



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3041827 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 271/06 (2006.01)
A61K 31/395 (2006.01)
A61K 31/4245 (2006.01)
A61K 31/433 (2006.01)
C07D 273/00 (2006.01)
C07D 273/08 (2006.01)
C07D 285/08 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

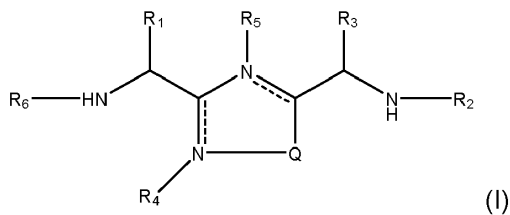
(21)	Translation Published	2018.09.03
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.04.18
(86)	European Application Nr.	14790320.7
(86)	European Filing Date	2014.09.05
(87)	The European Application's Publication Date	2016.07.13
(30)	Priority	2013.09.06, IN, 4011CH2013
(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	Aurigene Discovery Technologies Limited, 39-40 KIADB Industrial Area Electronic City Phase-II Hosur Road, Bangalore, Karnataka 560100, IN-India
(72)	Inventor	SASIKUMAR, Pottayil Govindan Nair, 5 Deccan Palms Ananth Nagar Phase II Electronic City Post, Bangalore 560100, IN-India RAMACHANDRA, Muralidhara, V173 Adarsh Palm Retreat Outer Ring Road Bellandur Post, Bangalore 560103, IN-India NAREMADDEPALLI, Seetharamaiah Setty Sudarshan, 33/AShenimahathama Temple Compound R. K. Layout K. G. Nagar, Bangalore 560 019, IN-India
(74)	Agent or Attorney	CURO AS, Vestre Rosten 81, 7075 TILLER, Norge

(54)	Title	1,2,4-OXADIAZOLE DERIVATIVES AS IMMUNOMODULATORS
(56)	References Cited:	WO-A1-2012/168944, SUSSAN K. ARDESTANI, FATEMAH POORRAJAB, SEPIDEH RAZMI, ALIREZA FOROUMADI, SOHEILA AJDARY, BEHNAZ GHAREGOZLOU ET AL.: "Cell death features induced in Leishmania major by 1, 3, 4-thiadiazole derivatives", EXPERIMENTAL PARASITOLOGY, vol. 132, 14 August 2012 (2012-08-14), pages 116-122, XP002732914,

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 Q er S eller O;

R₁ representerer en sidekjede av en aminosyrerest valgt fra Ser og Thr, valgfritt substituert med alkyl eller acyl;

R₂ er hydrogen eller -CO-Aaa;

10 Aaa er en aminosyrerest valgt fra Thr og Ser; hvori en C-terminus av samme er en fri terminus, er amidert, eller er forestret;

R₃ representerer en sidekjede av en aminosyrerest valgt fra Asn, Asp, Gln, og Glu;

----- er en valgfri binding;

R₄ og R₅ er uavhengig hydrogen eller fraværende;

R₆ er hydrogen, alkyl, eller acyl;

15 eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

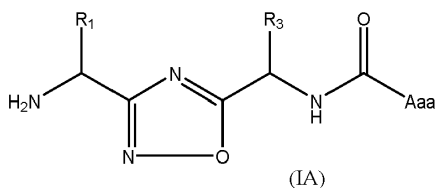
2. Forbindelse ifølge krav1, hvori Q er O.

3. Forbindelse ifølge krav1, hvori R₆ er H.

4. Forbindelse ifølge krav1, hvori R₆ er -C(O)CH₃, -C(O)CH₂CH₃, -C(O)(CH₂)₂CH₃, -C(O)(CH₂)₃CH₃, -C(O)(CH₂)₄CH₃ eller -C(O)(CH₂)₅CH₃.

20 5. Forbindelse ifølge krav1, hvori R₂ er -CO-Aaa.

6. Forbindelse ifølge krav 1, hvori forbindelsen med formel (I) er en forbindelse med formel (IA):



eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme; hvori,

R_1 representerer en sidekjede av en aminosyrerest valgt fra Ser og Thr, valgfritt substituert med alkyl eller acyl;

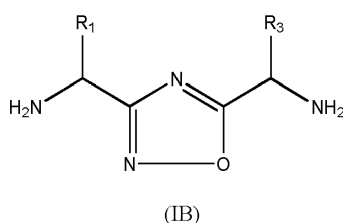
R_3 representerer en sidekjede av en aminosyrerest valgt fra Asn, Asp, Gln, og Glu; og

Aaa er en aminosyrerest valgt fra Thr og Ser; hvori nevnte C-terminus av samme er en fri terminus, er amidert eller er forestret.

