



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 2970236 B1

NORWAY

(19) NO  
(51) Int Cl.  
**C07D 413/04 (2006.01)**  
**A61K 31/4433 (2006.01)**  
**A61P 37/00 (2006.01)**

**Norwegian Industrial Property Office**

---

(21)	Translation Published	2018.02.05
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2017.08.30
(86)	European Application Nr.	14715427.2
(86)	European Filing Date	2014.03.14
(87)	The European Application's Publication Date	2016.01.20
(30)	Priority	2013.03.15, EP, 13159482
(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
(73)	Proprietor	Idorsia Pharmaceuticals Ltd, Hegenheimermattweg 91, 4123 Allschwil, CH-Sveits
(72)	Inventor	BOLLI, Martin, c/o Actelion Pharmaceuticals Ltd Gewerbstrasse 16, CH-4123 Allschwil, CH-Sveits LESCOP, Cyrille, c/o Actelion Pharmaceuticals Ltd Gewerbstrasse 16, CH-4123 Allschwil, CH-Sveits NAYLER, Oliver, c/o Actelion Pharmaceuticals Ltd Gewerbstrasse 16, CH-4123 Allschwil, CH-Sveits STEINER, Beat, c/o Actelion Pharmaceuticals Ltd Gewerbstrasse 16, CH-4123 Allschwil, CH-Sveits
(74)	Agent or Attorney	Plougmann Vingtoft, Postboks 1003 Sentrum, 0104 OSLO, Norge

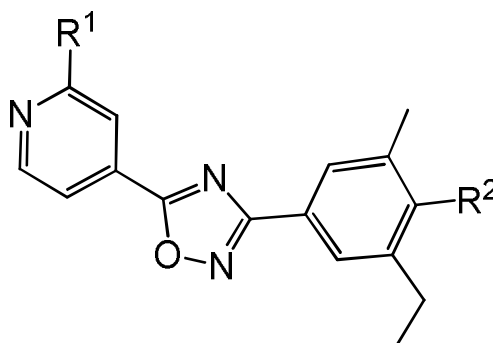
---

(54)	Title	<b>PYRIDIN-4-YL DERIVATIVES</b>
(56)	References Cited:	HALE J J ET AL: "Selecting against S1P3 enhances the acute cardiovascular tolerability of 3-(N-benzyl)aminopropylphosphonic acid S1P receptor agonists", BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS, PERGAMON, AMSTERDAM, NL, vol. 14, no. 13, 5 July 2004 (2004-07-05), pages 3501-3505, XP002718181, ISSN: 0960-894X, DOI: 10.1016/J.BMCL.2004.04.070 cited in the application, WO-A1-2008/029371

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 (I),



5

Formel (I)

hvor

10 **R<sup>1</sup>** representerer C<sub>2-5</sub>-alkyl eller syklopentyl; og

**R<sup>2</sup>** representerer -OCH<sub>2</sub>-CH(OH)-CH<sub>2</sub>-NHCO-CH<sub>2</sub>OH;

eller et salt derav.

15

2. Forbindelse ifølge krav 1, hvor **R<sup>1</sup>** representerer etyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, isopentyl, pent-3-yl, eller syklopentyl, eller et salt derav.

3. Forbindelse ifølge krav 1, hvor **R<sup>1</sup>** representerer n-propyl, isopropyl, isobutyl, eller  
20 syklopentyl, eller et salt derav.

4. Forbindelse ifølge krav 1, hvor **R<sup>1</sup>** representerer syklopentyl, eller et salt derav.

5. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, hvor stereosenteret av **R<sup>2</sup>**-  
25 gruppen -OCH<sub>2</sub>-CH(OH)-CH<sub>2</sub>-NH-CO-CH<sub>2</sub>OH er i S-konfigurasjonen, eller et salt derav.

