



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2997011 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 207/40 (2006.01)
A61K 31/401 (2006.01)
A61P 31/00 (2006.01)

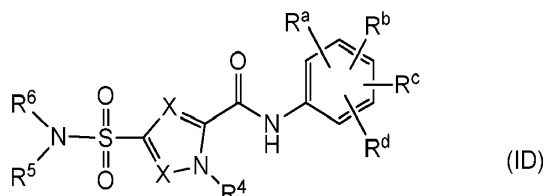
Norwegian Industrial Property Office

- (21) Translation Published 2019.01.28
- (80) Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent 2018.08.29
- (86) European Application Nr. 14727752.9
- (86) European Filing Date 2014.05.16
- (87) The European Application's Publication Date 2016.03.23
- (30) Priority 2013.05.17, EP, 13168291
2013.07.04, EP, 13175181
2013.08.29, EP, 13182281
2013.10.31, EP, 13191209
2013.12.18, EP, 13198160
2014.03.05, EP, 14157900
- (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, Ireland
- (72) Inventor VANDYCK, Koen, Deurnestraat 74, B-3583 Paal-Beringen, Belgia
HACHÉ, Geerwin, Yvonne, Paul, Vinusakker 111, B-2950 Kapellen, Belgia
LAST, Stefaan, Julien, Crauwelshoeve 59, B-2547 Lint, Belgia
MC GOWAN, David, Craig, De Biollelyaan 80, B-1150 Brussel, Belgia
ROMBOUTS, Geert, Eenamelaan 7, B-2150 Borsbeek, Belgia
VERSCHUEREN, Wim, Gaston, De Wittestraat 5, B-2600 Berchem (Antwerpen), Belgia
RABOISSON, Pierre, Jean-Marie, Bernard, Rue Jolie 3, B-1331 Rosieres, Belgia
- (74) Agent or Attorney TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

(54) Title **SULPHAMOYLPIRROLAMIDE DERIVATIVES AND THE USE THEREOF AS MEDICAMENTS FOR THE TREATMENT OF HEPATITIS B**

(56) References Cited: DATABASE REGISTRY [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 10 March 2010 (2010-03-10), XP002699131, Database accession no. 1208400-27-4, WO-A1-2013/006394

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/>

Patentkrav5 **1.** Forbindelse med formel (ID)

eller en stereoisomer eller tautomer form derav, hvori:

hver X representerer uavhengig CR⁷;

10 R^a, R^b og R^c uavhengig er valgt blant gruppen som består av hydrogen, fluor, brom, klor, -CHF₂, -CF₂-metyl, -CH₂F, -CF₃, -OCF₃, -CN, C₁-C₃alkyl og C₃-C₄sykloalkyl;

R^d er hydrogen eller fluor;

R⁴ er hydrogen, C₁-C₃alkyl eller C₃-C₄sykloalkyl;

R⁵ er hydrogen;

15 R⁶ er valgt blant gruppen som består av C₂-C₆alkyl, C₁-C₄alkyl-R⁸ eventuelt substituert med ett eller flere fluor, C₁-C₄alkyl-R⁹ eventuelt substituert med ett eller flere fluor, og en 3-7-leddet mono- eller polysyklisk, mettet ring som eventuelt inneholder ett eller flere heteroatomer hver uavhengig valgt blant gruppen som består av O, S og N, slik 3-7-leddet mettete ring, eller C₂-C₆alkyl som eventuelt er substituert med én eller flere substituenter hver uavhengig valgt blant gruppen som består av hydrogen, -OH, fluor, 20 okso, R⁹, R¹⁰ og C₁-C₄alkyl eventuelt substituert med R¹⁰;

R⁷ representerer hydrogen, -CN, fluor, klor, brom, -CHF₂, -CF₂-metyl, -CH₂F, -CF₃, C₁-C₃alkyl eventuelt substituert med metoksy, C₂-C₃alkenyl eller C₃-C₄sykloalkyl;

