



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3697784 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 471/04 (2006.01)
A61K 31/437 (2006.01)
A61K 31/501 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2023.10.30
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.10.04
(86)	European Application Nr.	18788711.2
(86)	European Filing Date	2018.10.11
(87)	The European Application's Publication Date	2020.08.26
(30)	Priority	2017.10.20, GB, 201717260
(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
(73)	Proprietor	Galapagos NV, Generaal De Wittelaan L11/A3, 2800 Mechelen, Belgia
(72)	Inventor	VAN DER PLAS, Steven, Emiel, Galapagos NV Generaal De Wittelaan L11/A3, 2800 Mechelen, Belgia MAMMOLITI, Oscar, c/o Galapagos NV Generaal de Wittelaan L11/A3, 2800 Mechelen, Belgia MARTINA, Sébastien, Laurent, Xavier, Generaal De Wittelaan L11/A3, 2800 Mechelen, Belgia CLAES, Pieter, Isabelle, Roger, Klokstraat 112, 9050 Gentbrugge, Belgia COTI, Ghjuvanni, Petru, Diunisu, c/o Galapagos NV Generaal De Wittelaan L11/A3, 2800 Mechelen, Belgia ANNOOT, Denis, Maurice, c/o Galapagos SASU 102 Avenue Gaston Roussel, 93230 Romainville, Frankrike LÓPEZ RAMOS, Miriam, c/o Galapagos SASU 102 Avenue Gaston Roussel, 93230 Romainville, Frankrike GALIEN, René, Alexandre, 102 Avenue Gaston Roussel, 93230 Romainville, Frankrike AMANTINI, David, c/o Galapagos SASU 102 Avenue Gaston Roussel, 93230 Romainville, Frankrike BRYNS, Reginald, Christophe, Xavier, c/o Galapagos NV Generaal De Wittelaan L11/A3, 2800 Mechelen, Belgia
(74)	Agent or Attorney	Cosmovici Intellectual Property, Rue du Commerce 4, 1204 GENÈVE, Sveits

(54)	Title	IMIDAZO[4,5-B]PYRIDINE COMPOUNDS AND PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS THEREOF FOR THE TREATMENT OF INFLAMMATORY DISORDERS
------	-------	---

(56) References

Cited:

WO-A1-2007/077949

WO-A1-2013/116291

WO-A1-2015/110378

US-B1- 9 556 153

DA C ET AL: "Discovery of Mer kinase inhibitors by virtual screening using Structural Protein-Ligand Interaction Fingerpr", BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY, PERGAMON, GB, vol. 23, no. 5, 13 January 2015 (2015-01-13), pages 1096-1101, XP029199007, ISSN: 0968-0896, DOI: 10.1016/J.BMC.2015.01.001

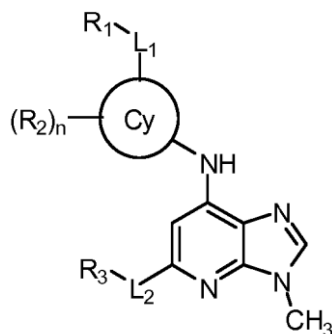
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters 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/>

EP 3 697 784 B1

Patentkrav

1. Forbindelse ifølge formel I:

5



I

hvor

10

Cy er fenyl, eller 5 til 6-leddet heteroaryl omfattende ett, to eller tre N-atomer; L_1 er en enkeltbinding, $-O-$, $-C(=O)-$, $-C(=O)O-$, $-S(O)_2-$, $-NR^{6a}-$, $-C(=O)NR^{6b}-$, $-S(O)_2NR^{6c}-$ eller $-C(=O)NR^{6d}S(O)_2-$;

R^1 er:

15

- H,
- C_{1-6} alkyl eventuelt substitueres med én eller flere uavhengig valgte

20

- OH,
- halo,
- C_{1-4} alkoksy,
- $-NR^{7a}R^{7b}$,
- $-C(=O)OH-$,
- $-C(=O)NR^{7c}R^{7d}$,
- $-C(=O)OC_{1-4}$ alkyl eller

25

- 4 til 8-leddet monosyklisk heterosykloalkyl omfattende ett, to eller tre heteroatomer uavhengig valgt fra N, S og O;

EP 3 697 784 B1

- C₃₋₇ sykloalkyl eventuelt substituert med ett eller flere OH, C₁₋₄ alkoksy, eller

