



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2776028 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/44 (2006.01)
A61P 9/12 (2006.01)
A61P 19/00 (2006.01)
A61P 19/06 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2019.03.11
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.10.17
(86)	European Application Nr.	12784855.4
(86)	European Filing Date	2012.11.02
(87)	The European Application's Publication Date	2014.09.17
(30)	Priority	2011.11.03, US, 201161555450 P 2012.03.27, US, 201261616363 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	Ardea Biosciences, Inc., 4939 Directors Place, San Diego, CA 92121, USA
(72)	Inventor	YEH, Li-tain, 6 Dos Rios, Irvine, CA 92602, USA QUART, Barry, D., 3273 Violet Ridge, Encinitas, CA 92024, USA
(74)	Agent or Attorney	TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

(54)	Title	3,4-DI-SUBSTITUTED PYRIDINE COMPOUND, METHODS OF USING AND COMPOSITIONS COMPRISING THE SAME
(56)	References Cited:	WO-A2-01/91796, WO-A1-2011/159732, WO-A2-2011/159839, WO-A2-2011/126852

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 for anvendelse for å redusere serum-urinsyrenivåer hos et menneske som skal behandles profylaktisk eller terapeutisk av en hvilken som helst sykdom eller lidelse
5 hvor avvikende nivåer av urinsyre spiller en rolle, hvori forbindelsen er 2-((3-(4-cyanonaftalen-1-yl)pyridin-4-yl)tio)-2-metylpropansyre, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav; og hvori mindre enn 50 mg per dag av 2-((3-(4-cyanonaftalen-1-yl)pyridin-4-yl)tio)-2-metylpropansyre, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, administreres til mennesket, og hvori sykdommen eller lidelsen er hyperurikemi, gikt, giktartitt,
10 inflammatorisk artritt, nyresykdom, nefrolitiasis, leddbetennelse, avsetning av uratkrystaller i leddene, urolitiasis, avsetning av uratkrystaller i nyreparenkym, Lesch-Nyhan syndrom, Kelley-Seegmiller syndrom, oppblussing av gikt, tophigikt, nyresvikt, et gjentatt giktangrep, hypertensjon, en kardiovaskulær sykdom, koronar hjertesykdom, nyrestein, leddgikt, blyforgiftning, hyperparatyroidisme, psoriasis, sarkoidose,
15 hypoksantin-guaninfosforibosyltransferasemangel (HPRT-mangel) eller en kombinasjon derav.

2. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 1, hvori sykdommen eller lidelsen er hyperurikemi, gikt, giktartitt, inflammatorisk artritt, nyresykdom, nefrolitiasis,
20 leddbetennelse, avsetning av uratkrystaller i ledd, urolitiasis, avsetning av uratkrystaller i nyreparenkym, Lesch-Nyhan syndrom, Kelley-Seegmiller syndrom, oppblussing av gikt, tophigikt, nyresvikt eller en kombinasjon derav.

3. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 1 eller 2, hvori ca. 20 mg, ca. 10 mg eller
25 ca. 5 mg per dag av 2-((3-(4-cyanonaftalen-1-yl)pyridin-4-yl)tio)-2-metylpropansyre, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, administreres til mennesket.

4. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 1 eller 2, hvori mindre enn ca. 20 mg per dag av 2-((3-(4-cyanonaftalen-1-yl)pyridin-4-yl)tio)-2-metylpropansyre, eller et farmasøytisk
30 akseptabelt salt derav, administreres til mennesket.

5. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 1 eller 2, hvori mindre enn ca. 10 mg per dag av 2-((3-(4-cyanonaftalen-1-yl)pyridin-4-yl)tio)-2-metylpropansyre, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, administreres til mennesket.

35 6. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 1 eller 2, hvori mindre enn ca. 5 mg per dag av 2-((3-(4-cyanonaftalen-1-yl)pyridin-4-yl)tio)-2-metylpropansyre administreres til mennesket.

7. Forbindelsen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori 24 timer etter administrering av 2-((3-(4-cyanonaftalen-1-yl)pyridin-4-yl)tio)-2-metylpropansyre eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, reduseres serum-urinsyrenivåene med minst 1 mg/dl.

8. Forbindelsen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-6, hvori 24 timer etter administrering av 2-((3-(4-cyanonaftalen-1-yl)pyridin-4-yl)tio)-2-metylpropansyre eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, reduseres serum-urinsyrenivåene med minst 20 % fra baseline.

9. Forbindelsen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori forbindelsen er for anvendelse ved behandling eller forebygging av en tilstand **karakterisert av** unormale vev- eller organnivåer av urinsyre.

10. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 9, hvori tilstanden er gikt, et gjentatt giktangrep, giktartitt, hyperurikemi, hypertensjon, en kardiovaskulær sykdom, koronar hjertesykdom, Lesch-Nyhan syndrom, Kelley-Seegmiller syndrom, nyresykdom, nyresteiner, nyresvikt, leddbetennelse, leddgikt, urolitiasis, blyforgiftning, hyperparatyroidisme, psoriasis, sarkoidose, hypoksantin-guaninfosforibosyltransferasesvikt (HPRT-svikt) eller en kombinasjon derav.

11. Forbindelsen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori et andre middel effektivt for behandling av gikt administreres til mennesket.

12. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 11, hvori det andre midlet er en URAT 1-inhibitor, en xantinoksidaseinhibitor, en xantindehydrogenase, en xantinoksidoreduktaseinhibitor eller kombinasjoner derav.

13. Forbindelsen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori forbindelsen er 2-((3-(4-cyanonaftalen-1-yl) pyridin-4-yl)tio)-2-metylpropansyre.

14. Farmasøytisk sammensetning som omfatter mindre enn 50 mg av 2-((3-(4-cyanonaftalen-1-yl)pyridin-4-yl)tio)-2-metylpropansyre eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

15. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 14, som omfatter ca. 20 mg,

ca. 10 mg eller ca. 5 mg av 2-((3-(4-cyanonafalen-1-yl)pyridin-4-yl)tio)-2-metylpropansyre, eller et farmasøytisk akseptabelt salt.

5 **16.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 14, som omfatter mindre enn 20 mg av 2-((3-(4-cyanonafalen-1-yl)pyridin-4-yl)tio)-2-metylpropansyre eller et farmasøytisk akseptabelt salt.

10 **17.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 14, som omfatter mindre enn 10 mg av 2-((3-(4-cyanonafalen-1-yl)pyridin-4-yl)tio)-2-metylpropansyre eller et farmasøytisk akseptabelt salt.

15 **18.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 14, som omfatter mindre enn 5 mg av 2-((3-(4-cyanonafalen-1-yl)pyridin-4-yl)tio)-2-metylpropansyre eller et farmasøytisk akseptabelt salt.

19 **19.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 14, som omfatter mindre enn 50 mg, mindre enn 20 mg eller mindre enn 5 mg av 2-((3-(4-cyanonafalen-1-yl)pyridin-4-yl)tio)-2-metylpropansyre.

20 **20.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 14, som omfatter ca. 20 mg, ca. 10 mg eller ca. 5 mg av 2-((3-(4-cyanonafalen-1-yl)pyridin-4-yl)tio)-2-metylpropansyre.

25 **21.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 14-20 i form av en kapsel eller en tablett.