



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3134402 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 471/04 (2006.01)
A61K 31/4188 (2006.01)
A61K 31/437 (2006.01)
A61P 31/00 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)
A61P 37/02 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

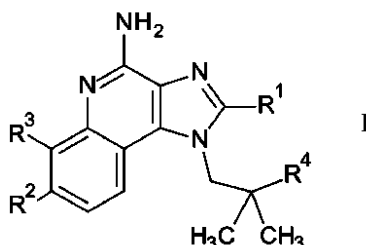
(45)	Translation Published	2020.09.07
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.05.06
(86)	European Application Nr.	15716824.6
(86)	European Filing Date	2015.04.20
(87)	The European Application's Publication Date	2017.03.01
(30)	Priority	2014.04.22, EP, 14165349
(84)	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 Validation States:	MA
(73)	Proprietor	F. Hoffmann-La Roche AG, Grenzacherstrasse 124, 4070 Basel, Sveits
(72)	Inventor	HOVES, Sabine, Schlossbergstrasse 6, 82392 Habach, Tyskland KUHN, Bernd, Hinterlindenweg 26a, CH-4153 Reinach BL, Sveits RICKLIN, Fabienne, 6 impasse des Cerisiers, F-68490 Hombourg, Frankrike ROEVER, Stephan, Auf der Neusetze 19, 79594 Inzlingen, Tyskland
(74)	Agent or Attorney	PLOUGMANN VINGTOFT, Postboks 1003 Sentrum, 0104 OSLO, Norge

(54)	Title	4-AMINO-IMIDAZOQUINOLINE COMPOUNDS
(56)	References Cited:	WO-A1-2013/067597 US-A1- 2003 187 016 WO-A2-2005/076783

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 av formel



der

R^1 er C_{1-7} -alkyl eller C_{1-7} -alkoksy- C_{1-7} -alkyl;

R^2 er valgt fra gruppen som består av hydrogen, halogen, C_{1-7} -alkoksykarbonyl- C_{1-7} -alkyl og C_{1-7} -alkoksykarbonyl- C_{2-7} -alkenyl;

R^3 er hydrogen;

R^4 er valgt fra gruppen som består av

$-O-(CH_2)_m-NHR^5$, og $-O-(CO)-(CH_2)_n-NHR^6$,

der

m er 2,

n er 1,

R^5 er hydrogen og

R^6 er hydrogen;

eller farmasøytisk aksepterbare salter av dette.

2. Forbindelse av formel I ifølge krav 1, der R^1 er C_{1-7} -alkoksy- C_{1-7} -alkyl.

3. Forbindelse av formel I ifølge krav 1 eller 2, der R^1 er etoksymetyl.

4. Forbindelse av formel I ifølge ett av kravene 1 til 3, der R^2 er hydrogen.

5. Forbindelse av formel I ifølge krav 1, valgt fra gruppen som består av
1-(2-(2-aminoetoksy)-2-metylpropyl)-2-(etoksymetyl)-1*H*-imidazo[4,5-
c]kinolin-4-amin,

1-(4-amino-2-(etoksymetyl)-1*H*-imidazo[4,5-*c*]kinolin-1-yl)-2-metylpropan-2-
yl-2-aminoacetat,

etyl-(*E*)-3-[4-amino-1-[2-(2-aminoetoksy)-2-metylpropyl]-2-(etoksymetyl)-
1*H*-imidazo[4,5-*c*]kinolin-7-yl]prop-2-enat,

etyl-3-(4-amino-1-(2-(2-aminoetoksy)-2-metylpropyl)-2-(etoksymetyl)-1*H*-
imidazo[4,5-*c*]kinolin-7-yl)propanat,

etyl-3-(4-amino-1-(2-(2-aminoacetoksy)-2-metylpropyl)-2-(etoksymetyl)-1*H*-

imidazo[4,5-c]kinolin-7-yl)propanat,

1-(2-(2-aminoetoksy)-2-metylpropyl)-2-pentyl-1*H*-imidazo[4,5-c]kinolin-4-amin,

1-(2-(2-aminoetoksy)-2-metylpropyl)-7-brom-2-(etoksymetyl)-1*H*-imidazo[4,5-c]kinolin-4-amin,

og farmasøytisk aksepterbare salter av dette.

6. Forbindelse av formel I ifølge krav 1, som er

1-(2-(2-aminoetoksy)-2-metylpropyl)-2-(etoksymetyl)-1*H*-imidazo[4,5-c]kinolin-4-amin,

og farmasøytisk aksepterbare salter av dette.

7. Forbindelse av formel I ifølge krav 1, valgt fra gruppen som består av

1-(4-amino-2-(etoksymetyl)-1*H*-imidazo[4,5-c]kinolin-1-yl)-2-metylpropan-2-yl-2-aminoacetat,

etyl-3-(4-amino-1-(2-(2-aminoetoksy)-2-metylpropyl)-2-(etoksymetyl)-1*H*-imidazo[4,5-c]kinolin-7-yl)propanat,

og farmasøytisk aksepterbare salter av dette.

