



(12) Translation of
european patent specification

(11) NO/EP 2485736 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/54 (2006.01)
C07B 59/00 (2006.01)
C07D 285/18 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01)
C07D 403/04 (2006.01)
C07D 403/12 (2006.01)
C07D 417/04 (2006.01)
C07D 417/12 (2006.01)
C07D 417/14 (2006.01)
C07D 471/04 (2006.01)
C07D 495/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2016.04.11
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2015.12.16
(86)	European Application Nr.	10822567.3
(86)	European Filing Date	2010.10.06
(87)	The European Application's Publication Date	2012.08.15
(30)	Priority	2009.10.08, US, 249685 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
	Designated Extension States:	BA ME
(73)	Proprietor	Merck Sharp & Dohme Corp., 126 East Lincoln Avenue, Rahway, NJ 07065-0907, US-USA
(72)	Inventor	SCOTT, Jack, D., 2000 Galloping Hill Road, Kenilworth, New Jersey 07033, US-USA STAMFORD, Andrew, W., 2000 Galloping Hill Road, Kenilworth, New Hampshire 07033, US-USA GILBERT, Eric, J., 2000 Galloping Hill Road, Kenilworth, New Jersey 07033, US-USA CUMMING, Jared, N., 2000 Galloping Hill Road, Kenilworth, New Jersey 07033, US-USA ISERLOH, Ulrich, 2000 Galloping Hill Road, Kenilworth, New Jersey 07033, US-USA MISIASZEK, Jeffrey, A., 2000 Galloping Hill Road, Kenilworth, New Jersey 07033, US-USA LI, Guoqing, 2000 Galloping Hill Road, Kenilworth, New Jersey 07033, US-USA
(74)	Agent or Attorney	Tandbergs Patentkontor AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

(54)	Title	IMINOTHIADIAZINE DIOXIDE COMPOUNDS AS BACE INHIBITORS, COMPOSITIONS, AND THEIR USE
------	-------	--

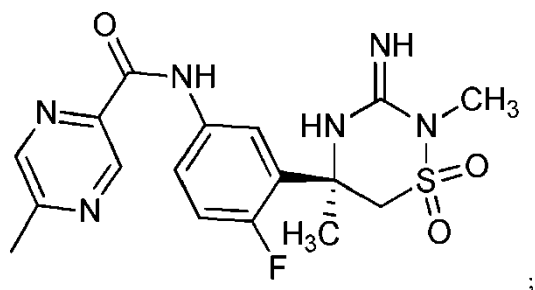
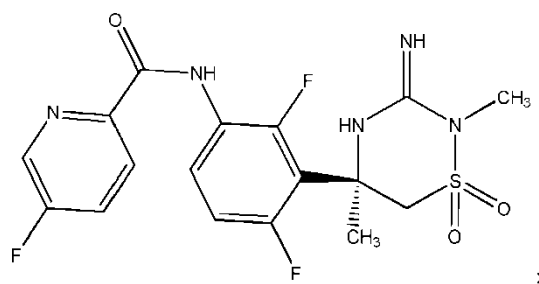
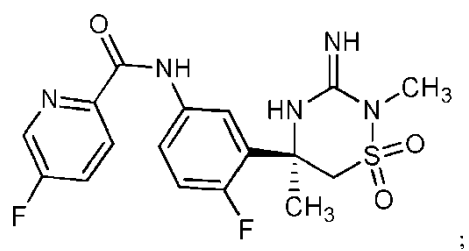
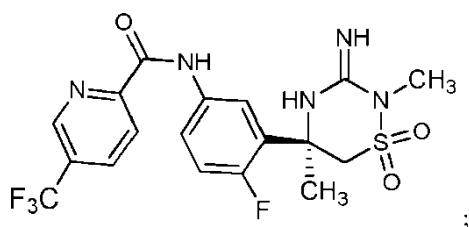
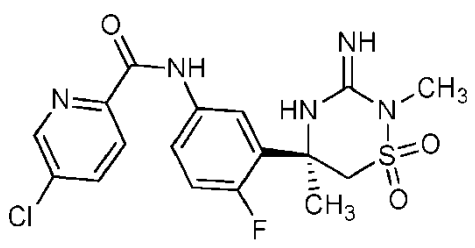
(56) References
Cited:

