



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3889145 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 401/04 (2006.01)
A61K 31/4709 (2006.01)
A61P 3/10 (2006.01)
A61P 9/10 (2006.01)
A61P 17/06 (2006.01)
A61P 19/00 (2006.01)
A61P 25/00 (2006.01)
A61P 29/00 (2006.01)
A61P 37/00 (2006.01)

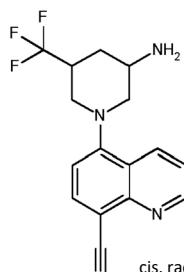
Norwegian Industrial Property Office

| | | |
|------|--|---|
| (45) | Translation Published | 2024.04.29 |
| (80) | Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent | 2024.02.21 |
| (86) | European Application Nr. | 21172996.7 |
| (86) | European Filing Date | 2016.12.16 |
| (87) | The European Application's Publication Date | 2021.10.06 |
| (30) | Priority | 2015.12.17, US, 201562268765 P 2016.06.23, US, 201662353603 P |
| (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 |
| (73) | Proprietor | Merck Patent GmbH, Frankfurter Strasse 250, 64293 Darmstadt, Tyskland |
| (72) | Inventor | Sherer, Brian, Billerica, MA 01821-3936, USA Brugger, Nadia, Burlington, MA 01803, USA |
| (74) | Agent or Attorney | ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge |
| (54) | Title | 8-CYANO-5-PIPERIDINO-QUINOLINES AS TLR7/8 ANTAGONISTS AND THEIR USES FOR TREATING IMMUNE DISORDERS |
| (56) | References Cited: | WO-A1-2015/057659 WO-A1-2015/057655 |

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

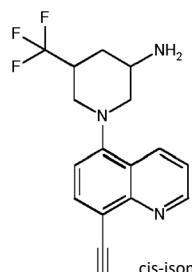
1. Forbindelse, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, valgt fra



cis, racemisk



cis-isomer 1 (3S, 5R)



cis-isomer 2 (3R, 5S)

og

5

2. Forbindelsen ifølge krav 1, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori forbindelsen er cis-5-(3-amino-5-trifluormetyl-piperidin-1-yl)-kinolin-8-karbonitril.

3. Forbindelsen ifølge krav 2.

10

4. Forbindelsen ifølge krav 1, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori forbindelsen er 5-((3R,5S)-3-amino-5-trifluormetyl-piperidin-1-yl)-kinolin-8-karbonitril.

5. Forbindelsen ifølge krav 4.

15

6. Farmasøytisk sammensetning som omfatter en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og et/en farmasøytisk akseptabel(t) adjuvans, bærer eller vehikkel.

20 **7.** Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse som et medikament.

25 **8.** Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5, eller et fysiologisk akseptabelt salt derav, for anvendelse innen behandling av en TLR7/8-mediert lidelse hos en pasient som trenger det, hvori lidelsen er valgt fra revmatoid artritt, psoriasisartritt, osteoartritt, lupus, systemisk lupus erythematosus, lupusnefritt, ankyloserende spondylitt, osteoporose, systemisk sklerose, multippel sklerose, psoriasis, type I-diabetes, type II-diabetes, inflammatorisk tarmsykdom (Crohns

sykdom og ulcerøs kolitt), hyperimmunglobulinemi D og periodisk feber-syndrom, kryopyrin-assosierede periodiske syndromer, Schnitzlers syndrom, systemisk juvenil idiopatisk artritt, Stills sykdom hos voksne, gikt, pseudogikt, SAPHO-syndrom, Castlemans sykdom, sepsis, slag, aterosklerose, cøliaki, DIRA (mangel på IL-1-reseptorantagonist), Alzheimers sykdom, polymyositt, dermatomyositt og Parkinsons sykdom.

9. Forbindelsen eller det fysiologisk akseptable saltet derav for anvendelse ifølge krav 8, hvori den TLR7/8-medierte lidelsen er systemisk lupus erythematosus.