



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2975025 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 213/70 (2006.01)
A61K 31/44 (2006.01)
A61K 31/444 (2006.01)
A61K 31/4965 (2006.01)
A61P 9/00 (2006.01)
A61P 9/12 (2006.01)
A61P 19/06 (2006.01)
C07D 239/38 (2006.01)
C07D 241/18 (2006.01)
C07D 401/04 (2006.01)
C07D 403/04 (2006.01)
C07D 405/04 (2006.01)
C07D 417/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2018.08.20
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.04.04
(86)	European Application Nr.	15166826.6
(86)	European Filing Date	2011.06.15
(87)	The European Application's Publication Date	2016.01.20
(30)	Priority	2010.06.16, US, 355491 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
(62)	Divided application	EP2712861, filing date 2011.06.15
(73)	Proprietor	Ardea Biosciences, Inc., 9390 Towne Centre Drive, San Diego CA 92121, US-USA
(72)	Inventor	Ouk, Samedy, 13987 Amber Pl., San Diego, CA California 92130, US-USA Gunic, Esmir, 8952 Capcano Road, San Diego, CA California 92129, US-USA Vernier, Jean-Michel, 5150 Sea Mist, San Diego, CA California 92121, US-USA
(74)	Agent or Attorney	Nordic Patent Service A/S, Bredgade 30, DK-1260 KØBENHAVN K, Danmark

(54) Title **THIOACETATE COMPOUNDS, COMPOSITIONS AND METHODS OF USE**

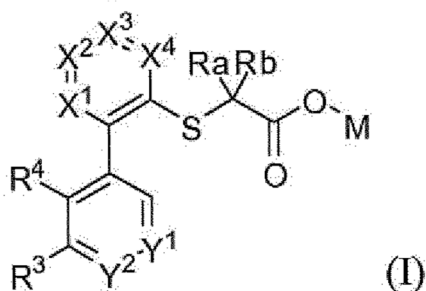
(56) References

Cited: GB-A- 1 046 258, WO-A2-2011/159840, US-A1- 2010 056 464, DEWAR P S ET AL: "Persulphate Oxidations. Part VIII", JOURNAL OF THE CHEMICAL SOCIETY, PERKIN TRANSACTIONS 1, ROYAL SOCIETY OF CHEMISTRY, GB, vol. 22, 1972, pages 2857-2861, XP009169729, ISSN: 0300-922X, NUAL M. CARRO ET AL: "Benzylation and Benzoylation of Methyl Phenacyl Sulfone", JOURNAL OF ORGANIC CHEMISTRY, vol. 30, 1965, pages 2830-2832, XP055070484,, US-A1- 2007 099 970

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):

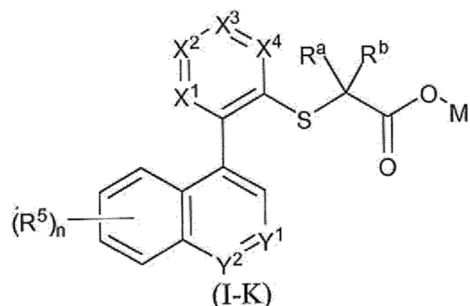


hvor:

- 5 R^a og R^b er valgt fra H, halogen, C_1 - til C_6 -alkyl; eller R^a og R^b , sammen med karbonatomet som de festes til, danner en 3-, 4-, 5- eller 6-leddet ring, som eventuelt inneholder ett eller to heteroatomer valgt fra O, N og S;
- M er H, C_{1-3} -alkyl eller et farmasøytisk akseptabelt kation;
- X^1 er N, CH, C(halogen) eller C(C_1 - C_4 -alkyl);
- 10 X^2 er N eller CH;
- X^3 er N, CH, C(halogen) eller C(C_1 - C_4 -alkyl);
- X^4 er N eller CH; hvori én av X^1 , X^2 , X^3 eller X^4 er N;
- Y^1 er N eller CR^1 ;
- Y^2 er N eller CR^2 ;
- 15 R^1 er H, CF_3 , CH_3 , OCH_3 , F eller Cl;
- R^2 er H, metyl, etyl, propyl, isopropyl, tert-butyl, syklopropyl, syklobutyl, CF_3 , OH, OCH_3 , etoksy, SH, SCH_3 , SCH_2CH_3 , CH_2OH , $C(CH_3)_2OH$, Cl, F, CN, $COOH$, $COOR^{2'}$, $CONH_2$, $CONHR^{2'}$ eller SO_2NH_2 ; hvori $R^{2'}$ er H eller C_{1-3} -alkyl;
- R^3 er H, halogen, -CN, C_1 - til C_6 -alkyl, C_1 - til C_6 -alkoksy; og
- 20 R^4 er H, halogen, -CN, C_1 - til C_6 -alkyl, C_1 - til C_6 -alkoksy; eller
- R^3 og R^4 sammen med karbonatomene som de er festet til danner en eventuelt substituert 5- eller 6-leddet ring, eventuelt inneholder ett eller to heteroatomer valgt fra O, N og S, hvori den 5- eller 6-leddede ringen er en mettet, umettet eller en aromatisk ring;
- gitt at forbindelsen med formel (I) ikke er 1-(3-(4-cyanofenyl)pyridin-4-yltio)syklopropankarboksylsyre.
- 25 2. Forbindelse ifølge krav 1, hvori
- R^3 er H, CH_3 , OCH_3 , CF_3 , F eller Cl; og
- R^4 er H, CH_3 , OCH_3 , CF_3 , F eller Cl.