6. Forbindelse ifølge krav 1, valgt fra gruppen som består av:

(S)-N-(3-(2-etyl-4-(5-(2-etylpyridin-4-yl)-1,2,4-oksadiazol-3-yl)-6-metyl-fenoksy)-2-hydroksypropyl)-2-hydroksyacetamid;

- (S)-N-(3-(2-etyl-4-(5-(2-propylpyridin-4-yl)-1,2,4-oksadiazol-3-yl)-6-metyl-fenoksy)-2-hydroksypropyl)-2-hydroksyacetamid;
- (S)-N-(3-(2-etyl-4-(5-(2-isopropylpyridin-4-yl)-1,2,4-oksadiazol-3-yl)-6-metyl-fenoksy)-2-hydroksypropyl)-2-hydroksyacetamid;
- 5 (S)-N-(3-(2-etyl-4-(5-(2-butylpyridin-4-yl)-1,2,4-oksadiazol-3-yl)-6-metyl-fenoksy)-2-hydroksypropyl)-2-hydroksyacetamid;
- (S)-N-(3-(2-etyl-4-(5-(2-isobutylpyridin-4-yl)-1,2,4-oksadiazol-3-yl)-6-metyl-fenoksy)-2-hydroksypropyl)-2-hydroksyacetamid;
- (S)-N-(3-(2-etyl-4-(5-(2-isopentylpyridin-4-yl)-1,2,4-oksadiazol-3-yl)-6-metyl-fenoksy)-2-  
10 hydroksypropyl)-2-hydroksyacetamid;
- (S)-N-(3-(2-etyl-4-(5-(2-(pentan-3-yl)-pyridin-4-yl)-1,2,4-oksadiazol-3-yl)-6-metyl-fenoksy)-2-hydroksypropyl)-2-hydroksyacetamid; og
- (S)-N-(3-(2-etyl-4-(5-(2-syklopentylpyridin-4-yl)-1,2,4-oksadiazol-3-yl)-6-metyl-fenoksy)-2-hydroksypropyl)-2-hydroksyacetamid;
- 15 eller et salt av slike forbindelser.
7. Forbindelse ifølge krav 1 som er (S)-N-(3-(2-etyl-4-(5-(2-syklopentylpyridin-4-yl)-1,2,4-oksadiazol-3-yl)-6-metyl-fenoksy)-2-hydroksypropyl)-2-hydroksyacetamid eller et salt derav.
- 20 8. Forbindelse ifølge krav 1 som er (S)-N-(3-(2-etyl-4-(5-(2-etylpyridin-4-yl)-1,2,4-oksadiazol-3-yl)-6-metyl-fenoksy)-2-hydroksypropyl)-2-hydroksyacetamid eller et salt derav.
9. Farmasøytisk sammensetning som omfatter en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og en farmasøytisk akseptabel  
25 bærer.
10. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, eller en farmasøytisk sammensetning ifølge krav 9, til bruk som legemiddel.
- 30 11. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, til bruk i forebygging eller behandling av sykdommer eller lidelser assosiert med et aktivert immunsystem.
12. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8, eller et farmasøytisk akseptabelt  
35 salt derav, til bruk i forebygging eller behandling av sykdommer eller lidelser, valgt fra gruppen som består av avvisning av transplanterte organer som nyre, lever, hjerte, lunge,

5 bukspyttkjertel, hornhinne og hud; transplantat-mot-vert-sykdommer forårsaket av stamcelletransplantasjon; autoimmune syndromer inkludert revmatoid artritt, multippel sklerose, inflammatoriske tarmsykdommer som Crohns sykdom og ulcerøs kolitt, psoriasis, psoriasisartritt, tyreoiditt som Hashimotos tyreoiditt, og uveoretinitt; atopiske sykdommer som rhinitt, konjunktivitt og atopisk dermatitt; astma; type 1-diabetes; postinfeksiøse autoimmune sykdommer inkludert revmatisk feber og postinfeksiøs glomerulonefritt; og solid cancer og tumormetastase.

10 13. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, til bruk i forebygging eller behandling av sykdommer eller lidelser, valgt fra gruppen som består av avvisning av transplanterte organer valgt blant nyre, lever, hjerte og lunge; transplantat-mot-vert-sykdommer forårsaket av stamcelletransplantasjon; autoimmune syndromer valgt blant revmatoid artritt, multippel sklerose, psoriasis, psoriasisartritt, Crohns sykdom og Hashimotos tyreoiditt; og atopisk dermatitt.

15