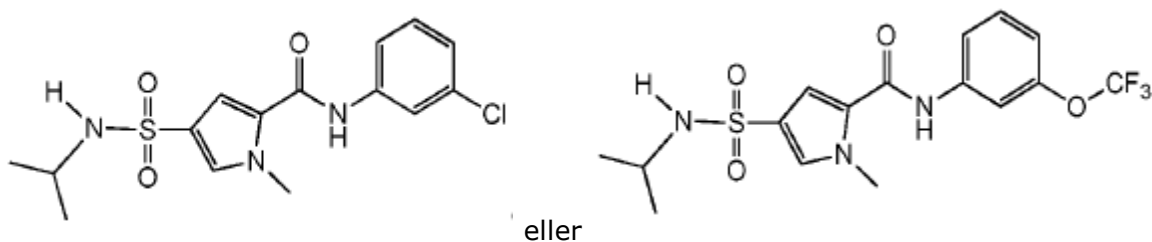
25 R⁸ representerer 3-7-leddet mettete ring som eventuelt inneholder ett eller flere heteroatomer hver uavhengig valgt blant gruppen som består av O, S og N, slik 3-7-leddet mettete ring eventuelt er substituert med ett eller flere C₁-C₄alkyl som eventuelt er substituert med R¹⁰;

R⁹ representerer C₁-C₄alkyloksy, -SO₂-metyl, -C(=O)-OR¹¹ eller -C(=O)-N(R¹¹)₂;

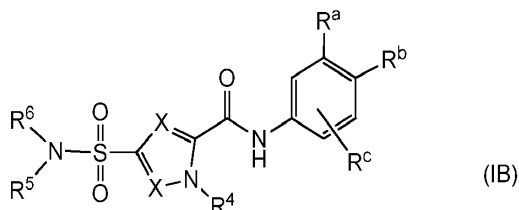
R¹⁰ representerer -CN, -OH, fluor, -CHF₂, -CH₂F eller -CF₃;

R¹¹ representerer hydrogen eller C₁-C₃alkyl;

30 eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller et solvat derav hvori en slik forbindelse ikke er



2. Forbindelse ifølge krav 1 med formel (IB)



5

3. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori R^4 er metyl.

4. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori R^6 inneholder en 3-7-leddet mettet ring som eventuelt inneholder ett oksygen.

10

5. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori R^6 er en 4- eller 5-leddet mettet ring som inneholder ett oksygen, så som 4- eller 5-leddet mettet ring som eventuelt er substituert med C_1 - C_4 alkyl eventuelt substituert med R^{10} .

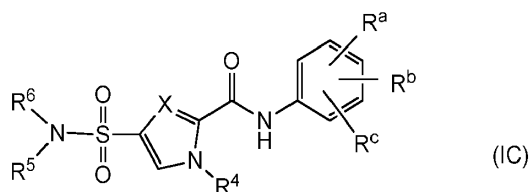
15 6. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvori R^6 omfatter et forgrenet C_3 - C_6 alkyl, eventuelt substituert med ett eller flere fluor, eller hvori R^6 omfatter et C_3 - C_6 sykloalkyl, hvori slikt C_3 - C_6 sykloalkyl er substituert med ett eller flere fluor eller substituert med C_1 - C_4 alkyl substituert med ett eller flere fluor, eller hvori R^6 omfatter et C_3 - C_6 sykloalkyl, eventuelt substituert med ett eller flere fluor og/eller substituert med
20 C_1 - C_4 alkyl eventuelt substituert med ett eller flere fluor.

7. Forbindelse ifølge krav 6, hvori R^6 er et forgrenet C_3 - C_6 alkyl substituert med ett eller flere fluor.

25 8. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori R^b er hydrogen eller fluor.

9. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori R^a and R^c er uavhengig valgt blant gruppen som består av hydrogen, fluor, klor, CN og metyl.

