



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2970101 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07C 219/08 (2006.01)
A61K 31/221 (2006.01)
C07C 229/12 (2006.01)
C07C 229/16 (2006.01)
C07C 309/18 (2006.01)

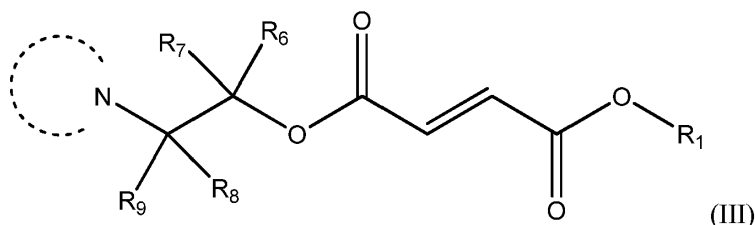
Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2018.10.15
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.06.06
(86)	European Application Nr.	14767892.4
(86)	European Filing Date	2014.03.14
(87)	The European Application's Publication Date	2016.01.20
(30)	Priority	2013.03.14, US, 201361782445 P 2014.01.31, US, 201461934365 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	Alkermes Pharma Ireland Limited, Connaught House 1 Burlington Road, Dublin 4, IE-Ireland
(72)	Inventor	ZEIDAN, Tarek, A., 296 Lexington Street, Watertown, MA 02472, US-USA DUNCAN, Scott, 4 Wayte Road, Bedford, MA 01730, US-USA HENCKEN, Christopher, P., 36 Dwinell Street, Boston, MA 02132, US-USA WYNN, Thomas, Andrew, 94 North Street, Lexington, MA 02420, US-USA SANRAME, Carlos, N., 9 Rumford Road, Lexington, MA 02420, US-USA
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge
(54)	Title	PRODRUGS OF FUMARATES AND THEIR USE IN TREATING VARIOUS DISEASES
(56)	References Cited:	WO-A1-2011/085211, WO-A1-2013/181451, WO-A1-2013/119791, WO-A2-2010/022177

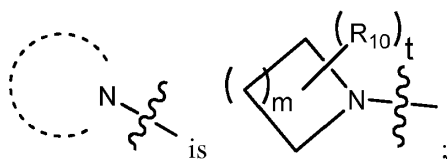
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters 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 med formel (III), eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav:



5 hvor:



R_1 er usubstituert C_1 - C_6 alkyl;

R_6 , R_7 , R_8 og R_9 er hver, uavhengig, H, substituert eller usubstituert C_1 - C_6 alkyl,

10 substituert eller usubstituert C_2 - C_6 alkenyl, substituert eller usubstituert C_2 - C_6 alkynyl eller $C(O)OR_a$;

R_a er H eller substituert eller usubstituert C_1 - C_6 alkyl;

m er 0, 1, 2 eller 3;

t er 0, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 eller 10; og

15 hver R_{10} er, uavhengig, H, halogen, substituert eller usubstituert C_1 - C_6 alkyl, substituert eller usubstituert C_2 - C_6 alkenyl, substituert eller usubstituert C_2 - C_6 alkynyl, substituert eller usubstituert C_3 - C_{10} karbocykel, substituert eller usubstituert heterocykel omfattende en eller to 5- eller 6-leddete ringer og 1-4 heteroatomer valgt fra N, O og S eller substituert eller usubstituert heteroaryl omfattende en eller to 5- eller 6-leddete ringer og 1-4 heteroatomer valgt fra N, O og S;

20 eller, alternativt, to R_{10} koblet til samme karbonatom, sammen med karbonatomet hvortil de er koblet, danner en karbonyl, substituert eller usubstituert C_3 - C_{10} karbocykel, substituert eller usubstituert heterocykel omfattende en eller to 5- eller 6-leddete ringer og 1-4 heteroatomer valgt fra N, O og S, eller substituert eller usubstituert heteroaryl omfattende en eller to 5- eller 6-leddete ringer og 1-4 heteroatomer valgt fra N, O og S;

25 eller alternativt to R_{10} koblet til forskjellige atomer, sammen med atomene hvortil de er koblet, danner en substituert eller usubstituert C_3 - C_{10} karbocykel, substituert eller usubstituert heterocykel omfattende en eller to 5- eller 6-leddringer og 1-4 heteroatomer valgt fra N, O og S eller substituert eller usubstituert heteroaryl

30

omfattende en eller to 5- eller 6-leddete ringer og 1-4 heteroatomer valgt fra N, O og S.

2. Forbindelse ifølge krav 1, idet R₁ er metyl.

5

3. Forbindelse ifølge krav 1 eller 2, idet R₆, R₇, R₈ og R₉ er hver H.

4. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, idet m er 2 eller 3.

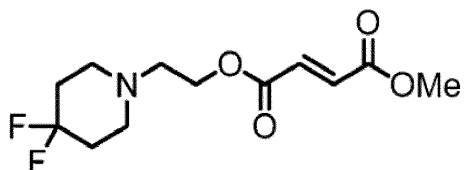
10

5. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvor t er 0, 1, 2, 3 eller 4.

6. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, idet to R₁₀ koblet til samme karbonatom, sammen med karbonatomet hvortil de er koblet, danner en karbonyl.

