



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3233827 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 401/14 (2006.01)
A61K 31/395 (2006.01)
A61P 31/04 (2006.01)
C07D 405/14 (2006.01)
C07D 413/14 (2006.01)
C07D 471/04 (2006.01)
C07D 491/04 (2006.01)
C07D 493/04 (2006.01)
C07D 495/04 (2006.01)
C07D 497/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2020.11.02
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.07.08
(86)	European Application Nr.	15808404.6
(86)	European Filing Date	2015.12.14
(87)	The European Application's Publication Date	2017.10.25
(30)	Priority	2014.12.17, EP, 14198414
(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	Aziende Chimiche Riunite Angelini Francesco A.C.R.A.F. S.p.A., Viale Amelia, 70, 00181 Roma, Italia
(72)	Inventor	OMBRATO, Rosella, Via Abigaille Zanetta 68, 00143 Roma, Italia GAROFALO, Barbara, Via Latina 49, 00179 Roma, Italia MANGANO, Giorgina, Via Gran Paradiso 84, 00139 Roma, Italia CAPEZZONE DE JOANNON, Alessandra, Piazza dei Vespri Siciliani 7, 00161 Roma, Italia CORSO, Gaia, Via Ersilia Maino Bronzini 48, 00143 Roma, Italia CAVARISCHIA, Claudia, Via Giuseppe Donati 119, 00159 Roma, Italia FURLOTTI, Guido, Via Ferdinando Palasciano 96, 00151 Roma, Italia IACOANGELI, Tommaso, Via Baldassarre Orero 54, 00159 Roma, Italia
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54) Title **ANTIBACTERIAL COMPOUNDS HAVING BROAD SPECTRUM OF ACTIVITY**

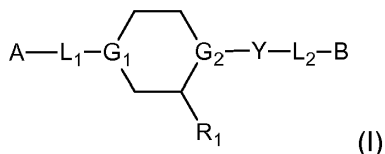
(56) References

Cited: WO-A1-2010/084152
WO-A1-2013/068948
WO-A1-2010/081874

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 med formel (I):



5 hvor

G_1 og G_2 , identiske eller ulike hverandre, er CH eller N, forutsatt at minst én av G_1 og G_2 er N;

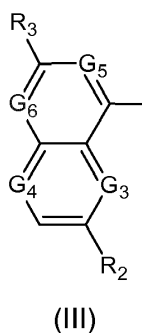
R₁ er hydrogenatom, halogenatom, OH, (C₁₋₃)alkyl, (C₁₋₃)alkoksy, (C₁₋₃)alkyl-OH, -COOR' eller -CONR'R'', hvor R' og R'', identiske eller ulike hverandre, er hydrogenatom eller (C₁₋₃)alkyl;

L₁ er en σ -binding, -CH₂-, -O- eller -NH-;

Y er (C₁₋₆)alkylenylgruppe, -NH-(C₁₋₆)alkylenylgruppe eller (C₄₋₅)sykloalkylenylgruppe, der gruppen eventuelt er substitueret med en hydroksygruppe eller en aminogruppe eller en formamidgruppe-(NH-CHO);

15 L₂ er σ -binding, -NH- eller -NH-(C₁₋₆)alkylenyl-;

A er a kondensert bisyklisk gruppe med formel (III)



hvor

G₃ er N eller C(R'), hvor R' er H eller (C₁₋₃)alkyl;

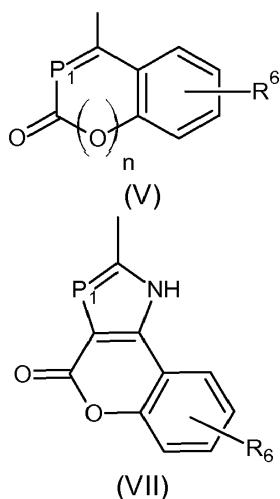
20 G₄, G₅, og G₆, identiske eller ulike hverandre, er CH, CF, C-CN, eller N,

R₂ er hydrogenatom, halogenatom, hydroksy, cyano, (C₁₋₃)alkyl, (C₁₋₃)alkoksy, CF₃, OCF₃ eller NR'R'', hvor R' og R'', identiske eller ulike hverandre, er hydrogenatom eller (C₁₋₃)alkyl; og

