltet er valgt fra gruppen som består av acetat, askorbat, benzoat, benzensulfonat, bisulfat, borat, butyrat, citrat, kamferat, kamfersulfonat, fumarat, hydroklorid, hydrobromid, hydrojodid, laktat, maleat, metansulfonat, naftalensulfonat, nitrat, oksalat, fosfat, propionat, salicylat, suksinat, sulfat, tartarat, tiocyanat og toluensulfonat.