



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2763979 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

C07D 401/10 (2006.01) C07D 405/14 (2006.01)

A61K 31/444 (2006.01) C07D 413/10 (2006.01)

A61K 31/506 (2006.01) C07D 413/14 (2006.01)

A61P 25/28 (2006.01) C07D 417/14 (2006.01)

C07D 401/14 (2006.01) C07D 498/08 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

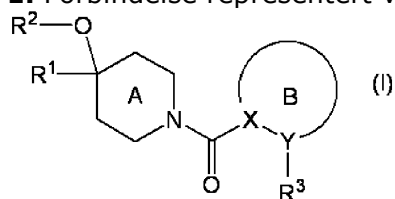
(21)	Translation Published	2019.05.13
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.12.26
(86)	European Application Nr.	12781479.6
(86)	European Filing Date	2012.10.03
(87)	The European Application's Publication Date	2014.08.13
(30)	Priority	2011.10.07, JP, 2011222741
(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	Takeda Pharmaceutical Company Limited, 1-1 Doshomachi 4-chome Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka 541-0045, Japan
(72)	Inventor	KOIKE, Tatsuki, c/o TAKEDA PHARMACEUTICAL COMPANY LIMITED 26-1 Muraoka-Higashi 2-chome, Fujisawa-shi Kanagawa 251-0012, Japan YOSHIKAWA, Masato, c/o TAKEDA PHARMACEUTICAL COMPANY LIMITED 26-1 Muraoka-Higashi 2-chome, Fujisawa-shi Kanagawa 251-0012, Japan ANDO, Haruhi, c/o TAKEDA PHARMACEUTICAL COMPANY LIMITED 26-1 Muraoka-Higashi 2-chome, Fujisawa-shi Kanagawa 251-0012, Japan FARNABY, William John, c/o TAKEDA CAMBRIDGE LIMITED 418 Cambridge Science Park, Cambridge CB4 0PA, Storbritannia
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

(54)	Title	1-ARYLCARBONYL-4-OXY-PIPERIDINE COMPOUNDS USEFUL FOR THE TREATMENT OF NEURODEGENERATIVE DISEASES
(56)	References Cited:	WO-A1-2008/134547 US-A1- 2008 021 022 WO-A2-2007/062999

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 representert ved formelen (I):



5 hvori

R^1 er en C_{1-6} -alkylgruppe eventuelt substituert med 1 til 3 substituenten valgt fra

(1) en C_{6-14} -arylgruppe eventuelt substituert med 1 til 3 substituenten valgt fra

(a) et halogenatom,

(b) en cyanogruppe og

10 (c) en C_{1-6} -alkoksygruppe eventuelt substituert med 1 til 3 halogenatomer

(2) en 5- eller 6-leddet monosyklisk aromatisk heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med 1 til 3 substituenten valgt fra

(a) et halogenatom,

(b) en cyanogruppe og

15 (c) en C_{1-6} -alkoksygruppe eventuelt substituert med 1 til 3 halogenatomer og

(3) en 3- til 8-leddet monosyklisk ikke-aromatisk heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med 1 til 3 substituenten valgt fra

(a) et halogenatom,

(b) en cyanogruppe og

20 (c) en C_{1-6} -alkoksygruppe eventuelt substituert med 1 til 3 halogenatomer;

R^2 er et hydrogenatom eller en C_{1-6} -alkylgruppe;

R^3 er en 5- eller 6-leddet nitrogenholdig aromatisk heterosyklisk gruppe eventuelt substituert med 1 til 3 halogenatomer;

ring A er en piperidinring uten andre substituenten enn R^1 , R^2 -O- og $-C(=O)$ -ring

25 B eller en oksa-9-azabisyklo[3.3.1]nonanring uten andre substituenten enn R^1 , R^2 -O- og $-C(=O)$ -ring B; og

ring B er en 5- eller 6-leddet aromatisk ring (X og Y er uavhengig et karbonatom eller et nitrogenatom) som er, i tillegg til R^3 og $-C(=O)$ -ring A, eventuelt substituert med 1 til 3 substituenten valgt fra

30 (1) et halogenatom,

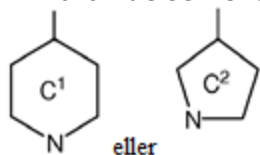
(2) en C_{1-6} -alkylgruppe eventuelt substituert med 1 til 3 halogenatomer,

(3) en C_{1-6} -alkoksygruppe og

(4) en C_{1-6} -alkylendioksygruppe,

eller et salt derav.