R₃ er hydrogenatom, halogenatom, hydroksy, cyano, (C₁₋₃)alkyl, (C₁₋₃)alkoksy, trifluorometyl eller NR'R'', hvor R' og R'' er hydrogenatom eller (C₁₋₃)alkyl;

og

B er en kondensert bisyklisk gruppe med følgende formel (V), eller en kondensert trisyklisk gruppe med følgende formel (VII):



hvor

P_1 er N eller CR' , hvor R' er H, CN eller CF_3 ;

n er 0 eller 1; og

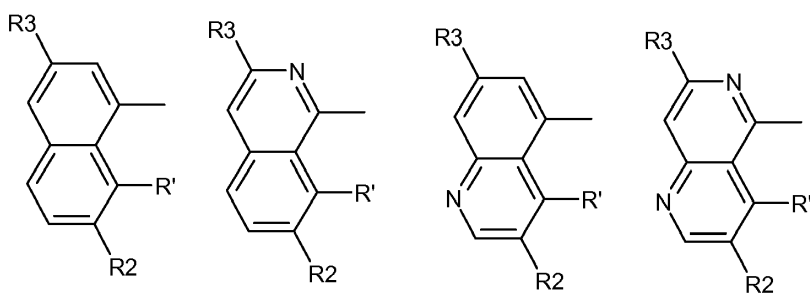
5 R_6 er hydrogenatom, halogenatom, CF_3 , hydroksy eller $NR'R''$.

hvor R' og R'' , identiske eller ulike hverandre, er hydrogenatom eller (C_{1-3}) alkyl;

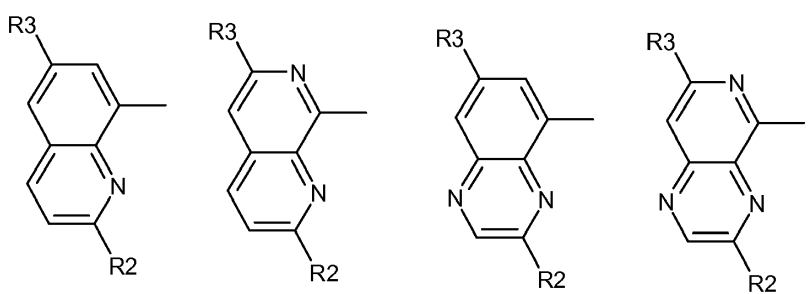
og addisjonssalter med farmasøytisk akseptable organiske eller uorganiske syrer eller baser, enantiomerer, N-oksider og kvaternære ammoniumsalter av forbindelsen med formel (I).

10

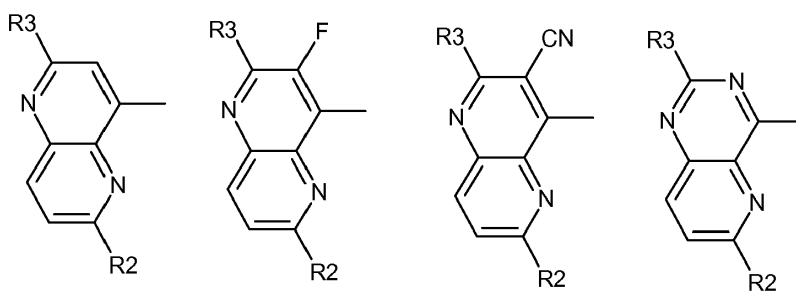
2. Forbindelse ifølge krav 1, hvor A er en kondensert bisyklisk ring med en av de følgende formlene:



15



3



hvor

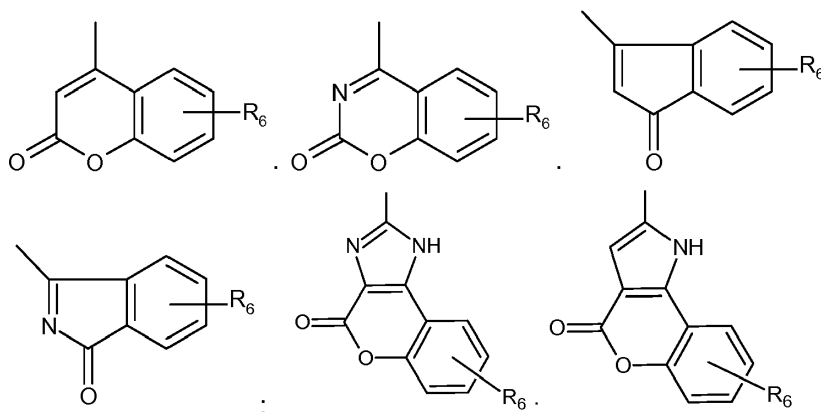
R' er H eller (C₁₋₃)alkyl

R₂ er hydrogenatom, halogenatom, hydroksy, cyano, (C₁₋₃)alkyl, (C₁₋₃)alkoksy, OCF₃ eller NR'R'', hvor R' og R'', identiske eller ulike hverandre, er hydrogenatom eller (C₁₋₃)alkyl; og

