



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2155712 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 401/00 (2006.01)
A61K 31/4745 (2006.01)
A61P 29/00 (2006.01)
A61P 37/00 (2006.01)
C07D 471/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2017.01.16
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2016.09.07
(86)	European Application Nr.	08756054.6
(86)	European Filing Date	2008.05.21
(87)	The European Application's Publication Date	2010.02.24
(30)	Priority	2007.05.22, US, 932948 P
(84)	Designated Contracting States:	AT BE BG CH CY CZ DE DK EE ES FI FR GB GR HR HU IE IS IT LI LT LU LV MC MT NL NO PL PT RO SE SI SK TR
	Designated Extension States:	AL BA MK RS
(73)	Proprietor	ChemoCentryx, Inc., 850 Maude Avenue, Mountain ViewCalifornia 94043, US-USA
(72)	Inventor	LI, Lianfa, 443 Ventura Avenue, Apt. 20, Palo Alto, California 94306, US-USA PENNELL, Andrew M. K., 442 Arlington Street, San Francisco, California 94131, US-USA ZHANG, Penglie, 1036 Jamaica St., Foster City, California 94404, US-USA
(74)	Agent or Attorney	Jesper Levin A/S, Postboks 40, DK-2900 HELLERUP, Danmark

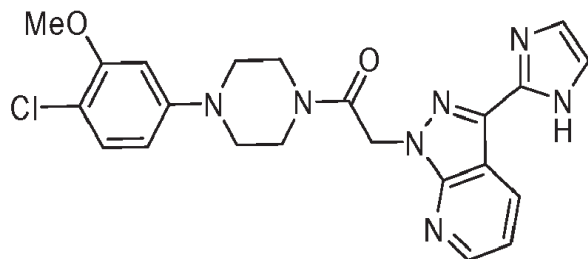
(54)	Title	3-(IMIDAZOLYL)-PYRAZOLO[3,4-B]PYRIDINES
(56)	References Cited:	WO-A1-2008/147822 US-A- 4 238 497 US-A- 4 443 466 US-A- 4 927 942 US-A1- 2007 010 524

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/>

P a t e n t k r a v

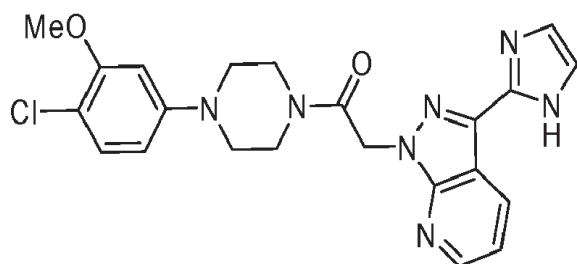
1. Forbindelse på formelen:

5



2. Forbindelse på formelen:

10



eller et farmasøytisk akseptabelt salt, hydrat eller N-oksid av dette.

15

3. Forbindelse ifølge krav 2, i en hydratform.

4. Forbindelse ifølge krav 2, i form av et farmasøytisk akseptabelt salt.

20

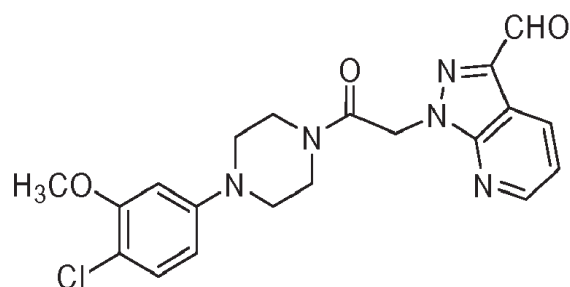
25 **5.** Farmasøytisk sammensetning som omfatter forbindelsen ifølge krav **1** og et farmasøytisk akseptabelt hjelpestoff eller bærestoff.

30 **6.** Farmasøytisk sammensetning som omfatter forbindelsen ifølge krav **2** og et farmasøytisk akseptabelt hjelpestoff eller bærestoff.

7. Framgangsmåte for å framstille forbindelsen ifølge krav**1**, der framgangsmåten omfatter:

35

(a) å sette en forbindelse på formelen:



40 i kontakt med en imidazol-dannende reagens under forhold som er tilstrekkelige til å danne forbindelsen ifølge krav **1**.