30

10. Forbindelse ifølge krav 1 med formel (IC)

eller en stereoisomer eller tautomer form derav, hvori:

X representerer CR⁷;

5 R^a, R^b og R^c uavhengig er valgt blant gruppen som består av hydrogen, fluor, brom, klor, -CHF₂, -CF₂-metyl, -CH₂F, -CF₃, -OCF₃, -CN, C₁-C₃alkyl og C₃-C₄sykloalkyl;

R⁴ er hydrogen, C₁-C₃alkyl eller C₃-C₄sykloalkyl;

R⁵ er hydrogen;

10 R⁶ er valgt blant gruppen som består av C₂-C₆alkyl, C₁-C₄alkyl-R⁸ eventuelt substituert med ett eller flere fluor, C₁-C₄alkyl-R⁹ eventuelt substituert med ett eller flere fluor, og en 3-7-leddet mono- eller polysyklisk, mettet ring som eventuelt inneholder ett eller flere heteroatomer hver uavhengig valgt blant gruppen som består av O, S og N, slik 3-7-leddet mettete ring, eller C₂-C₆alkyl som eventuelt er substituert med én eller flere substituenter hver uavhengig valgt blant gruppen som består av hydrogen, -OH, fluor, okso, R⁹, R¹⁰ og C₁-C₄alkyl eventuelt substituert med R¹⁰;

R⁷ representerer hydrogen, -CN, fluor, klor, brom, -CHF₂, -CF₂-metyl, -CH₂F, -CF₃, C₁-C₃alkyl eller C₃-C₄sykloalkyl;

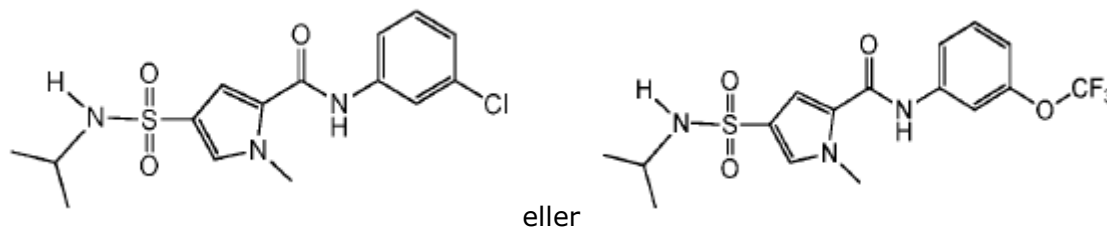
20 R⁸ representerer 3-7-leddet mettete ring som eventuelt inneholder ett eller flere heteroatomer hver uavhengig valgt blant gruppen som består av O, S og N, slik 3-7-leddet mettete ring er eventuelt substituert med ett eller flere C₁-C₄alkyl som eventuelt er substituert med R¹⁰;

R⁹ representerer C₁-C₄alkyloksy, -SO₂-metyl, -C(=O)-OR¹¹ eller -C(=O)-N(R)₂;

R¹⁰ representerer -CN, -OH, fluor, -CHF₂, -CH₂F eller -CF₃;

R¹¹ representerer hydrogen eller C₁-C₃alkyl;

25 eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller et solvat derav, hvori en slik forbindelse ikke er

**11.** Forbindelse ifølge krav 10, hvori

30 R⁴ er C₁-C₃alkyl;

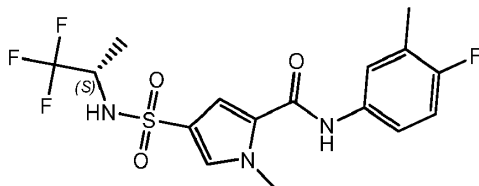
R⁶ er valgt fra gruppen som består av C₂-C₆alkyl eventuelt substituert med ett eller flere

fluor; og

R⁷ representerer hydrogen, fluor, klor eller C₁-C₃alkyl.

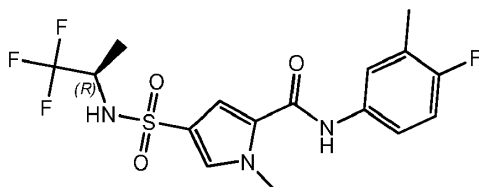
- 5 **12.** Forbindelse ifølge krav 10 eller 11, hvori R⁴ representerer metyl, R⁶ er C₂-C₆alkyl substituert med ett eller flere fluor, R⁷ representerer hydrogen, og R^a, R^b og R^c er uavhengig valgt blant gruppen som består av hydrogen, fluor, klor, metyl og -CN.

