



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3021838 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/27 (2006.01)
A61P 3/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2020.10.26
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.05.27
(86)	European Application Nr.	14825724.9
(86)	European Filing Date	2014.07.18
(87)	The European Application's Publication Date	2016.05.25
(30)	Priority	2013.07.18, US, 201361847593 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
(73)	Proprietor	Jazz Pharmaceuticals Ireland Limited, Waterloo Exchange Waterloo Road, Dublin 4, Ireland SK Biopharmaceuticals Co., LTD, 99 Seorin-dong Jongro-gu Seoul 110-110, South Korea, Sør-Korea
(72)	Inventor	KHAYRALLAH, Moise A., 140 W Franklin Street, Unit 705, Chapel Hill, North Carolina 27516-2588, USA BREAM, Gary, 125 Lantern Ridge Lane, Cary, North Carolina 27519, USA BUTTS, Stephen E., 332 Chrismill Lane, Holly Springs, North Carolina 27540, USA
(74)	Agent or Attorney	OSLO PATENTKONTOR AS, Hoffsvæien 1A, 0275 OSLO, Norge

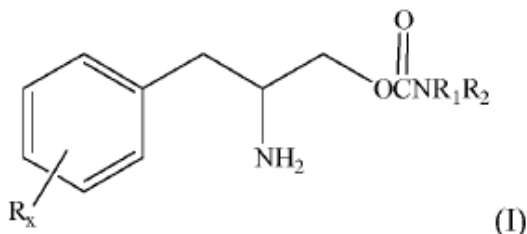
(54) Title **TREATMENT FOR OBESITY**

(56) References
Cited: WO-A1-96/32375
 WO-A1-2009/129181
 WO-A2-2011/005473
 US-A1- 2012 004 300
 EP-A1- 2 543 660
 WO-A1-2006/133393

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 i en fremgangsmåte for å behandle fedme hos et individ som har behov for det, idet nevnte fremgangsmåte omfatter administrasjon til individet av en terapeutisk effektiv mengde av forbindelsen, som er forbindelsen med formel (I):



eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ester derav;

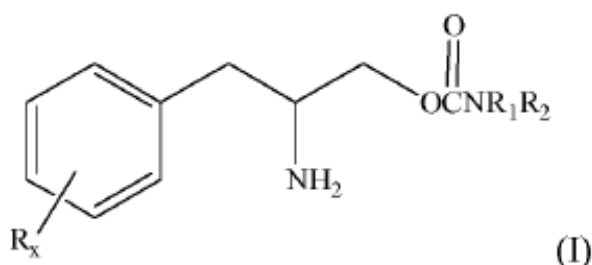
hvor R er et ledd valgt fra gruppen bestående av alkyl med 1 til 8 karbonatomer, halogen, alkoksy med 1 til 3 karbonatomer, nitro, hydroksy, trifluormetyl og tioalkoksy med 1 til 3 karbonatomer;

x er et heltall fra 0 til 3, med forbehold om at R kan være den samme eller forskjellig når x er 2 eller 3;

R₁ og R₂ er uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydrogen, alkyl med 1 til 8 karbonatomer, arylalkyl, cykloalkyl med 3 til 7 karbonatomer; eller

R₁ og R₂ kan forbindes for å danne en 5- til 7-leddet heterocyklus som er usubstituert eller substituert med en eller flere alkyl- eller arylgrupper, hvor heterocyklusen omfatter 1 til 2 nitrogenatomer og 0 til 1 oksygenatom, hvor nitrogenatomer er ikke direkte koblet med hverandre eller med oksygenatomet.

