



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3630724 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

C07D 209/30 (2006.01) C07D 209/32 (2006.01)
A61K 31/404 (2006.01) C07D 209/42 (2006.01)
A61K 31/407 (2006.01) C07D 471/04 (2006.01)
A61K 31/437 (2006.01) C07D 513/04 (2006.01)
A61P 31/14 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

- (45) Translation Published 2021.10.04
- (80) Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent 2021.04.28
- (86) European Application Nr. 18729051.5
- (86) European Filing Date 2018.05.18
- (87) The European Application's Publication Date 2020.04.08
- (30) Priority 2017.05.22, EP, 17172247
- (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
- Designated Validation States: MA ; MD ; TN
- (73) Proprietor Janssen Pharmaceuticals, Inc., 1125 Trenton-Harbourton Road, Titusville, NJ 08560, USA
Katholieke Universiteit Leuven, Waaistraat 6, Bus 5105, 3000 Leuven, Belgium
- (72) Inventor BONFANTI, Jean-François, c/o Janssen-Cilag 1 rue Camille Desmoulins TSA 91003, 92787 Issy-les-Moulineaux Cedex 9, France
KESTELEYN, Bart, Rudolf, Romania, c/o Janssen Pharmaceutica NV Turnhoutseweg 30, 2340 Beerse, Belgium
BARDIOT, Dorothée, Alice, Marie-Eve, c/o Cistim Leuven vzw Gaston Geenslaan 2, 3001 Leuven (Heverlee), Belgium
MARCHAND, Arnaud, Didier, M, c/o Cistim Leuven vzw Gaston Geenslaan 2, 3001 Leuven (Heverlee), Belgium
COESEMANS, Erwin, c/o Janssen Pharmaceutica NV Turnhoutseweg 30, 2340 Beerse, Belgium
DE BOECK, Benoît, Christian, Albert, Ghislain, c/o Janssen Pharmaceutica NV Turnhoutseweg 30, 2340 Beerse, Belgium
RABOISSON, Pierre, Jean-Marie, Bernard, c/o Janssen Pharmaceutica NV Turnhoutseweg 30, 2340 Beerse, Belgium
- (74) Agent or Attorney TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

(54) Title **SUBSTITUTED INDOLINE DERIVATIVES AS DENGUE VIRAL REPLICATION INHIBITORS**

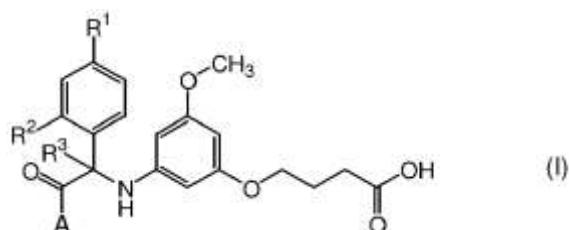
(56) References

Cited: WO-A1-2010/021878
WO-A1-2013/045516
WO-A1-2017/167951
WO-A1-2016/050841
WO-A1-2014/154682

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/>

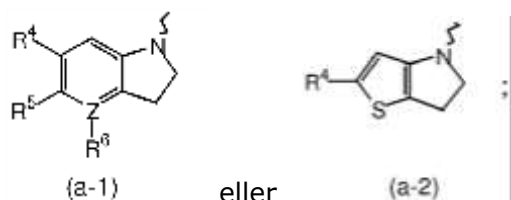
Patentkrav

- 5 **1.** Forbindelse av formel (I), inkludert en hvilken som helst stereokjemisk isomer form derav,



hvor

A er



10

hvor

R^1 er klor, R^2 er hydrogen, R^3 er hydrogen, A er (a-1), R^4 er pentafluorsulfanyl, R^5 er hydrogen, Z er karbon, og R^6 er hydrogen; eller

- 15 R^1 er klor, R^2 er hydrogen, R^3 er hydrogen, A er (a-1), R^4 er trifluormetyl, R^5 er hydrogen, Z er karbon, og R^6 er metyl; eller

R^1 er klor, R^2 er hydrogen, R^3 er hydrogen, A er (a-1), R^4 er trifluormetyl, R^5 er fluor, Z er karbon, og R^6 er hydrogen; eller

R^1 er klor, R^2 er hydrogen, R^3 er hydrogen, A er (a-1), R^4 er trifluormetoksy, R^5 er hydrogen, Z er karbon, og R^6 er metyl; eller

- 20 R^1 er klor, R^2 er hydrogen, R^3 er hydrogen, A er (a-1), R^4 er trifluormetoksy, R^5 er fluor, Z er karbon, og R^6 er hydrogen; eller