- 13.** Forbindelsen ifølge krav 1, hvori forbindelsen er



- 10 eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller et solvat derav.

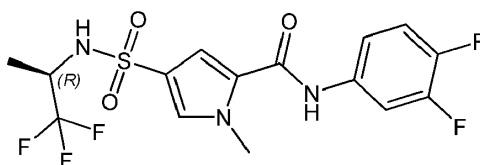
- 14.** Forbindelsen ifølge krav 1, hvori forbindelsen er



eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller et solvat derav.

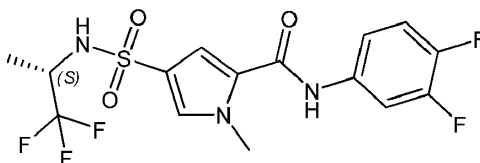
15

- 15.** Forbindelsen ifølge krav 1, hvori forbindelsen er



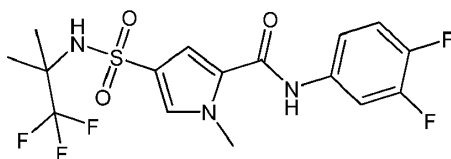
eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller et solvat derav.

- 20 **16.** Forbindelsen ifølge krav 1, hvori forbindelsen er



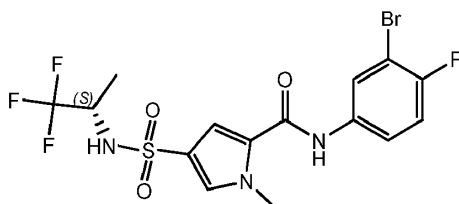
eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller et solvat derav.

17. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori forbindelsen er



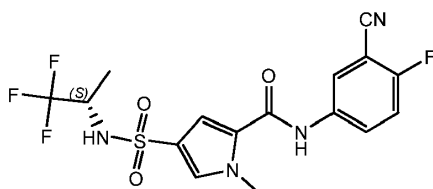
eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller et solvat derav.

5 **18.** Forbindelsen ifølge krav 1, hvori forbindelsen er



eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller et solvat derav.

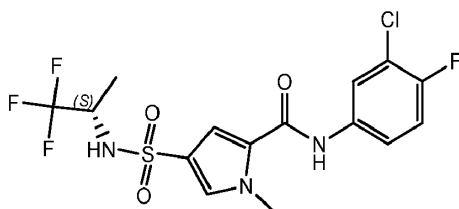
19. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori forbindelsen er



10

eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller et solvat derav.

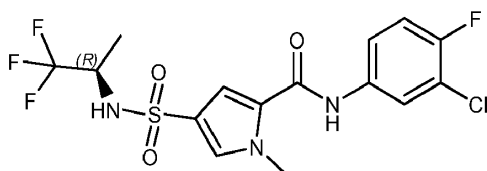
20. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori forbindelsen er



15

eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller et solvat derav.

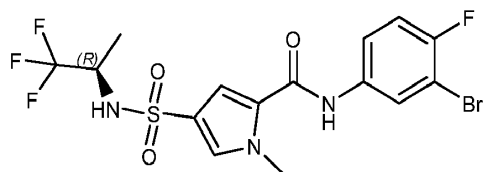
21. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori forbindelsen er



eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller et solvat derav.

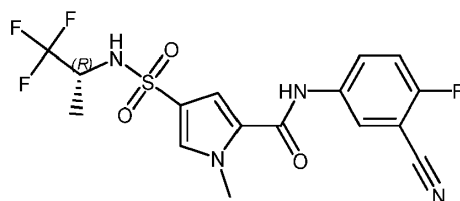
20

22. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori forbindelsen er



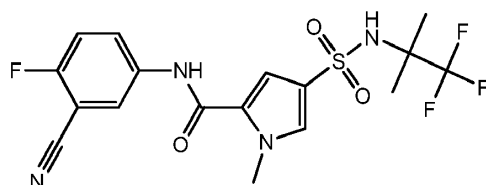
eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller et solvat derav.