2. Forbindelse for anvendelse i en fremgangsmåte for å redusere kroppsvekt eller kroppsvektøkning eller forhindre kroppsvektøkning hos et individ som har fedme, hvor fremgangsmåten omfatter administrasjon til individet av en terapeutisk effektiv mengde av forbindelsen, som er forbindelsen med formel (I):



eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ester derav;

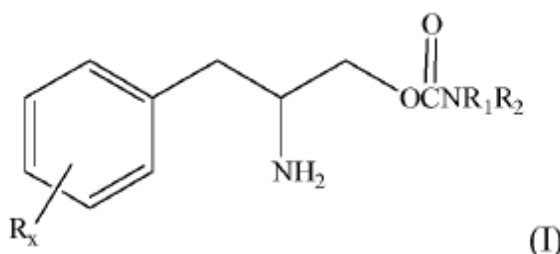
hvor R er et ledd valgt fra gruppen bestående av alkyl med 1 til 8 karbonatomer, halogen, alkoksy med 1 til 3 karbonatomer, nitro, hydroksy, trifluormetyl og tioalkoksy med 1 til 3 karbonatomer;

x er et heltall fra 0 til 3, med forbehold om at R kan være den samme eller forskjellig når x er 2 eller 3;

R₁ og R₂ er uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydrogen, alkyl med 1 til 8 karbonatomer, arylalkyl, cykloalkyl med 3 til 7 karbonatomer; eller

- 5 R₁ og R₂ kan forbindes for å danne en 5- til 7-leddet heterocyklus som er usubstituert eller substituert med en eller flere alkyl- eller arylgrupper, hvor heterocyklusen omfatter 1 til 2 nitrogenatomer og 0 til 1 oksygenatom, hvor nitrogenatomer er ikke direkte koblet med hverandre eller med oksygenatomet.

- 10 3. Forbindelse for anvendelse i en fremgangsmåte for å redusere matinntaket hos et individ som har fedme, idet nevnte fremgangsmåte omfatter administrasjon til individet av en terapeutisk effektiv mengde av forbindelsen, som er forbindelsen med formel (I):



- 15 eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ester derav;
 hvor R er et ledd valgt fra gruppen bestående av alkyl med 1 til 8 karbonatomer, halogen, alkoksy med 1 til 3 karbonatomer, nitro, hydroksy, trifluormetyl og tioalkoksy med 1 til 3 karbonatomer;
 x er et heltall fra 0 til 3, med forbehold om at R kan være den samme eller
 20 forskjellig når x er 2 eller 3;

R₁ og R₂ er uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydrogen, alkyl med 1 til 8 karbonatomer, arylalkyl, cykloalkyl med 3 til 7 karbonatomer; eller

- 25 R₁ og R₂ kan forbindes for å danne en 5- til 7-leddet heterocyklus som er usubstituert eller substituert med en eller flere alkyl- eller arylgrupper, hvor heterocyklusen omfatter 1 til 2 nitrogenatomer og 0 til 1 oksygenatom, hvor nitrogenatomer er ikke direkte koblet med hverandre eller med oksygenatomet.

4. Forbindelse for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-3, hvor x = 0.

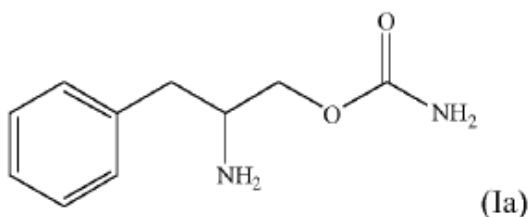
30

5. Forbindelse for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-4, hvor R₁ og R₂ er hydrogen og x = 0.

6. Forbindelse for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-5, hvor forbindelsen med formel I er en enantiomer med formel I som er vesentlig fri for andre enantiomerer eller en enantiomer blanding hvor en enantiomer med formel I dominerer.

5

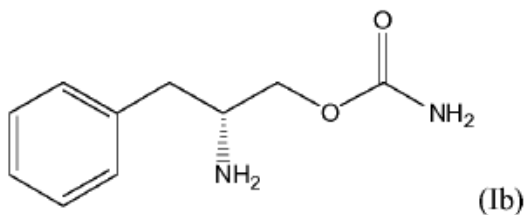
7. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 6, hvor enantiomeren av forbindelsen med formel I er en enantiomer av forbindelsen med formel Ia:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ester derav.

10

8. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 6, hvor enantiomeren med formel I som i det vesentlige er fri for andre enantiomerer er forbindelsen med formel Ib eller en enantiomer blanding hvor forbindelsen med formel Ib dominerer:



15

eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ester derav.

9. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 8, hvor forbindelsen med formel Ib dominerer i en grad av omtrent 90% eller større.

20

10. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 8, hvor forbindelsen med formel Ib dominerer i en grad av omtrent 98% eller større.