R^1 er fluor, R^2 er metoksy, R^3 er hydrogen, A er (a-1), R^4 er trifluormetoksy, R^5 er hydrogen, Z er karbon, og R^6 er hydrogen; eller

- 25 R^1 er klor, R^2 er hydrogen, R^3 er deuterium, A er (a-1), R^4 er trifluormetoksy, R^5 er hydrogen, Z er karbon, og R^6 er hydrogen; eller

R^1 er klor, R^2 er $-OCH_2CH_2OH$, R^3 er hydrogen, A er (a-1), R^4 er trifluormetoksy, R^5 er hydrogen, Z er karbon, og R^6 er hydrogen; eller

R^1 er klor, R^2 er hydrogen, R^3 er hydrogen, A er (a-1), R^4 er trifluormetyl, R^5 er metoksy, Z er nitrogen, og R^6 er fraværende; eller

- 30 R^1 er klor, R^2 er hydrogen, R^3 er hydrogen, A er (a-2), og R^4 er trifluormetyl; eller

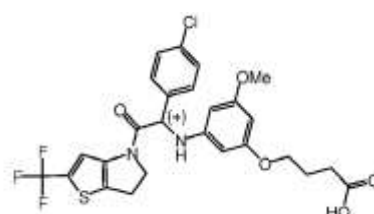
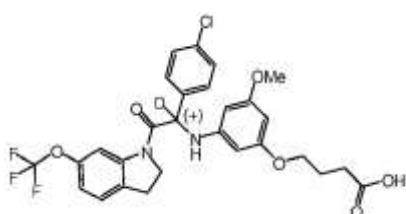
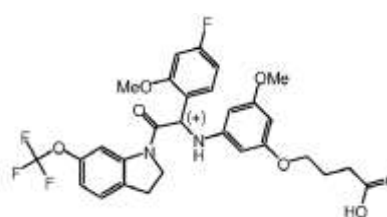
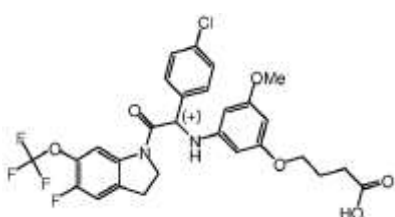
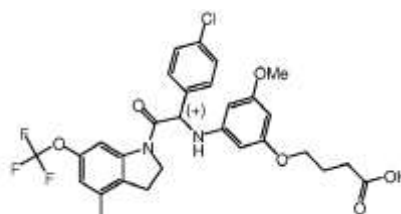
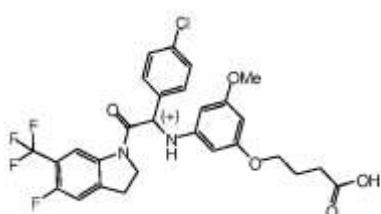
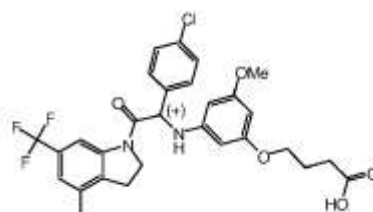
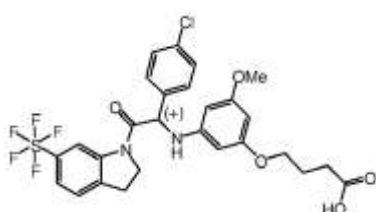
R^1 er klor, R^2 er hydrogen, R^3 er hydrogen, A er (a-1), R^4 er trifluormetyltio, R^5 er hydrogen, Z er karbon, og R^6 er hydrogen;
eller et farmasøytisk akseptabelt salt, solvat eller polymorf derav.

5 **2.** Forbindelsen ifølge krav 1, hvori A er (a-1).

3. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori A er (a-2).

10 **4.** Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvori forbindelsen har (+) spesifikk rotasjon.

5. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori forbindelsen velges fra:



20

6. Farmasøytisk sammensetning omfattende en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5 sammen med én eller flere farmasøytisk akseptable eksipienser,

fortynningsmidler eller bærere.

7. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 6, som omfatter en andre eller ytterligere aktiv bestanddel.

5

8. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 7, hvori den andre eller ytterligere aktive bestanddelen er et antivirumiddel.

9. Forbindelse av formel (I) ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5 for avendelse som en medisin.

10

10. Forbindelse av formel (I) ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5 for anvendelse ved behandling av Dengue-virusinfeksjon og for forebygging eller behandling av sykdom forbundet med Dengue-virusinfeksjon.

15

11. Forbindelse av formel (I) for anvendelse ifølge krav 10, hvori Dengue-virusinfeksjonen er infeksjon fra virus av stammen DENV-1, DENV-2, DENV-3 eller DENV-4.