R₃ er hydrogenatom, halogenatom, hydroksy, cyano, (C₁₋₃)alkyl, (C₁₋₃)alkoksy, trifluorometyl eller NR'R'', hvor R' og R'' er hydrogenatom eller (C₁₋₃)alkyl.

10

3. Forbindelse ifølge krav 1, hvor B er en kondensert bisyklisk eller trisyklisk gruppe med en av de følgende formlene:



15

hvor R₆ er hydrogenatom, halogenatom, CF₃, hydroksy eller NR'R'', hvor R' og R'', identiske eller ulike hverandre, er hydrogenatom eller (C₁₋₃)alkyl.

4. Forbindelse ifølge krav 1, hvor G3 er N, CH eller C(CH₃).

20

5. Forbindelse ifølge hvilket som helst av de foregående krav 1 til 4, hvor R₃ er hydrogenatom, halogenatom, cyano, (C₁₋₃)alkyl eller NR'R'', hvor R' og R'' er hydrogenatom eller (C₁₋₃)alkyl.

6. Forbindelse ifølge hvilket som helst av de foregående krav 1 til 4, hvor R₃ er hydrogenatom, F, Cl, cyano, CH₃, NH₂ eller N(CH₃)₂.

25

7. Forbindelse ifølge hvilket som helst av de foregående krav 1 til 4, hvor nevnte R_1 er hydrogenatom, fluoratom, kloratom, OH, (C_{1-3}) alkyl-OH, -COOR' eller -CON(R')(R''), hvor R' og R'', identiske eller ulike hverandre, er hydrogenatom eller (C_{1-3}) alkyl.
- 5 8. Forbindelse ifølge hvilket som helst av de foregående krav 1 til 4, hvor nevnte R_2 er hydrogenatom, halogenatom, cyano, (C_{1-3}) alkyl, (C_{1-3}) alkoksy, eller NR'R'', hvor R' og R'', identiske eller ulike hverandre, er hydrogenatom eller (C_{1-3}) alkyl.
- 10 9. Forbindelse ifølge hvilket som helst av de foregående krav 1 til 4, hvor nevnte Y er (C_{1-4}) alkylenylgruppe, -NH- (C_{1-4}) alkylenylgruppe eller (C_{4-5}) sykloalkylenylgruppe, der gruppen eventuelt er substituert med en hydroksygruppe eller en aminogruppe.
10. Forbindelse ifølge hvilket som helst av de foregående krav 1 til 4, hvor nevnte R_6 er et hydrogenatom eller et halogenatom.
- 15 11. Farmasøytisk sammensetning omfattende minst én forbindelse med formel (I) ifølge hvilket som helst av de foregående krav 1 til 10, et salt derav med en farmasøytisk akseptabel organisk eller uorganisk syre eller base, eller en enantiomer derav, eller et kvaternært ammoniumsalt derav, eller et N-oksid derav, og minst ett inert farmasøytisk akseptabelt hjelpestoff.
- 20 12. Forbindelse med formel (I) ifølge hvilket som helst av de foregående krav 1 til 10, for anvendelse i medisin.
- 25 13. Forbindelse med formel (I) ifølge hvilket som helst av de foregående krav 1 til 10, for anvendelse i behandling av bakterielle infeksjoner.
- 30 14. Forbindelse med formel (I) ifølge hvilket som helst av de foregående krav 1 til 10 for anvendelse ifølge krav 13, hvor nevnte bakterielle infeksjoner er valgt fra gruppen bestående av en hudinfeksjon, en slimhinneinfeksjon, en gynekologisk infeksjon, en luftveisinfeksjon (RTI), en CNS-infeksjon, en gastrointestinal infeksjon, en beininfeksjon, en kardiovaskulær infeksjon, en seksuelt overført infeksjon eller en urinveisinfeksjon.