



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 2673266 B1

NORWAY

(19) NO  
(51) Int Cl.  
*C07D 279/20 (2006.01)*  
*A61K 31/5415 (2006.01)*  
*A61P 25/00 (2006.01)*

Norwegian Industrial Property Office

---

|      |                                                                      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |
|------|----------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| (21) | Translation Published                                                | 2016.12.12                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
| (80) | Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent | 2016.07.27                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
| (86) | European Application Nr.                                             | 11749476.5                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
| (86) | European Filing Date                                                 | 2011.08.15                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
| (87) | The European Application's Publication Date                          | 2013.12.18                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
| (30) | Priority                                                             | 2011.02.11, SG, 201101060<br>2011.05.13, US, 201161485880 P                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |
| (84) | Designated Contracting States:                                       | AL AT BE BG CH CY CZ DE DK EE ES FI FR GB<br>GR HR HU IE IS IT LI LT LU LV MC MK MT NL NO<br>PL PT RO RS SE SI SK SM TR                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |
| (73) | Proprietor                                                           | WisTa Laboratories Ltd., 25 Bukit Batok Crescent The Elitist 06-13, Singapore 658066, SG-Singapore                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |
| (72) | Inventor                                                             | MARSHALL, Colin, WisTa Laboratories Ltd.Department of ChemistryMeston Walk, Old Aberdeen AB24 3UEScotland, GB-Storbritannia<br>CLUNAS, Scott, WisTa Laboratories Ltd.Department of ChemistryMeston Walk, Old Aberdeen AB24 3UEScotland, GB-Storbritannia<br>STOREY, John, Mervyn, David, WisTa Laboratories Ltd.Department of ChemistryMeston Walk, Old Aberdeen AB24 3UEScotland, GB-Storbritannia<br>SINCLAIR, James, Peter, WisTa Laboratories Ltd.Department of ChemistryMeston Walk, Old Aberdeen AB24 3UEScotland, GB-Storbritannia<br>BADDELEY, Thomas, Craven, WisTa Laboratories Ltd.Department of ChemistryMeston Walk, Old Aberdeen AB24 3UEScotland, GB-Storbritannia<br>ISHAQ, Ahtsham, WisTa Laboratories Ltd.Department of ChemistryMeston Walk, Old Aberdeen AB24 3UEScotland, GB-Storbritannia<br>SIMPSON, Michael, WisTa Laboratories Ltd.Department of ChemistryMeston Walk, Old Aberdeen AB24 3UEScotland, GB-Storbritannia<br>WILLIAMSON, Craig, ID Business Solutions Ltd.2 Occam CourtSurrey Research Park, Guildford, Surrey, GU2 7QB, GB-Storbritannia<br>WOOD, Barry, Alan, WisTa Laboratories Ltd.Department of ChemistryMeston Walk, Old Aberdeen AB24 3UEScotland, GB-Storbritannia<br>WISCHIK Claude, Michel, WisTa Laboratories Ltd.Institute for Medical SciencesForresterhill, Aberdeen AB25 2ZDScotland, GB-Storbritannia<br>HARRINGTON, Charles, Robert, WisTa Laboratories Ltd.Institute for Medical SciencesForresterhill, Aberdeen AB25 2ZDScotland, GB-Storbritannia<br>RICKARD, Janet, Elizabeth, WisTa Laboratories Ltd.Institute for Medical SciencesForresterhill, Aberdeen AB25 2ZDScotland, GB-Storbritannia<br>HORSLEY, David, WisTa Laboratories Ltd.Institute for Medical SciencesForresterhill, Aberdeen AB25 2ZDScotland, SG-Singapore<br>LOH, Yin, Sze, 47 Leedon Road, Singapore 267858, SG-Singapore<br>KHAN, Karrar, Ahmad, 176 Melton RoadWest Bridgford, Nottingham NG2 6FJ, GB-Storbritannia<br>LARCH, Christopher Paul, WisTa Laboratories Ltd.Department of ChemistryMeston Walk, Old Aberdeen AB24 3UEScotland, GB-Storbritannia |

(74) Agent or Attorney

Zacco Norway AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

---

(54) Title **PHENOTHIAZINE DIAMINIUM SALTS AND THEIR USE**

(56) References  
Cited:

WO-A2-2007/110627

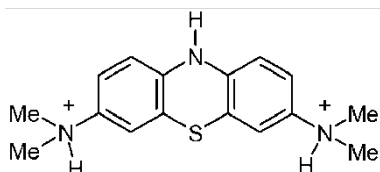
WO-A2-2008/155533

DATABASE REGISTRY [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US;  
2010, XP002661598, retrieved from STN Database accession no. 1236208-20-0

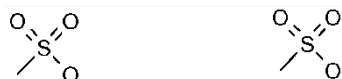
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters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



5



eller et farmasøytisk akseptabelt salt, solvat eller hydrat derav,  
for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling eller profylakse av menneske-  
eller dyrekroppen ved terapi.