7. Forbindelse ifølge krav 1, hvori

Aaa er en aminosyrerest valgt fra Thr og Ser; hvori nevnte C-terminus er en fri terminus.

8. Forbindelse ifølge krav 1, hvori forbindelsen med formel (I) er en forbindelse med formel (IB):



10 eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme; hvori,

R_1 representerer en sidekjede av en aminosyrerest valgt fra Ser og Thr, valgfritt substituert med alkyl eller acyl; og

R_3 representerer en sidekjede av en aminosyrerest valgt fra Asn, Asp, Gln, og Glu.

9. Forbindelse ifølge krav 1, hvori:

15 R_1 representerer en sidekjede av en aminosyrerest valgt fra Ser og Thr.

10. Forbindelse ifølge krav 1, hvori R_1 er substituert med C_{1-5} alkyl.

11. Forbindelse ifølge krav 1, hvori R_3 representerer en sidekjede av en aminosyrerest valgt fra Asn og Glu.

12. Forbindelse ifølge krav 1, hvori:

20 R_1 representerer en sidekjede av en aminosyrerest valgt fra Ser og Thr;

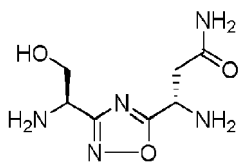
R_2 er -CO-Aaa;

Aaa er en aminosyrerest valgt fra Thr og Ser; hvori nevnte C-terminus er en fri terminus;

R_3 representerer en sidekjede av en aminosyrerest valgt fra Asn og Glu.

13. Forbindelse ifølge krav 1, hvori R_1 representerer en sidekjede av en aminosyrerest Ser.

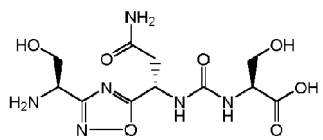
14. Forbindelse ifølge krav 1, hvori R_1 representerer en sidekjede av en aminosyrerest Thr.
15. Forbindelse ifølge krav 1, hvori Aaa er Ser.
16. Forbindelse ifølge krav 1, hvori Aaa er Thr.
17. Forbindelse ifølge krav 1, hvori R_3 representerer en sidekjede av en aminosyrerest Asn.
- 5 18. Forbindelse ifølge krav 1, hvori R_3 representerer en sidekjede av en aminosyrerest Asp.
19. Forbindelse ifølge krav 1, hvori R_3 representerer en sidekjede av en aminosyrerest Gln.
20. Forbindelse ifølge krav 1, hvori R_3 representerer en sidekjede av en aminosyrerest Glu.
21. Forbindelse ifølge krav 1, hvori R_2 er H.
22. Forbindelse ifølge krav 1, med følgende struktur:



10

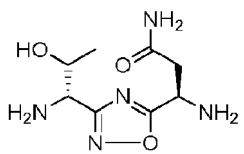
eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

23. Forbindelse ifølge krav 1, med følgende struktur:



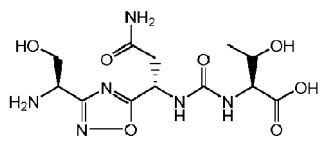
eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

- 15 24. Forbindelse ifølge krav 1, med følgende struktur:



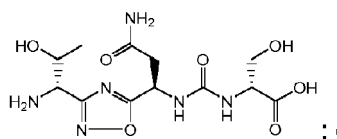
eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

25. Forbindelse ifølge krav 1, med følgende struktur:



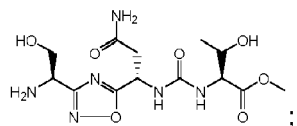
20 eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

26. Forbindelse ifølge krav 1, med følgende struktur:



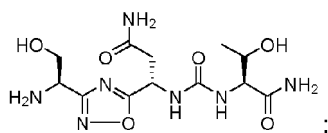
eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

27. Forbindelse ifølge krav 1, med følgende struktur:



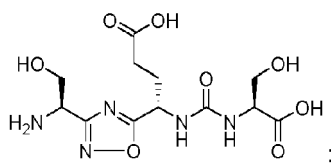
eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

28. Forbindelse ifølge krav 1, med følgende struktur:



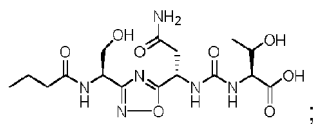
eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