- 4 til 9-leddet monosyklisk eller spirobisyklisk eller broet eller kondensert bisyklisk heterosykloalkyl omfattende ett, to eller tre heteroatomer uavhengig valgt fra N, S og O; hvor heterosykloalkyl eventuelt substitueres med én eller flere uavhengig valgte R¹¹-grupper;

hver R¹¹ er uavhengig:

- OH,

- CN,

- halo,

- okso,

- -NR^{8a}R^{8b},

- C₃₋₇ sykloalkyl,

- C₁₋₄ alkyl eventuelt substituert med ett eller flere uavhengig valgte halo, OH, C₁₋₄ alkoksy, - NR^{9a}R^{9b},

- C₁₋₄ alkoksy eventuelt substituert med ett C₁₋₄ alkoksy,

- 4 til 7-leddet monosyklisk heterosykloalkyl omfattende ett, to eller tre heteroatomer uavhengig valgt fra N, S og O,

- -C(=O)OC₁₋₄ alkyl, eller

- -NR^{8c}C(=O)OC₁₋₄ alkyl;

R² er

- halo,

- CN, eller

- C₁₋₄ alkyl;

den senkede skriften n er 0, eller 1;

L₂ er O, eller -NR⁴-,

R³ er

- C₁₋₆ alkyl eventuelt substitueres med én eller flere uavhengig valgte

◦ halo, eller

EP 3 697 784 B1

◦ C₃₋₇ sykloalkyl,

- Fenyl substituert med én R^{5a}-gruppe og én eller flere uavhengig valgte R^{5b}-grupper,

- 6-leddet heteroaryl omfattende ett eller to N-atomer, substituert med én R^{5a}-gruppe og én eller to uavhengig valgte R^{5b}-grupper,

- 4 til 10-leddet monosyklisk eller kondensert, broet eller spirobisyklisk heterosykloalkyl omfattende ett eller to heteroatomer uavhengig valgt fra N, S og O, eventuelt substituert med én, to eller tre grupper uavhengig valgt fra R^{5a} and R^{5b}, eller

- 4 til 10-leddet monosyklisk eller kondensert, broet eller spirobisyklisk sykloalkyl, eventuelt substituert med én, to eller tre grupper uavhengig valgt fra R^{5a} and R^{5b},

R⁴ er

- H,

- C₁₋₄ alkyl eventuelt substitueres med én eller flere uavhengig valgte OH eller C₁₋₄ alkoksy, eller

- C₃₋₇ sykloalkyl;

R^{5a} er -CN, -SO₂-C₁₋₄ alkyl eller -CF₃;

hver R^{5b} velges uavhengig fra halo, C₁₋₄ alkyl og C₃₋₇ sykloalkyl;

hver R^{7a} og R^{7b} velges uavhengig fra

-H, og

- C₁₋₄ alkyl eventuelt substitueres med én -NR^{10a}R^{10b}; og

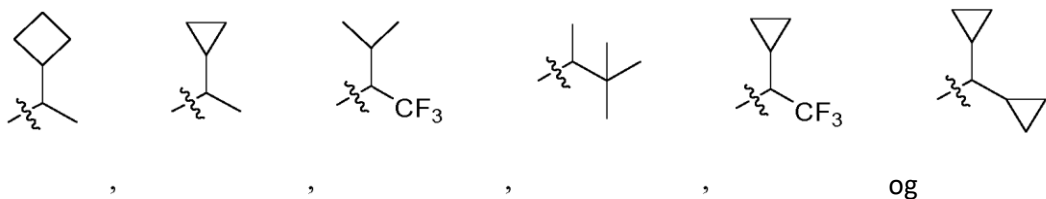
hver R^{6a}, R^{6b}, R^{6c}, R^{6d}, R^{7c}, R^{7d}, R^{8a}, R^{8b}, R^{8c}, R^{9a}, R^{9b}, R^{10a} og R^{10b} uavhengig velges fra H,

og C₁₋₄ alkyl;

eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, eller et solvat eller solvatet til et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

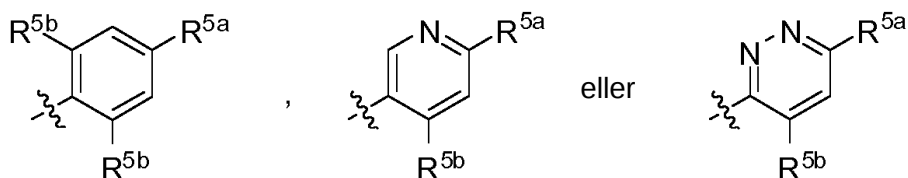
2. Forbindelsen eller farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge krav 1, hvori L₂ er O.