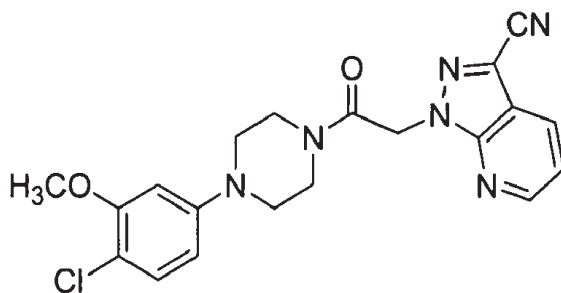
45 **8.** Framgangsmåte ifølge krav 7, der den imidazol-dannende reagensen er valgt fra gruppen som består av glyksal eller en glyksal-ekvivalent.

9. Framgangsmåte ifølge krav 7, der den imidazol-dannende reagensen er glyksal, og ikontaktsettingen skjer i nærvær av ammoniumacetat.

50

10. Framgangsmåte for å framstille en forbindelse på formelen ifølge krav **1**, der framgangsmåten omfatter:

55 (a) å sette en forbindelse på formelen:



i kontakt med etylendiamin for å danne et imidazolin-produkt; og

60

(b) å oksidere imidazolin-produktet, slik at det danner forbindelsen på formelen ifølge krav **1**.

65 **11.** Framgangsmåte ifølge krav **10**, der oksideringen utføres ved hjelp av en reagens valgt fra gruppen som består av KMnO_4 , MnO_2 , $\text{PhI}(\text{OAc})_2$, Swern-reagenser og Dess-Martin-periodan.

70 **12.** Forbindelse ifølge krav **2** til bruk i en framgangsmåte for å behandle CCR1-medierte sykdommer eller tilstander.

75 **13.** Forbindelse til bruk ifølge krav **12**, der den CCR1-medierte sykdommen eller tilstanden er en betennelsestilstand eller er en immunregulatorisk lidelse.

14. Forbindelse til bruk ifølge krav **12**, der den CCR1-medierte sykdommen eller tilstanden er valgt fra gruppen som består av revmatoid artritt, multippel

80 sklerose, transplantatutstøtelse, restenose, dermatitt, eksem, urticaria, vaskulitt, inflammatorisk tarmsykdom, matallergi, astma, Alzheimers sykdom, Parkinsons sykdom, psoriasis, lupus erythematosus, osteoartritt, slag, restenose og encefalomyelitt.

85

15. Forbindelse til bruk ifølge et av kravene **12** til **14**, der

(a) veien for å administrere forbindelsen er oral, parenteral, rektal, transdermal, sublingval, nasal eller topikal; eller

90

(b) forbindelsen administreres i kombinasjon med et betennelseshemmende middel, et smertestillende middel, et antiproliferativt middel, en metabolismehemmer, en leukocyttmigrasjonshemmer eller en immunmodulator.

95

16. Bruk av en forbindelse ifølge krav **2** til preparering av et medikament til bruk i en framgangsmåte for å behandle CCR1-medierte sykdommer eller tilstander, opsjonelt der:

100

(a) den CCR1-medierte sykdommen eller tilstanden er en betennelsestilstand eller er en immunregulatorisk lidelse; eller

105

(b) den CCR1-medierte sykdommen eller tilstanden er valgt fra gruppen som består av revmatoid artritt, multippel sklerose, transplantatutstøtelse, restenose, dermatitt, eksem, urticaria, vaskulitt, inflammatorisk tarmsykdom, matallergi, astma, Alzheimers sykdom, Parkinsons sykdom, psoriasis, lupus erythematosus, osteoartritt, slag, restenose og encefalomyelitt; eller

110

(c) veien for å administrere forbindelsen er oral, parenteral, rektal, transdermal, sublingval, nasal eller topikal; eller

115

(d) forbindelsen administreres i kombinasjon med et betennelseshemmende middel, et smertestillende middel, et antiproliferativt middel, en metabolismehemmer, en leukocyttmigrasjonshemmer eller en immunmodulator.