29. Forbindelse ifølge krav 1, med følgende struktur:



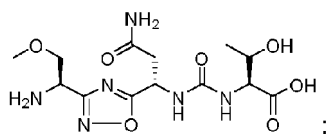
eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

30. Forbindelse ifølge krav 1, med følgende struktur:



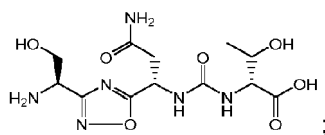
eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

31. Forbindelse ifølge krav 1, med følgende struktur:



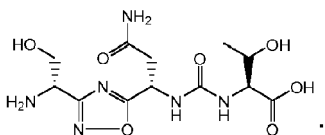
eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

32. Forbindelse ifølge krav 1, med følgende struktur:



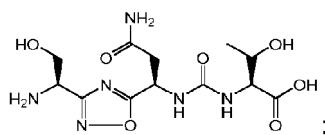
eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

33. Forbindelse ifølge krav 1, med følgende struktur:



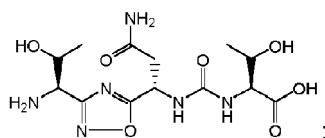
eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

34. Forbindelse ifølge krav 1, med følgende struktur:



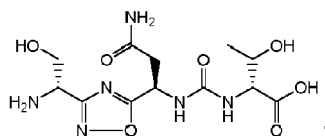
eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

35. Forbindelse ifølge krav 1, med følgende struktur:



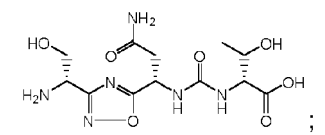
eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

36. Forbindelse ifølge krav 1, med følgende struktur:



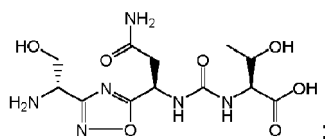
eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

37. Forbindelse ifølge krav 1, med følgende struktur:



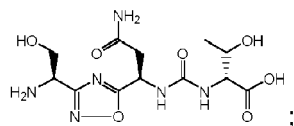
eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

38. Forbindelse ifølge krav 1, med følgende struktur:



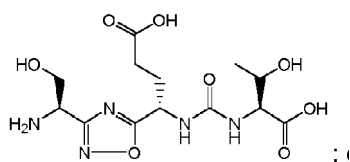
eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

39. Forbindelse ifølge krav 1, med følgende struktur:



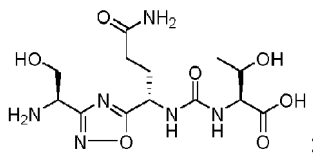
eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

40. Forbindelse ifølge krav 1, med følgende struktur:



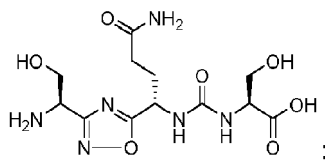
eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

41. Forbindelse ifølge krav 1, med følgende struktur:



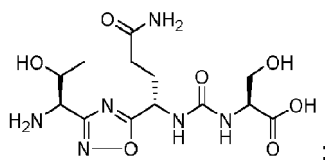
eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

42. Forbindelse ifølge krav 1, med følgende struktur:



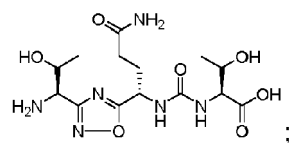
eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

43. Forbindelse ifølge krav 1, med følgende struktur:



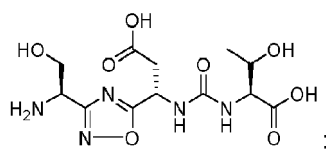
eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

44. Forbindelse ifølge krav 1, med følgende struktur:



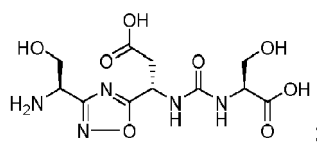
eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

5 45. Forbindelse ifølge krav 1, med følgende struktur:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

46. Forbindelse ifølge krav 1, med følgende struktur:



10 eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

47. Farmasøytisk blanding som omfatter en farmasøytisk akseptabel bærer eller tilsetningsstoff og minst én forbindelse ifølge et av kravene 1-46 eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

48. Farmasøytisk blanding ifølge krav 47, omfatter videre minst ett middel av et antikreftmiddel, et kjemoterapeutisk middel, og en antiproliferativ forbindelse.