3. Forbindelsen eller farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge krav 1, hvori R³ velges fra:



4. Forbindelsen eller farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge krav 1, hvori R³ er

5

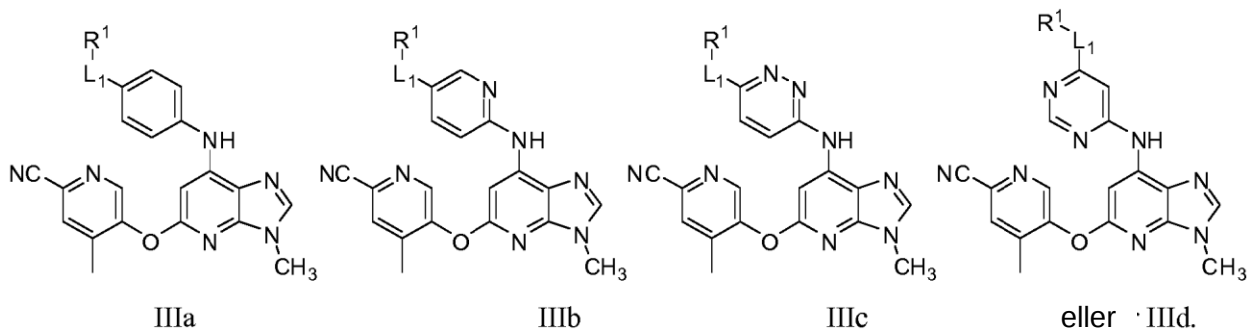


5. Forbindelsen eller farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge et hvilket som helst av kravene 1– 4, hvori R^{5a} er -CN, -SO₂-C₁₋₄ alkyl eller -CF₃.

10

6. Forbindelsen eller farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge et hvilket som helst av kravene 1– 4, hvori R^{5b} uavhengig velges fra halo, C₁₋₄ alkyl og C₃₋₇ sykloalkyl.

7. Forbindelsen eller det farmasøytisk akseptable saltet derav ifølge krav 1, hvori forbindelsen er
15 iht. formel IIIa, IIIb, IIIc eller IIId:



20 **8.** Forbindelsen eller farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge krav 1, eller 7, hvori L_1 er en enkeltbinding eller $-C(=O)-$.

9. Forbindelsen eller farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge et hvilket som helst av kravene 1–8, hvori R¹ er 4 til 9-leddet monosyklisk eller spirobisyklisk eller broet eller kondensert bisyklisk

EP 3 697 784 B1

heterosykloalkyl omfattende ett, to eller tre heteroatomer uavhengig valgt fra N, S og O; hvor heterosykloalkyl eventuelt substitueres med én, to eller tre uavhengig valgte R¹¹-grupper;

5 **10.** Forbindelsen eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, ifølge et hvilket som helst av kravene 1–8, hvori R¹ er azetidiny, oksetanyl, pyrrolidiny, morfoliny, oktadeuteriomorfolin-4-yl, tetrahydropyranyl, piperaziny, dioksanyl, hvor hver av dem substitueres med én, to eller tre uavhengig valgte R¹¹-grupper.

10 **11.** Forbindelsen eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, ifølge krav 9 eller 10, hvori R¹¹ er C₁₋₄ alkyl eventuelt substitueres med ett eller flere uavhengig valgte halo, OH, C₁₋₄ alkoksy, -NR^{9a}R^{9b}, hvori hver R^{9a} og R^{9b} er uavhengig H, eller C₁₋₄ alkyl.

15 **12.** Farmasøytisk sammensetning omfattende en farmasøytisk akseptabel bærer og en farmasøytisk effektiv mengde av en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–11.

13. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 12, omfattende videre et terapeutisk middel.

20 **14.** Forbindelsen eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, ifølge et hvilket som helst av kravene 1–11, eller den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 12–13 til anvendelse i medisin.

25 **15.** Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–11, eller den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 12–13, til anvendelse ved behandlingen eller profylakse av allergiske sykdommer, inflammatoriske sykdommer, metaboliske sykdommer, autoinflammatoriske sykdommer, autoimmune sykdommer, proliferative sykdommer, transplantasjonsavvisning, sykdommer som involverer svekket bruskfornyelse og/eller medfødte misdannelser av brusk.