



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2966058 B1

NORWAY

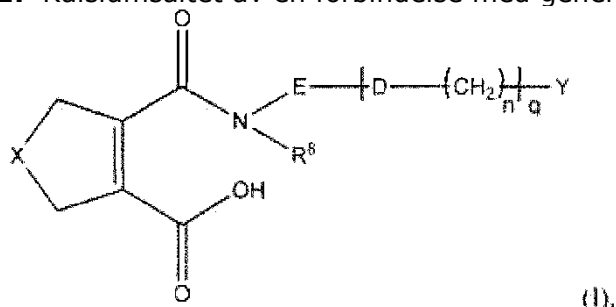
(19) NO
(51) Int Cl.
C07C 233/58 (2006.01)
A61K 31/167 (2006.01)
C07C 233/59 (2006.01)
C07C 233/60 (2006.01)
C07D 307/30 (2006.01)
C07D 333/38 (2006.01)
C07D 333/58 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2018.02.26
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2017.10.04
(86)	European Application Nr.	15183290.4
(86)	European Filing Date	2011.07.01
(87)	The European Application's Publication Date	2016.01.13
(30)	Priority	2010.07.01, US, 360670 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	4SC AG, Am Klopferspitz 19 a, 82152 Planegg - Martinsried, DE-Tyskland
(72)	Inventor	Ammendola, Aldo, Max-Bruch-Str. 4c, 82166 Gräfelfing, DE-Tyskland Diederichs, Julia, Ehrengutstr. 14, 80469 München, DE-Tyskland Leban, Johann, Pyrkergrasse 31 Apartment 10, 1190 Wien, AT-Østerrike Vitt, Daniel, Obere Bahnhofstr. 7a, 82110 Germering, DE-Tyskland
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 2003 Víka, 0125 OSLO, Norge

(54)	Title	NOVEL CALCIUM SALTS OF COMPOUND AS ANTI-INFLAMMATORY, IMMUNOMODULATORY AND ANTI-PROLIFERATORY AGENTS
(56)	References Cited:	US-A1- 2003 203 951

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.** Kalsiumsaltet av en forbindelse med generell formel (I)

5 hvori

X er valgt fra gruppen bestående av CH₂, S eller O;

D er O eller S;

R⁸ er hydrogen eller alkyl;

E er en fenylengruppe som eventuelt er substituert;

10 Y er et monosyklisk eller bisyklisk substituert eller usubstituert 6-9-leddet ringsystem som kan inneholde ett eller flere heteroatomer valgt fra N eller S, og som inneholder minst én aromatisk ring;

n er 0 eller 1; og

q er 0 eller 1;

15 under forutsetning av at kalsiumsaltene av forbindelser hvor X = CH₂, q = 0, Y = usubstituert fenyl og E = usubstituert fenylen, er utelukket, eller et hydrat derav.

20 **2.** Kalsiumsaltet eller hydratet derav ifølge krav 1, hvori R⁸ er hydrogen eller metyl.

3. Kalsiumsaltet eller hydratet derav ifølge krav 1 eller 2, hvori Y er substituert eller usubstituert fenyl.

25 **4.** Kalsiumsaltet eller hydratet derav ifølge hvilke som helst av kravene 1 til 3, hvori q er 0.

30 **5.** Kalsiumsaltet eller hydratet derav ifølge hvilke som helst av kravene 1 til 4, hvori E er en usubstituert fenylengruppe eller en fenylengruppe som er substituert med én eller flere grupper uavhengig valgt fra halogen, nitro eller alkoksy.

6. Kalsiumsaltet eller hydratet derav ifølge hvilke som helst av kravene 1 til 5, hvori Y er en usubstituert fenylgruppe eller en fenylgruppe som er substituert med én eller flere grupper uavhengig valgt fra halogen, alkyl, alkoksy, haloalkoksy, haloalkyl eller CN.

5

7. Kalsiumsaltet eller hydratet derav ifølge hvilke som helst av kravene 1 til 5, hvori E er en fenylgruppe som er substituert med én eller flere grupper uavhengig valgt fra metoksy eller trifluormetoksy, enda mer foretrukket metoksy.

10

8. Kalsiumsaltet eller hydratet derav ifølge hvilke som helst av kravene 1 til 7, hvori forbindelsen med formel (I) er 2-(3-fluor-3'-metoksy-bifenyl-4-ylkarbamoyl)-syklopent-1-enkarboksylsyre.

15

9. Farmasøytisk sammensetning omfattende et salt eller hydrat derav ifølge hvilke som helst av kravene 1 til 8, sammen med farmasøytisk akseptable tynnere eller bærere.

20

10. Kalsiumsalt eller hydrat derav ifølge hvilke som helst av kravene 1 til 8 for anvendelse som legemiddel.

25

11. Anvendelsen av et kalsiumsalt eller hydrat derav ifølge hvilke som helst av kravene 1 til 8 i fremstillingen av et legemiddel for anvendelse i behandling av en sykdom eller en terapeutisk indikasjon valgt fra gruppen omfattende revmatisme, akutte immunologiske lidelser, autoimmune sykdommer, sykdommer forårsaket av malign celleproliferasjon, inflammatoriske sykdommer, sykdommer som er forårsaket av infestasjoner med protozoer hos mennesker og dyr, sykdommer som er forårsaket av virusinfeksjoner og *Pneumocystis carinii*, fibrose, uveitt, rinitt, astma eller atropati.

30

12. Anvendelsen ifølge krav 11, hvori sykdommen eller en terapeutisk indikasjon er valgt fra gruppen omfattende transplantat-mot-vert- og vert-mot-transplantat-reaksjoner, revmatoid artritt, multippel sklerose, lupus erythematosus, inflammatorisk tarmsykdom og psoriasis.

35

13. Fremgangsmåte for fremstillingen av kalsiumsalt eller hydrat derav ifølge hvilke som helst av kravene 1 til 8, som omfatter trinnene

- a) å tilsette en suspensjon av kalsiumhydroksid i et organisk løsemiddel til en løsning av den frie syren av en forbindelse med formel (I) ifølge hvilke som helst av kravene 1 til 8 ovenfor,
- b) å røre suspensjonen oppnådd i trinn a),
- 5 c) minst delvis å fordampe det organiske løsemidlet for å oppnå en suspensjon av kalsiumsaltet av forbindelsen med formel (I),
- d) å hente ut kalsiumsaltet av forbindelsen med formel (I) fra blandingen oppnådd i trinn c), og
- 10 e) å vaske kalsiumsaltet av forbindelsen med formel (I) oppnådd i trinn d), med det organiske løsemidlet.