25

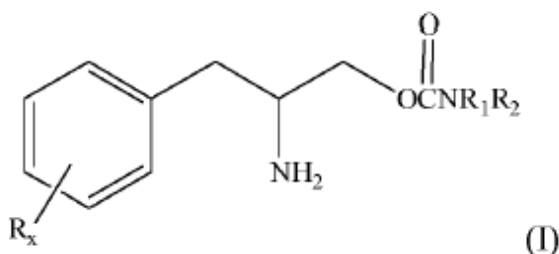
11. Forbindelse for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-10, hvor den effektive mengden av forbindelsen med formel I er fra omtrent 0,01 mg/kg/dose til omtrent 150 mg/kg/dose.

12. Forbindelse for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-10, hvor den effektive mengden av forbindelsen med formel I er fra omtrent 1 mg/dag til omtrent 7000 mg/dag.

13. Forbindelse for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-12, hvor forbindelsen med formel I administreres oralt.

14. Forbindelse for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-13, hvor forbindelsen med formel I administreres i form av en kapsel eller tablett, så som i form av en kapsel i en dose fra omtrent 10 til omtrent 1000 mg uten eksipienter.

15. Ikke-terapeutisk fremgangsmåte for å redusere kroppsvekt eller forhindre kroppsvektøkning hos et individ som er normalvektig eller overvektig, idet nevnte fremgangsmåte omfatter administrasjon til individet av en effektiv mengde av forbindelsen, som er en forbindelse med formel (I):



eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ester derav;

hvor R er et ledd valgt fra gruppen bestående av alkyl med 1 til 8

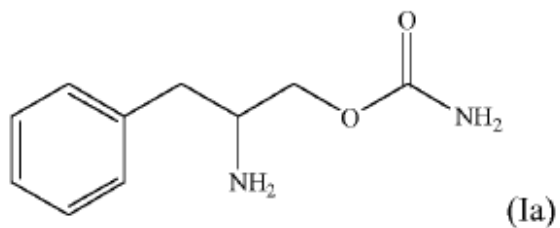
karbonatomer, halogen, alkoksy med 1 til 3 karbonatomer, nitro, hydroksy, trifluormetyl og tioalkoksy med 1 til 3 karbonatomer;

x er et heltall fra 0 til 3, med forbehold om at R kan være den samme eller forskjellig når x er 2 eller 3;

R₁ og R₂ er uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydrogen, alkyl med 1 til 8 karbonatomer, arylalkyl, cykloalkyl med 3 til 7 karbonatomer; eller

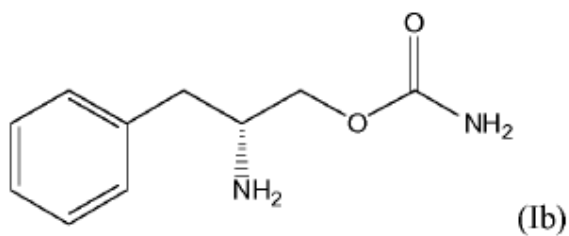
R₁ og R₂ kan forbindes for å danne en 5- til 7-leddet heterocyklus som er usubstituert eller substituert med en eller flere alkyl- eller arylgrupper, hvor heterocyklusen omfatter 1 til 2 nitrogenatomer og 0 til 1 oksygenatom, hvor nitrogenatomer er ikke direkte koblet med hverandre eller med oksygenatomet.

16. Fremgangsmåte ifølge krav 15, hvor forbindelsen med formel I er en enantiomer med formel I vesentlig fri for andre enantiomerer eller en enantiomer blanding hvor en enantiomer med formel I dominerer, og enantiomerer av forbindelsen med formel I er en enantiomer av forbindelse med formel Ia:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ester derav.

17. Fremgangsmåte ifølge krav 16, hvor forbindelsen med formel I er en
5 enantiomer med formel I vesentlig fri for andre enantiomerer eller en enantiomer
blanding hvor en enantiomer med formel I dominerer, og enantiomeren med formel
I vesentlig fri for andre enantiomerer er forbindelsen med formel Ib eller en
enantiomer blanding hvor forbindelsen med formel Ib dominerer:



10 eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ester derav.