3. Forbindelse ifølge krav 1, hvori R^3 og R^4 sammen med karbonatomene som de er festet til danner en eventuelt substituert 5- eller 6-leddet ring, som eventuelt inneholder ett eller to heteroatomer valgt fra O, N og S, hvori den 5- eller 6-leddede ringen kan være en mettet, en umettet eller en aromatisk ring.

5 4. Forbindelse ifølge krav 3, med formel (I-K):+



hvor n er 1, 2, 3 eller 4; og

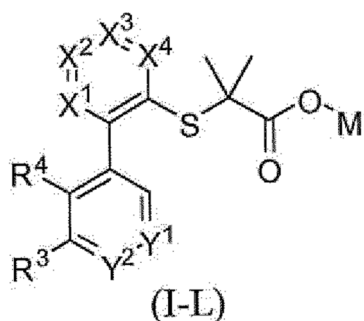
hver R^5 er uavhengig valgt fra H, metyl, etyl, propyl, isopropyl, tert-butyl, syklopropyl, syklobutyl, CF_3 , OH, OCH_3 , etoksy, SH, SCH_3 , SCH_2CH_3 , CH_2OH , $C(CH_3)_2OH$, Cl, F, CN, $COOH$, $COOR^{5'}$, $CONH_2$, $CONHR^{5'}$ eller SO_2NH_2 ; hvori $R^{5'}$ er H eller C_{1-3} -alkyl.

10

5. Forbindelse ifølge krav 1, hvori R^a er H eller CH_3 ; og

R^b er H eller CH_3 .

6. Forbindelse ifølge krav 5, med formel (I-L):



15

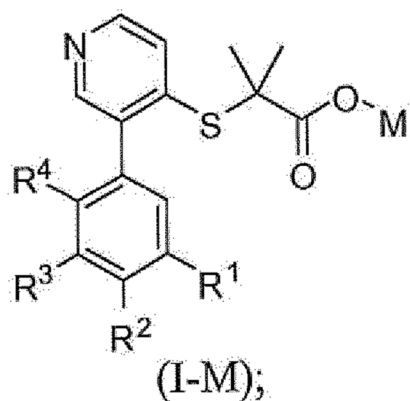
hvor X^1 er CH;

X^2 er N;

X^3 er CH; og

X^4 er CH; og eventuelt hvori Y^1 er CR^1 og Y^2 er CR^2 .

7. Forbindelse ifølge krav 6, med formel (I-M):



og eventuelt hvori R^1 , R^3 og R^4 alle er H.

8. Forbindelse ifølge krav 1, hvori R^a og R^b sammen med karbonatomet som de festes til, danner en 3-, 4-, 5- eller 6-leddet ring, som eventuelt inneholder ett eller to heteroatomer valgt fra O, N og S.

9. Forbindelse ifølge krav 1, hvori M er H.

10. Forbindelse med formel (I) ifølge ett av kravene 1 til 9 for anvendelse i å redusere serumurinsyrenivåer hos et menneske, behandle hyperurikemi hos et menneske med gikt, behandle hyperurikemi hos et menneske, behandle gikt hos et menneske, behandle eller forebygge en tilstand karakterisert av unormale nivåer i vev eller organer av urinsyre hos et individ, og eventuelt hvori forbindelsen anvendes i kombinasjon med et andre middel som er effektivt for behandling av gikt.

11. Forbindelsen med formel (I) som definert i kravene 1-9 for anvendelse ifølge krav 10, 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-guaninfosforibosyltransferasemangel (HPRT-mangel) mangel eller en kombinasjon derav.

12. Forbindelsen med formel (I) som definert i kravene 1-9 for anvendelse ifølge krav 10, hvori det andre midlet er en URAT-1-hemmer, en xantinoksidasehemmer, en xantindehydrogenase, en xantinoksidoreduktasehemmer eller kombinasjoner derav; eller hvori det andre midlet er allopurinol, febuxostat, FYX-051, eller kombinasjoner derav.