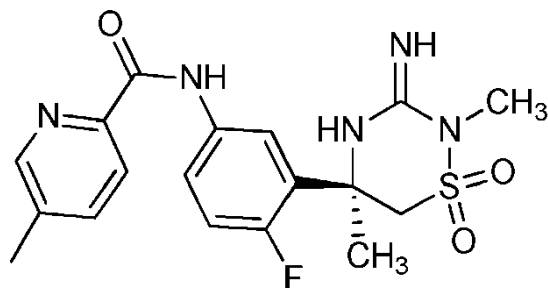
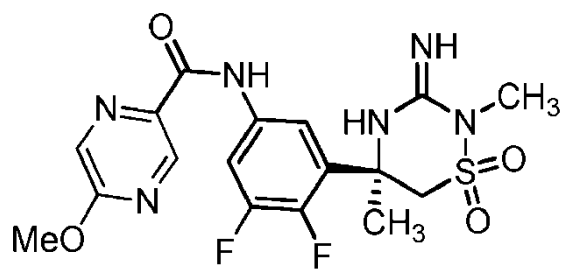
- WO-A2-2006/065277
 WO-A2-2006/138266
 US-A1- 2007 287 692
 US-A1- 2008 200 445 BCYNTHIA M. HONG ET AL: "The development of a one pot, regiocontrolled, three-component reaction for the synthesis of thieno[2,3-c]pyrroles", ORGANIC & BIOMOLECULAR CHEMISTRY, vol. 11, no. 18, 1 January 2013 (2013-01-01), page 2932, XP055191221, ISSN: 1477-0520, DOI: 10.1039/c3ob27492f
 Steven D. Paget ET AL: "Synthesis and antibacterial activity of pyrroloaryl-substituted oxazolidinones", Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, vol. 13, no. 23, 1 December 2003 (2003-12-01), pages 4173-4177, XP055191228, ISSN: 0960-894X, DOI: 10.1016/j.bmcl.2003.08.031
 JINPING. LIU ET AL: "Capillary electrophoresis of amino sugars with laser-induced fluorescence detection", ANALYTICAL CHEMISTRY, vol. 63, no. 5, 1 March 1991 (1991-03-01), pages 413-417, XP055191261, ISSN: 0003-2700, DOI: 10.1021/ac00005a005
 JINPING. LIU ET AL: "Design of 3-(4-carboxybenzoyl)-2-quinolinecarboxaldehyde as a reagent for ultrasensitive determination of primary amines by capillary electrophoresis using laser fluorescence detection", ANALYTICAL CHEMISTRY, vol. 63, no. 5, 1 March 1991 (1991-03-01), pages 408-412, XP055191268, ISSN: 0003-2700, DOI: 10.1021/ac00005a004
 Attila Sipos ET AL: "Synthesis of fluorescent ristocetin aglycon derivatives with remarkable antibacterial and antiviral activities", European Journal of Medicinal Chemistry, vol. 58, 1 December 2012 (2012-12-01), pages 361-367, XP055191278, ISSN: 0223-5234, DOI: 10.1016/j.ejmech.2012.10.030
 Attila Sipos ET AL: "Synthesis of fluorescent ristocetin aglycon derivatives with remarkable antibacterial and antiviral activities", European Journal of Medicinal Chemistry, vol. 58, 1 December 2012 (2012-12-01), pages 361-367, XP055191279, ISSN: 0223-5234, DOI: 10.1016/j.ejmech.2012.10.030
 Stephen C. Beale ET AL: "Fluorescence reagents for high-sensitivity chromatographic measurements of primary amines", Analytical Chemistry, vol. 60, no. 17, 1 September 1988 (1988-09-01), pages 1765-1769, XP055191280, ISSN: 0003-2700, DOI: 10.1021/ac00168a025