10

2. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, som er i krystallinsk form.

3. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 2, som i det vesentlige er i  
renset form.

15

4. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 2, som er til stede i en  
sammensetning omfattende forbindelsen og en farmasøytisk akseptabel bærer  
eller tynner.

20

5. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 4, hvori sammensetningen er en  
farmasøytisk sammensetning som er i fast doseringsform omfattende  
forbindelsen og minst én tynner som er egnet for tørrkomprimering.

25

6. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 5, hvori den faste doseringsformen er  
fremstilt ved direkte komprimering eller ved tørrgranulering.

30

7. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 5 eller krav 6, hvori den minst ene  
tynneren er valgt fra mikrokrySTALLinsk cellulose, laktose, mannitol, kalsiumsalter  
slik som kalsiumfosfat dibasisk, kalsiumsulfat, kalsiumkarbonat og sukkere slik  
som laktose, sukrose, dekstrose og maltodekstrin.

8. Forbindelse for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 5 til 7, hvori  
sammensetningen ytterligere omfatter minst ett desintegreringsmiddel.

9. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 8, hvori desintegreringsmiddelet er valgt fra kryssbundet polyvinylpyrrolidon, natriumstivelsesglykolat, kryssbundet natriumkarboksymetylcellulose eller pregelatinisert stivelse.
- 5
10. Forbindelse for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 5 til 9, hvori den faste doseringsformen er filmbelagt.
11. Forbindelse for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 5 til 10, hvori sammensetningen ytterligere omfatter en syre med en pK1 på mer enn 1,5.
- 10
12. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 11, hvori syren er valgt fra maleinsyre, fosforsyre, askorbinsyre, sorbinsyre, aspartinsyre og sialsyre.
- 15
13. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 11 eller krav 12, hvori sammensetningen ytterligere omfatter en bærer valgt fra mannitol, et cellulosemateriale, en stivelse eller blandinger derav.
- 20
14. Forbindelse for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 5 til 13, karakterisert ved at sammensetningen omfatter partikler hvorav mer enn 10 % har en størrelse på mer enn 10 mikrometer.
- 25
15. Forbindelse for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 14, som er for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling eller profylakse av en patologi forbundet med TDP-43-protein.
- 30
16. Forbindelse for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 14, som er for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling eller profylakse av tauopati.
- 35
17. Forbindelse for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 14, som er for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling eller profylakse av Alzheimers sykdom, Picks sykdom, progressiv supranukleær parese (PSP), frontotemporal demens (FTD), FDT med parkinsonisme knyttet til kromosom 17, frontotemporal lobær degenerasjons- (FTLD-)syndromer; disinhibering-demens-parkinsonisme-amyotrofi-kompleks, pallido-ponto-nigral degenerasjon, Guam-

ALS syndrom; pallido-nigro-luysiansk degenerasjon, kortikobasal degenerasjon, demens med argyrofile korn, dementia pugilistica eller kronisk traumatisk encefalopati, Downs syndrom, demens med Lewy-legemer, subakutt skleroserende panencefalitt, mild kognitiv svikt, Niemann-Picks sykdom type C, Sanfilippos syndrom type B, myotonisk dystrofi DM1 eller DM2 eller amyotrofisk lateral sklerose (ALS).

10 18. Forbindelse for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 14, som er for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling eller profylakse av Alzheimers sykdom.

15 19. Forbindelse for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 14, som er for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling eller profylakse av Parkinsons sykdom.

20 20. Forbindelse for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 14, som er for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling eller profylakse av PSP, ALS eller FTLD.

25 21. Forbindelse for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 14, som er for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling eller profylakse av en polyglutaminsykdom.

30 22. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 21, som er for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling eller profylakse av Huntingtons sykdom, spinal bulbær muskelatrofi, dentatorubro-pallidoluysiansk atrofi eller spinocerebellær ataksi.

35 23. Forbindelse for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 14, som er for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling eller profylakse av hudkreft eller melanom; eller en viral, bakteriell eller protozoisk sykdomstilstand.

24. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 23, hvori den virale, bakterielle eller protozoiske sykdommen er valgt fra hepatitt C, HIV, vestnilvirus (WNV) og malaria.

4

25. Forbindelse for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 24, hvori forbindelsen i behandlingen eller profylaksen administreres oralt.

5 26. Sammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 4 til 14, hvori sammensetningen er en tablett eller en kapsel.