15

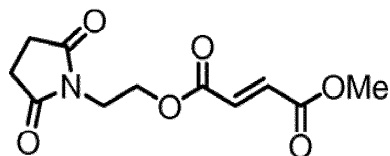
7. Forbindelse ifølge krav 1, idet forbindelsen er:



20

eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

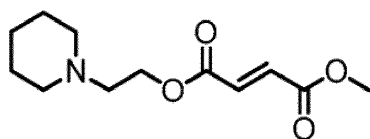
8. Forbindelse ifølge krav 1, idet forbindelsen er:



25

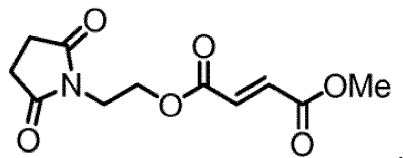
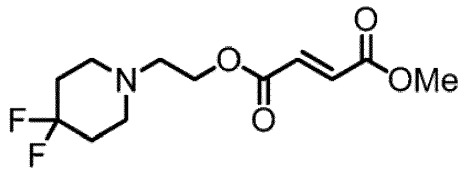
eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

9. Forbindelse ifølge krav 1, idet forbindelsen er:

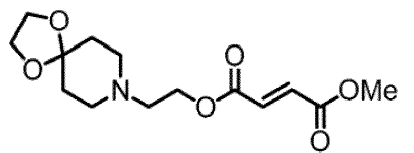
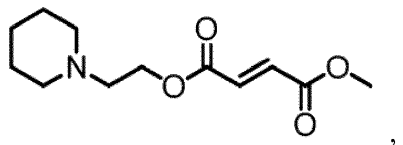


eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

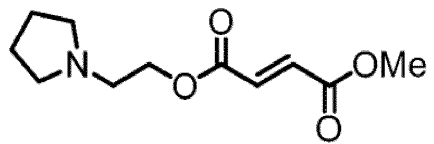
10. Forbindelse ifølge krav 1, idet forbindelsen er valgt fra gruppen bestående av:



5



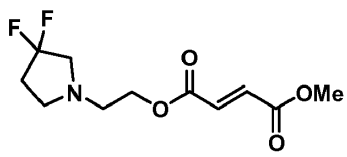
og



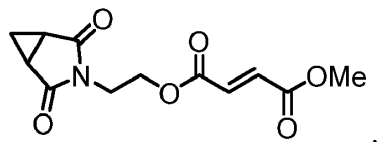
10

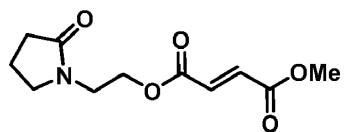
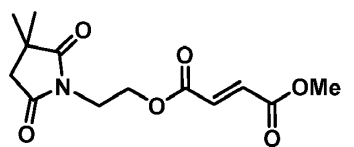
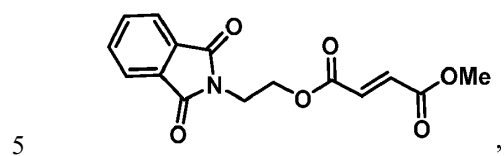
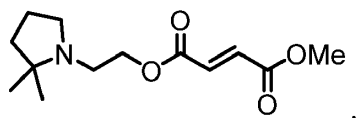
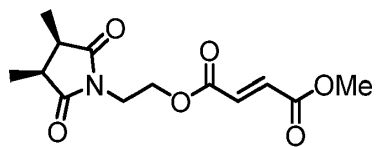
eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

11. Forbindelse ifølge krav 1, idet forbindelsen er valgt fra gruppen bestående av:

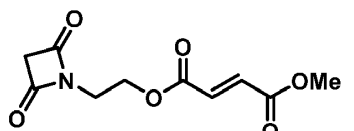
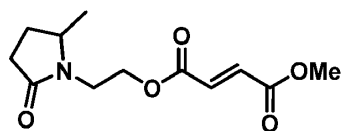
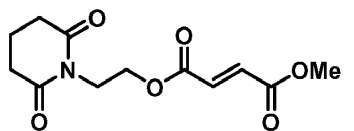


15

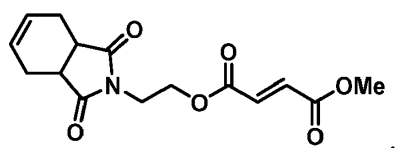




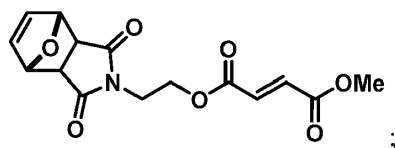
10



15



og



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

- 5 12. Farmasøytisk sammensetning omfattende:
(i) en forbindelse med formel (III), eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, ifølge et hvilket som helst av kravene 1-11; og
(ii) en farmasøytisk akseptabel bærer.

10

13. Forbindelse med formel (III), et farmasøytisk akseptabelt salt derav, ifølge et hvilket som helst av kravene 1-11, eller en sammensetning ifølge krav 12, for anvendelse for behandling av en neurologisk sykdom.

15

14. Forbindelse eller sammensetning for anvendelse ifølge krav 13, idet den neurologiske sykdommen er multippel sklerose.

20

15. Forbindelse eller sammensetning for anvendelse ifølge krav 13, idet den neurologiske sykdommen er valgt fra tilbakevendende-reduserende multippel sklerose, sekundær progressiv multippel sklerose, primær progressiv multippel sklerose eller progressiv tilbakevendende multippel sklerose.