



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2970127 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.	C07D 401/04 (2006.01)
C07D 215/227 (2006.01)	C07D 401/12 (2006.01)
A61K 31/4375 (2006.01)	C07D 401/14 (2006.01)
A61K 31/4706 (2006.01)	C07D 405/04 (2006.01)
A61K 31/4709 (2006.01)	C07D 405/14 (2006.01)
C07D 215/44 (2006.01)	C07D 409/12 (2006.01)
C07D 215/46 (2006.01)	C07D 409/14 (2006.01)
C07D 215/48 (2006.01)	C07D 413/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2019.03.11
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.10.24
(86)	European Application Nr.	14713394.6
(86)	European Filing Date	2014.03.12
(87)	The European Application's Publication Date	2016.01.20
(30)	Priority	2013.03.14, US, 201361781583 P 2013.09.26, US, 201361882798 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	GlaxoSmithKline Intellectual Property (No. 2) Limited, 980 Great West Road, Brentford, Middlesex TW8 9GS, Storbritannia
(72)	Inventor	AMANS, Dominique, GlaxoSmithKline980 Great West Road, BrentfordMiddlesex TW8 9GS, Storbritannia ATKINSON, Stephen John, GlaxoSmithKlineGunnels Wood Road, StevenageHertfordshire SG1 2NY, Storbritannia HARRISON, Lee Andrew, GlaxoSmithKlineGunnels Wood Road, StevenageHertfordshire SG1 2NY, Storbritannia HIRST, David Jonathan, GlaxoSmithKlineGunnels Wood Road, StevenageHertfordshire SG1 2NY, Storbritannia LAW, Robert Peter, GlaxoSmithKlineGunnels Wood Road, StevenageHertfordshire SG1 2NY, Storbritannia LINDON, Matthew, GlaxoSmithKlineGunnels Wood Road, StevenageHertfordshire SG1 2NY, Storbritannia PRESTON, Alexander, GlaxoSmithKlineGunnels Wood Road, StevenageHertfordshire SG1 2NY, Storbritannia SEAL, Jonathan Thomas, GlaxoSmithKlineGunnels Wood Road, StevenageHertfordshire SG1 2NY, Storbritannia

WELLAWAY, Christopher Roland, GlaxoSmithKlineGunnels Wood Road,
StevenageHertfordshire SG1 2NY, Storbritannia

(74) Agent or Attorney Nordic Patent Service A/S, Bredgade 30, 1260 KØBENHAVN K, Danmark

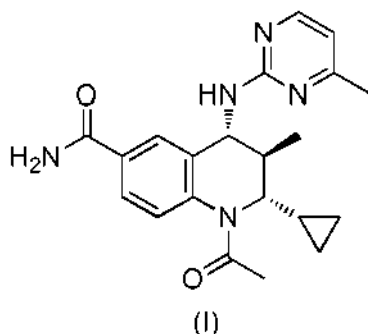
(54) Title **2,3-DISUBSTITUTED 1-ACYL-4-AMINO-1,2,3,4-TETRAHYDROQUINOLINE DERIVATIVES
AND THEIR USE AS BROMODOMAIN INHIBITORS**

(56) References
Cited: DATABASE WPI Week 200447 Thomson Scientific, London, GB; AN 2004-499804
XP002723955, -& WO 2004/052863 A1 (KYOWA HAKKO KOGYO KK) 24 June 2004 (2004-06-
24), EP-A1- 2 412 710, WO-A2-2005/007094, WO-A1-2011/054848, EP-A1- 2 415 764

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 (2*S*,3*R*,4*R*)-1-acetyl-2-syklopropyl-3-metyl-4-((4- metylpyrimidin-2-yl)amino)-1,2,3,4-tetrahydrokinolin-6-karboksamid som har strukturen med formel (I'):



- 5 eller et salt deriv.
2. Forbindelse ifølge krav 1 eller et farmasøytisk akseptabelt salt deriv.
3. Forbindelse ifølge krav 1 i form av en fri base.
4. Farmasøytisk sammensetning som omfatter en forbindelse med formel (I') eller et farmasøytisk akseptabelt salt deriv som definert i krav 2 og én eller flere farmasøytisk akseptable bærere, fortynningsmidler eller eksipienser.
- 10 5. Sammensetning som omfatter en forbindelse med formel (I') eller et farmasøytisk akseptabelt salt deriv som definert i krav 2 sammen med én eller flere andre terapeutisk aktive midler.
6. Forbindelse med formel (I') eller et farmasøytisk akseptabelt salt deriv som definert i
- 15 krav 2, for anvendelse i terapi.
7. Forbindelse eller et farmasøytisk akseptabelt salt deriv som definert i krav 2 for anvendelse ved behandling av en akutt eller kronisk autoimmun og/eller inflammatorisk tilstand.
8. Forbindelse eller et farmasøytisk akseptabelt salt deriv for anvendelse ifølge krav 7,
- 20 hvori den akutte eller kroniske autoimmune og/eller inflammatoriske tilstanden er valgt fra: revmatoid artritt, slitasjegikt, akutt gikt, psoriasis, systemisk lupus erytematose, multippel sklerose, inflammatorisk tarmsykdom (Crohns sykdom og ulcerøs kolitt), astma, kronisk obstruktiv luftveissykdom, pneumonitt, myokarditt, perikarditt, myositt, eksem, dermatitt (inkludert atopisk dermatitt), alopeci, vitiligo, bolla hudsykdommer, nefritt, vaskulitt,
- 25 hyperkolesterolemi, aterosklerose, Alzheimers sykdom, depresjon, Sjögrens syndrom, sialoadenitt, okklusjon i sentralretinalvenen, forgrenet retinal veneokklusjon, Irvine-Gass syndrom (postkatarakt og postkirurgisk), retinittpigmentosa, pars planitis, birdshot retinokoroidopati, epiretinalmembran, cystisk makulært ødem, parafoveal telengiektasi,

- traksjonelle makulopatier, vitreomakulære traksjonssyndromer, retinal avfesting, nevroretinit, idiopatisk makulært ødem, retinit, tørt øye (keratoconjunctivitis Sicca), vernal keratokonjunktivitt, atopisk keratokonjunktivitt, uveitt (for eksempel fremre uveitt, pan uveitt, bakre uveitt, uveittassosiert makulært ødem), skleritt, diabetisk retinopati, diabetisk makulaødem, aldersrelatert makulær dystrofi, hepatitt, pankreatitt, primær biliær cirrhose, skleroserende kolangitt, Addisons sykdom, hypofysitt, thyroiditt, type I diabetes, kjempecellearteritt, nefritt, inkludert lupus nefritt, vaskulitt med organinvolvering så som glomerulonefritt, vaskulitt, herunder storcellearteritt, Wegeners granulomatose, Polyarteritis nodosa, Behcets sykdom, Kawasaki-sykdom, Takayasu arteritt, pyoderma gangrenosum, vaskulitt med organinvolvering og akutt avstøtning av transplanterte organer.
- 5
- 10
- 15
9. Forbindelse eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse ifølge krav 8 hvori den akutte eller kroniske autoimmune og/eller inflammatoriske tilstanden er psoriasis.
 10. Forbindelse eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse ifølge krav 8 hvori den akutte eller kroniske autoimmune og/eller inflammatoriske tilstanden er atopisk dermatitt.
 11. Forbindelse eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse ifølge krav 8 hvori den akutte eller kroniske autoimmune og/eller inflammatoriske tilstanden er vitiligo.