2. Forbindelsen eller saltet ifølge krav 1, hvori R^3 er en gruppe representert ved



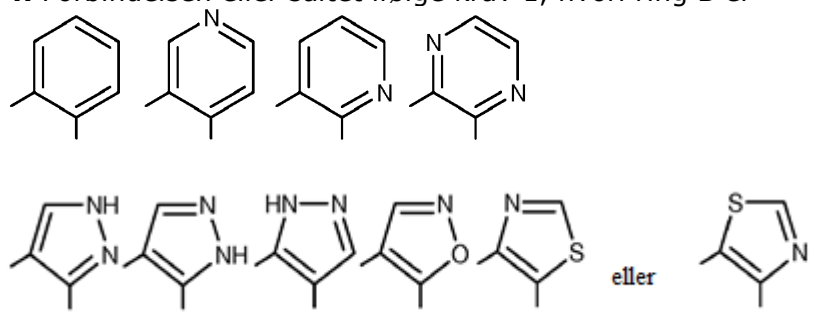
hvori

- 5 ring C^1 er an eventuelt substituert 6-leddet nitrogenholdig aromatisk heterosyklus inneholdende minst ett nitrogenatom; og
 ring C^2 er en eventuelt substituert 5-leddet nitrogenholdig aromatisk heterosyklus inneholdende minst ett nitrogenatom,
 der hvert eventuelt er substituert med 1 til 3 halogenatomer.

3. Forbindelsen eller saltet ifølge krav 1, hvori ring B er benzen, tiazol, isoksazol, pyrazol, pyridin eller pyrazin (X og Y er uavhengig et karbonatom eller et nitrogenatom), der hver, i tillegg til R^3 og $-C(=O)$ -ring A, eventuelt er substituert med 1 til 3 substituenten valgt fra

- 15 (1) et halogenatom,
 (2) en C_{1-6} -alkylgruppe eventuelt substituert med 1 til 3 halogenatomer,
 (3) en C_{1-6} -alkoksygruppe, og
 (4) en C_{1-6} -alkylendioksygruppe.

4. Forbindelsen eller saltet ifølge krav 1, hvori ring B er



der hver i tillegg til R^3 og $-C(=O)$ -ring A, eventuelt er substituert med 1 til 3 substituenten valgt fra

- 25 (1) et halogenatom,
 (2) en C_{1-6} -alkylgruppe eventuelt substituert med 1 til 3 halogenatomer,
 (3) en C_{1-6} -alkoksygruppe, og
 (4) en C_{1-6} -alkylendioksygruppe.

5. Forbindelsen eller saltet ifølge krav 1, hvori R^2 er et hydrogenatom.

6. Forbindelsen eller saltet ifølge krav 1, som er (4-benzyl-4-hydroksypiperidin-1-yl)(2,4'-bipyridin-3-yl)metanon eller et salt derav.

5 **7.** Forbindelsen eller saltet ifølge krav 1, som er 2,4'-bipyridin-3-yl(4-(4-fluorobenzyl)-4-hydroksypiperidin-1-yl)metanon eller et salt derav.

8. Forbindelsen eller saltet ifølge krav 1, som er 2,4'-bipyridin-3-yl(4-(2,4-difluorobenzyl)-4-hydroksypiperidin-1-yl)metanon eller et salt derav.

10

9. Forbindelsen eller saltet ifølge krav 1, som er (4-(4-fluorobenzyl)-4-hydroksypiperidin-1-yl) (2-(pyrimidin-4-yl)pyridin-3-yl)metanon eller et salt derav.

15

10. Medikament omfattende forbindelsen eller saltet ifølge krav 1.

11. Medikamentet ifølge krav 10, for anvendelse i profylakse eller behandling av neurodegenerativ sykdom.

20

12. Medikamentet for anvendelse ifølge krav 11, hvori den neurodegenerative sykdommen er Alzheimers sykdom, mild kognitiv svikt, Huntingtons sykdom, Parkinsons sykdom eller multippel sklerose.

25

13. Forbindelsen eller saltet ifølge krav 1 for anvendelse i profylakse eller behandling av neurodegenerativ sykdom.

14. Forbindelsen eller saltet for anvendelse ifølge krav 13, hvori den neurodegenerative sykdommen er Alzheimers sykdom, mild kognitiv svikt, Huntingtons sykdom, Parkinsons sykdom eller multippel sklerose.

30

15. Kombinasjon omfattende

(1) en forbindelse valgt fra (4-benzyl-4-hydroksypiperidin-1-yl) (2,4'-bipyridin-3-yl)metanon, 2,4'-bipyridin-3-yl(4-(4-fluorobenzyl)-4-hydroksypiperidin-1-yl)metanon, 2,4'-bipyridin-3-yl(4-(2,4-difluorobenzyl)-4-hydroksypiperidin-1-yl)metanon, (4-(4-fluorobenzyl)-4-hydroksypiperidin-1-yl) (2-(pyrimidin-4-yl)pyridin-3-yl)metanon og et salt derav og

35

(2) et samtidig legemiddel.