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/>

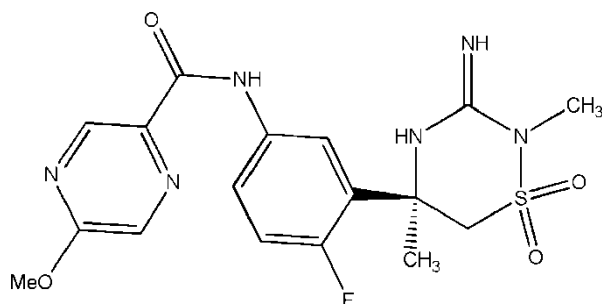
Patentkrav

1. En forbindelse, eller en tautomer derav, eller et farmasøytisk akseptabelt salt av
5 nevnte forbindelse eller nevnte tautomer, idet nevnte forbindelse har en struktur valgt fra:



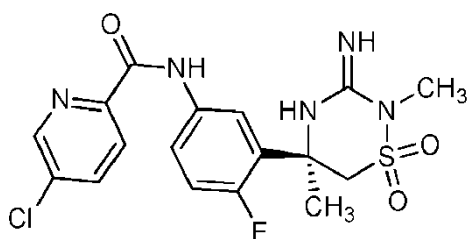


og



5

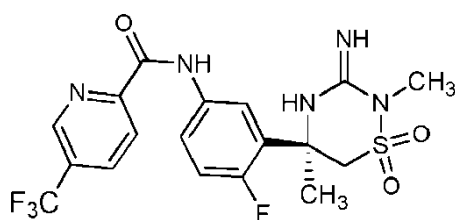
2. Forbindelse ifølge krav 1, eller en tautomer derav, eller et farmasøytisk akseptabelt salt av nevnte forbindelse eller nevnte tautomer, idet nevnte forbindelse har strukturen:



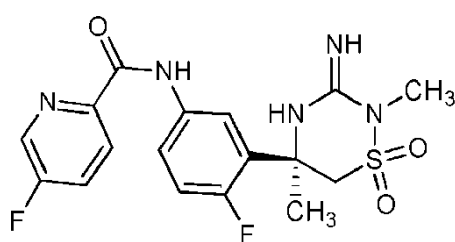
10

3. Forbindelse ifølge krav 1, eller en tautomer derav, eller et farmasøytisk akseptabelt salt av nevnte forbindelse eller nevnte tautomer, idet nevnte forbindelse har strukturen:

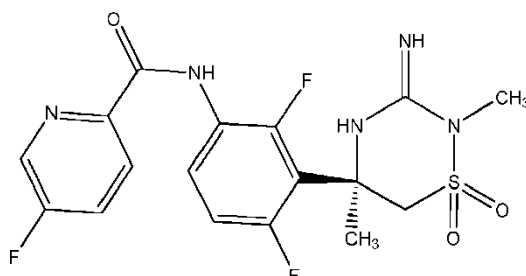
15



4. Forbindelse ifølge krav 1, eller en tautomer derav, eller et farmasøytisk akseptabelt salt av nevnte forbindelse eller nevnte tautomer, idet nevnte forbindelse har strukturen:

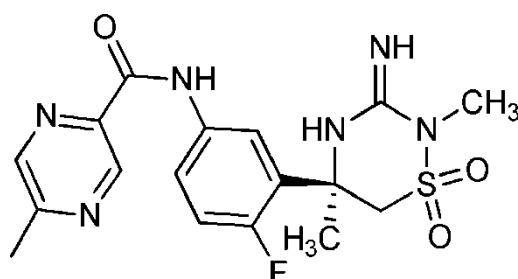


5. Forbindelse ifølge krav 1, eller en tautomer derav, eller et farmasøytisk akseptabelt salt av nevnte forbindelse eller nevnte tautomer, idet nevnte forbindelse har strukturen:



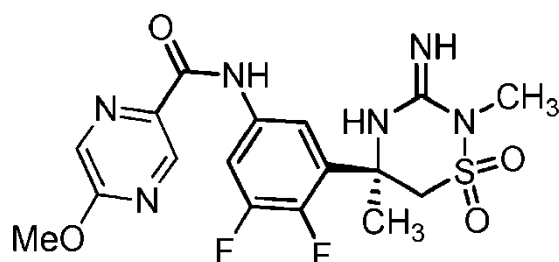
15

6. Forbindelse ifølge krav 1, eller en tautomer derav, eller et farmasøytisk akseptabelt salt av nevnte forbindelse eller nevnte tautomer, idet nevnte forbindelse har strukturen:

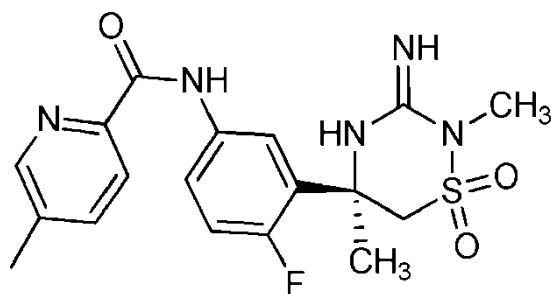


20

7. Forbindelse ifølge krav 1, eller en tautomer derav, eller et farmasøytisk akseptabelt salt av nevnte forbindelse eller nevnte tautomer, idet nevnte forbindelse har strukturen:

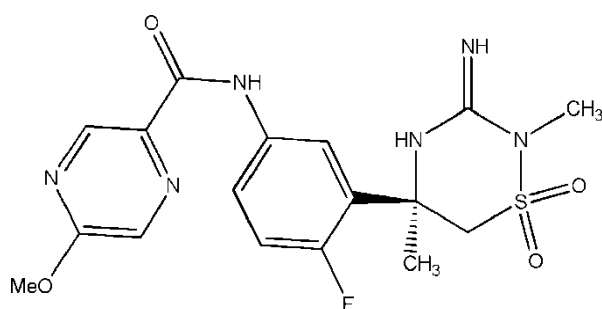


5 8. Forbindelse ifølge krav 1, eller en tautomer derav, eller et farmasøytisk akseptabelt salt av nevnte forbindelse eller nevnte tautomer, idet nevnte forbindelse har strukturen:



10

9. Forbindelse ifølge krav 1, eller en tautomer derav, eller et farmasøytisk akseptabelt salt av nevnte forbindelse eller nevnte tautomer, idet nevnte forbindelse har strukturen:



15

10. Forbindelse ifølge hvilket som helst foregående krav, som er i form av den frie base.

11. Forbindelse ifølge hvilket som helst av kravene 1-9, som er i form av et syreaddisjonssalt.

12. En forbindelse, eller en tautomer derav, eller et farmasøytisk akseptabelt salt av nevnte forbindelse eller nevnte tautomer, i henhold til hvilket som helst foregående krav for anvendelse i medisin.

13. En farmasøytisk sammensetning omfattende minst én forbindelse ifølge hvilket som helst av kravene 1-11, eller en tautomer derav, eller et farmasøytisk akseptabelt salt av nevnte forbindelse eller nevnte tautomer, og en farmasøytisk akseptabel bærer eller fortynningsmiddel.

14. En forbindelse, eller en tautomer derav, eller et farmasøytisk akseptabelt salt av nevnte forbindelse eller nevnte tautomer, i henhold til hvilket som helst av kravene 1-11, for anvendelse ved behandling, forebyggelse og/eller forsinkelse av utbrudd av en patologi valgt fra: Alzheimers sykdom, Downs syndrom, Parkinsons sykdom, slag, mikrogliose, hjernebetennelse, pre-senil demens, senil demens, progressiv supranukleær lammelse, kortikal basal degenerering, olfaktorisk svekkelse assosiert med Alzheimers sykdom, Parkinsons sykdom og/eller Downs syndrom, β -amyloid angiopati, cerebral amyloid angiopati, arvelig hjerneblødning, mild kognitiv svikt ved glaukom, amyloidose, type II diabetes, diabetes-assosiert amyloidogenese, skrapesyke, bovin spongiform encefalitt, Creutzfeld-Jakobs sykdom og traumatisk hjerneskade.

15. Forbindelse eller en tautomer derav, eller et farmasøytisk akseptabelt salt av nevnte forbindelse eller nevnte tautomer, for anvendelse i henhold til krav 14, hvor nevnte patologi er Alzheimers sykdom.