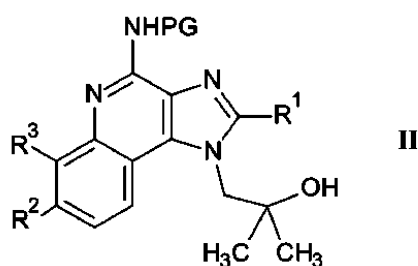
8. Forbindelse av formel I ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7 til bruk som legemiddel.

9. Forbindelse av formel I ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7 til bruk som legemiddel for behandling av kreftformer eller autoimmune sykdommer eller infeksjonssykdommer valgt fra gruppen som består av virussykdommer, bakteriesykdommer, soppsykdommer og parasittsykdommer.

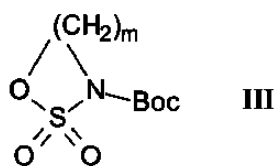
10. Farmasøytisk sammensetning som omfatter en forbindelse av formel I ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7 og en farmasøytisk akseptierbar bærer og/eller adjuvans.

11. Fremgangsmåte for fremstilling av en forbindelse av formel I som definert i krav 1, idet fremgangsmåten omfatter å

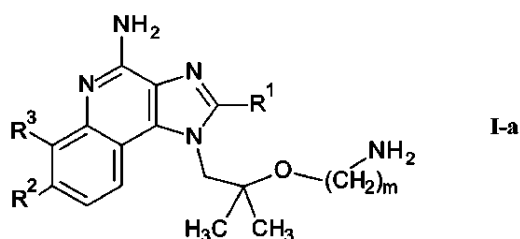
a) reagere en forbindelse av formel II



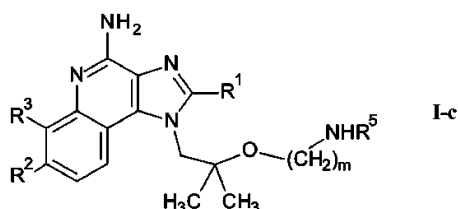
der R^1 , R^2 og R^3 er som definert i krav 1 og PG er en beskyttende gruppe, med en forbindelse av formel III



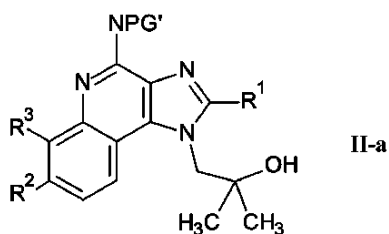
der m er som definert i krav 1, under basiske forhold og fjerne de beskyttende gruppene PG og Boc under sure forhold for å oppnå en forbindelse av formel I-a



der R^1 til R^3 og m er som definert i krav 1, og eventuelt også koble forbindelsen av formel I-a til en alkohol eller syre av formel R^5 -OH eller et aldehyd av formel $R^5=O$ for å oppnå en forbindelse av formel I-c

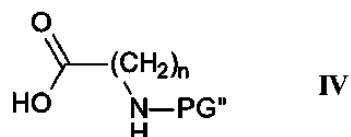


der R^1 til R^3 , m og R^5 er som definert i krav 1, og, opsjonelt, omdanne den oppnådde forbindelsen til et farmasøytisk aksepterbart salt, eller
b) reagere en forbindelse av formel II-a

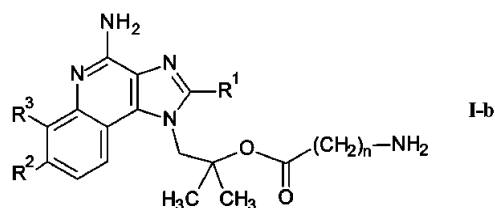


der R^1 , R^2 og R^3 er som definert i krav 1 og PG' er en beskyttende gruppe, med en karboksylsyre av formel IV

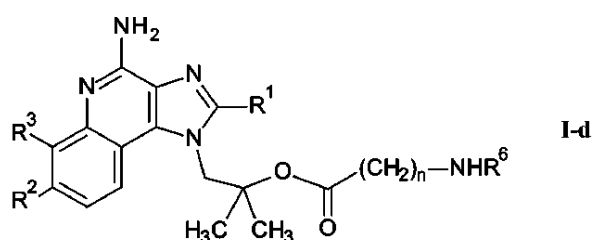
4



der n er som definert i krav 1 og PG'' er en beskyttende gruppe, i nærvær av et forestringsmiddel og fjerne beskyttende gruppene PG' og PG'' med et mildt reduksjonsmiddel for å oppnå en forbindelse av formel I-b



der R¹ til R³ og n er som definert i krav 1, og eventuelt også binde forbindelsen av formel I-a til en alkohol eller syre av formel R⁶-OH eller et aldehyd av formel R⁶=O for å oppnå en forbindelse av formel I-d



der R¹ til R³, m og R⁶ er som definert i krav 1, og, opsjonelt, omdanne den oppnådde forbindelsen til et farmasøytisk aksepterbart salt.