



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 3548016 B1

NORWAY

(19) NO  
(51) Int Cl.  
**C07C 317/44 (2006.01)**  
**A61K 31/10 (2006.01)**  
**A61K 31/167 (2006.01)**  
**A61P 1/00 (2006.01)**  
**A61P 17/00 (2006.01)**  
**A61P 19/02 (2006.01)**  
**A61P 25/00 (2006.01)**  
**C07C 317/32 (2006.01)**  
**C07C 317/46 (2006.01)**

**Norwegian Industrial Property Office**

---

(45)	Translation Published	2021.02.01
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.09.02
(86)	European Application Nr.	17826439.6
(86)	European Filing Date	2017.12.05
(87)	The European Application's Publication Date	2019.10.09
(30)	Priority	2016.12.05, EP, 16202175
(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; TN
(73)	Proprietor	Lead Pharma B.V., Kloosterstraat 9 RK, 5349 AB Oss, Nederland Sanofi, 54 Rue de la Boetie, 75008 Paris, Frankrike
(72)	Inventor	CALS, Joseph Maria Gerardus Barbara, c/o Lead PharmaKloosterstraat 9, 5349 AB Oss, Nederland MACHNIK, David, c/o SanofiGlobal Intellectual Property DepartmentPatents54 rue La Boetie, 75008 Paris, Frankrike NABUURS, Sander Bernardus, c/o Lead PharmaKloosterstraat 9, 5349 AB Oss, Nederland SABUCO, Jean-François, c/o SanofiGlobal Intellectual Property DepartmentPatents54 rue La Boetie, 75008 Paris, Frankrike

(74) Agent or Attorney TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

---

(54) Title **ROR-GAMMA (RORY)-MODULATORS**

(56) References

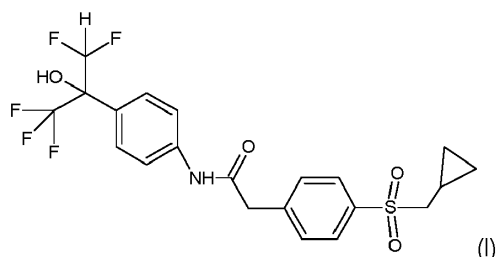
Cited: WO-A1-2015/082533  
EP-A1- 3 101 009

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

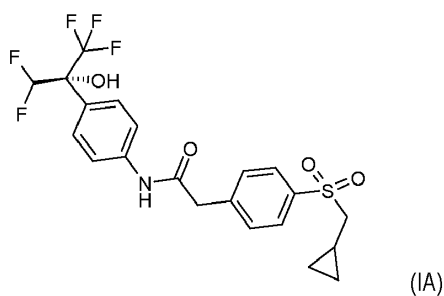
1. En forbindelse med formel (I):

5



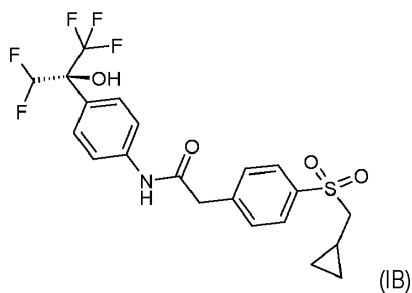
eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

- 10 2. En forbindelse i henhold til krav 1, hvor den absolutte konfigurasjonen svarer til forbindelse med formel (IA), 2-{4-[(syklopropylmetyl)sulfonyl]fenyl}-N-{4-[(1R)-1-(difluormetyl)-2,2,2-trifluor-1-hydroksyetyl]fenyl}acetamid:



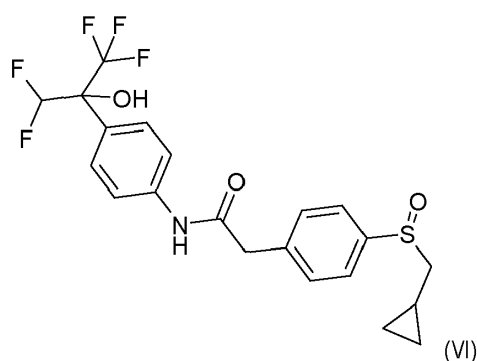
15

3. En forbindelse i henhold til krav 1, hvor den absolutte konfigurasjonen svarer til forbindelser med formel (IB), 2-{4-[(syklopropylmetyl)sulfonyl]fenyl}-N-{4-[(1S)-1-(difluormetyl)-2,2,2-trifluor-1-hydroksyetyl]fenyl}acetamid:



20

4. Forbindelse med formel VI:



2-[4-(syklopropylmetylsulfinyl)fenyl]-N-[4-[1-(difluormetyl)-2,2,2-trifluor-1-  
5 hydroksy-etyl]fenyl]acetamid,

(-)-2-[4-[(S)-syklopropylmetylsulfinyl]fenyl]-N-[4-[(1R)-1-(difluormetyl)-2,2,2-  
trifluor-1-hydroksyetyl]fenyl]acetamid,

(-)-2-[4-[(S)-syklopropylmetylsulfinyl]fenyl]-N-[4-[(1S)-1-(difluormetyl)-2,2,2-  
trifluor-1-hydroksyetyl]fenyl]acetamid,

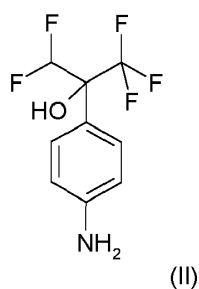
10 (+)-2-[4-[(R)-syklopropylmetylsulfinyl]fenyl]-N-[4-[(1R)-1-(difluormetyl)-2,2,2-  
trifluor-1-hydroksyetyl]fenyl]acetamid,

(+)-2-[4-[(R)-syklopropylmetylsulfinyl]fenyl]-N-[4-[(1S)-1-(difluormetyl)-2,2,2-  
trifluor-1-hydroksyetyl]fenyl]acetamid,

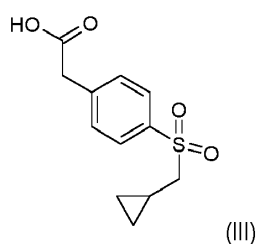
eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

15

**5.** En fremgangsmåte for fremstilling av forbindelsen med formel (I) som krevet i krav  
1 **karakterisert ved at** et amin med formel (II)



20 omsettes med forbindelse med formel (III):



- 5 **6.** En forbindelse i henhold til et hvilket som helst av kravene 1 til 4 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse i terapi.
- 10 **7.** En forbindelse i henhold til et hvilket som helst av kravene 1 til 4 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse ved behandlingen av RORγ-medierte sykdommer eller tilstander.
- 15 **8.** Forbindelsen i henhold til et hvilket som helst av kravene 1 til 4 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse ved behandlingen av RORγ-medierte autoimmune sykdommer, RORγ-medierte inflammatoriske sykdommer og RORγ-medierte infeksjøs sykdommer.
- 20 **9.** En forbindelse i henhold til et hvilket som helst av kravene 1 til 4 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse ved behandlingen av revmatoid artritt, psoriasis, inflammatorisk tarmsykdom, Crohns sykdom og multippel sklerose.
- 25 **10.** Forbindelsen i henhold til et hvilket som helst av kravene 1 til 4 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse ved behandlingen av osteoartritt eller astma.
- 30 **11.** Forbindelsen i henhold til et hvilket som helst av kravene 1 til 4 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse ved behandlingen av slimhinne leishmaniasis.
- 35 **12.** Forbindelsen i henhold til et hvilket som helst av kravene 1 til 4 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse ved behandlingen av Kawaski sykdom eller Hashimotos tyreoiditt.
- 13.** Medikament **karakterisert ved at** det omfatter en forbindelse i henhold til et hvilket som helst av kravene 1 til 4 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.
- 14.** En farmasøytisk sammensetning, som omfatter en forbindelse i henhold til et hvilket som helst av kravene 1 til 4 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav og én eller flere farmasøytisk akseptable eksipienser.

**15.** En farmasøytisk sammensetning i henhold til krav 14 som videre omfatter minst ett ytterligere terapeutisk aktivt middel.