5 **23.** Forbindelsen ifølge krav 1, hvori forbindelsen er



eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller et solvat derav.

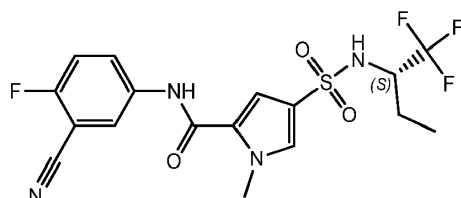
24. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori forbindelsen er



10

eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller et solvat derav.

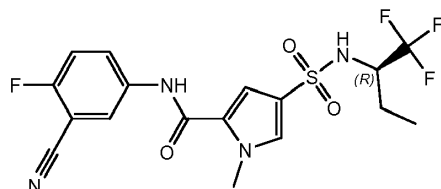
25. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori forbindelsen er



15

eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller et solvat derav.

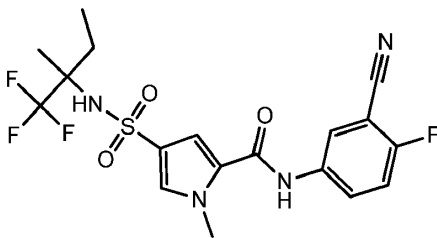
26. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori forbindelsen er



eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller et solvat derav.

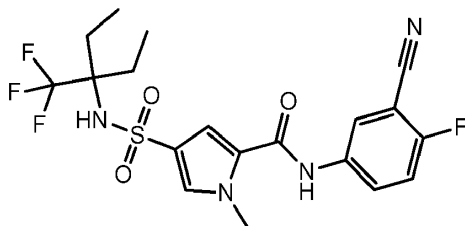
20

27. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori forbindelsen er



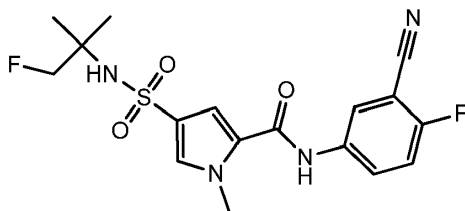
eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller et solvat derav.

5 **28.** Forbindelsen ifølge krav 1, hvori forbindelsen er



eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller et solvat derav.

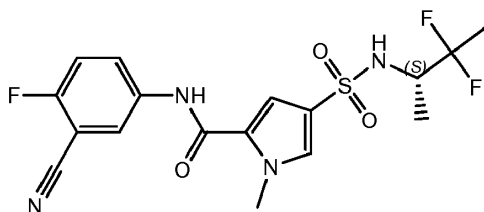
29. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori forbindelsen er



10

eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller et solvat derav.

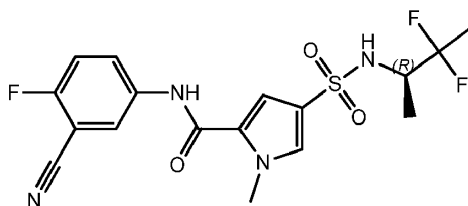
30. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori forbindelsen er



15

eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller et solvat derav.

31. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori forbindelsen er



eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller et solvat derav.

32. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 31 for anvendelse som et medikament.

5

33. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 31 for anvendelse i forebygging eller behandling av en HBV-infeksjon i et pattedyr.

34. Farmasøytisk sammensetning som omfatter en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 31, og en farmasøytisk akseptabel bærer.

10

35. Produkt som inneholder (a) en forbindelse med formel (ID) som definert i et hvilket som helst av kravene 1 til 31, og (b) en annen HBV-inhibitor, som et kombinert preparat for samtidig, separat eller sekvensiell anvendelse ved behandling av HBV-infeksjoner.