



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 3070091 B1

NORWAY

(19) NO  
(51) Int Cl.  
**C07D 493/10 (2006.01)**  
**A61K 31/443 (2006.01)**  
**A61K 31/4433 (2006.01)**  
**A61K 31/4436 (2006.01)**  
**A61P 9/00 (2006.01)**  
**A61P 11/00 (2006.01)**  
**A61P 17/00 (2006.01)**  
**A61P 25/00 (2006.01)**  
**A61P 35/00 (2006.01)**  
**A61P 37/00 (2006.01)**  
**C07D 495/10 (2006.01)**

**Norwegian Industrial Property Office**

---

(21)	Translation Published	2019.09.16
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.04.17
(86)	European Application Nr.	16020112.5
(86)	European Filing Date	2011.06.24
(87)	The European Application's Publication Date	2016.09.21
(30)	Priority	2010.06.24, US, 358209 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
(62)	Divided application	EP2585469, 2011.06.24
(73)	Proprietor	LEO PHARMA A/S, Industriparken 55, 2750 Ballerup, Danmark
(72)	Inventor	Nielsen, Simon Feldbæk, c/o LEO Pharma A/S Industriparken 55, 2750 Ballerup, Danmark
(74)	Agent or Attorney	Orsnes Patent ApS, Forskerparken 10, 5230 ODENSE, Danmark

---

(54) Title                   **BENZODIOXOLE DERIVATIVES AS PHOSPHODIESTERASE INHIBITORS**

(56) References Cited: WO-A2-2008/104175 B KEVIN PARK ET AL: ANNUAL REVIEW OF PHARMACOLOGY AND TOXICOLOGY, vol. 41, no. 1, 1 April 2001 (2001-04-01), pages 443-470, XP055004685, ISSN: 0362-1642, DOI: 10.1146/annurev.pharmtox.41.1.443 BUNDSCHEUH: "In vivo efficacy in airway disease models of roflumilast, a novel orally active PDE4 inhibitor", JOURNAL OF PHARMACOLOGY AND EXPERIMENTAL THERAPEUTICS, vol. 297, no. 1, 1 January 2001 (2001-01-01), page 280, XP055004687, ISSN: 0022-3565 FRÉDÉRIC LEROUX ET AL: "[alpha]-Fluorinated Ethers, Thioethers, and Amines: Anomerically Biased Species", CHEMICAL REVIEWS, vol. 105, no. 3, 1 March 2005 (2005-03-01) , pages 827-856, XP055004691, ISSN: 0009-2665, DOI: 10.1021/cr040075b

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.** Sammensetning som er 2-(3,5-Dikloro-1-oksido-pyridin-4-yl)-1-{9-difluorometoksy-spiro[2H-1,5-benzodioksepin-3(4H),3'-oksetan]-6-yl}etanon, eller et farmasøytisk akseptabelt hydrat eller solvat derav, til anvendelse ved behandling av proliferative og inflammatoriske hudlidelser som psoriasis, epidermal inflammasjon, akne, dermatitt, atopisk dermatitt, seboreisk dermatitt, kontaktdermatitt, urtikaria, pruritus og eksem.
- 2.** Sammensetningen til anvendelse ifølge krav 1, hvori hudlidelsen er psoriasis.
- 3.** Sammensetningen, 2-(3,5-Dikloro-1-oksido-pyridin-4-yl)-1-{9-difluorometoksy-spiro[2H-1,5-benzodioksepin-3(4H),3'-oksan]-6-yl}etanon, til anvendelse ved oral behandling av psoriasis.
- 4.** Sammensetning som er 2-(3,5-Dikloro-1-oksido-pyridin-4-yl)-1-{9-difluorometoksy-spiro[2H-1,5-benzodioksepin-3(4H),4'-tetrahydropyran]-6-yl}etanon, eller et farmasøytisk akseptabelt hydrat eller solvat derav, til anvendelse ved behandling av proliferative og inflammatoriske hudlidelser som psoriasis, epidermal inflammasjon, akne, dermatitt, atopisk dermatitt, seboreisk dermatitt, kontaktdermatitt, urtikaria, pruritus og eksem.
- 5.** Sammensetningen til anvendelse ifølge krav 4, hvori hudlidelsen er psooriasis.
- 6.** Sammensetningen, 2-(3,5-Dikloro-1-oksido-pyridin-4-yl)-1-{9-difluorometoksy-spiro[2H-1,5-benzodioksepin-3(4H),4'-tetrahydropyran]-6-yl}etanon, til anvendelse ved oral behandling av psoriasis.
- 7.** Sammensetning som er 2-(3,5-Dikloro-1-oksido-pyridin-4-yl)-1-(7-difluorometoksy-2',3',5',6'-tetrahydro-spiro[1,3-benzodioksol-2,4'-(4H)-pyran]-4-yl) etanon, eller et farmasøytisk akseptabelt hydrat eller solvat derav, til anvendelse ved behandling av proliferative og inflammatoriske hudlidelser som psoriasis, epidermal inflammasjon, akne, dermatitt, atopisk

dermatitt, sebereisk dermatitt, kontaktdermatitt, urtikaria, pruritus og eksem.

**8.** Sammensetningen til anvendelse ifølge krav 7, hvori hudlidelsen er psooriasis.

**9.** Sammensetningen, 2-(3,5-Dikloro-1-okso-pyridin-4-yl)-1-(7-difluorometoksy-2',3',5',6'-tetrahydro-spiro[1,3-benzodioksol-2,4'-(4H)-pyran]-4-yl)etanon til anvendelse ved oral behandling av psoriasis.

**10.** Sammensetning som er 2-(3,5-Dikloro-1-oksido-pyridin-4-yl)-1-(7-difluorometoksy-2',3',5',6'-tetrahydro-spiro[1,3-benzodioksol-2,4'-(4H)-tiopyran-1',1'-dioksid]-4-yl)etanon, eller et farmasøyttisk akseptabelt hydrat eller solvat derav, til anvendelse ved behandling av proliferative og inflammatoriske hudlidelser som psoriasis, epidermal inflamasjon, akne, dermatitt, atopisk dermatitt, sebereisk dermatitt, kontaktdermatitt, urtikaria, pruritus og eksem.

**11.** Sammensetningen til anvendelse ifølge krav 10, hvori hudlidelsen er psoriasis.

**12.** Sammensetningen, 2-(3,5-Dikloro-1-okso-pyridin-4-yl)-1-(7-Difluorometoksy-2',3',5',6'-tetrahydro-spiro[1,3-benzodioksol-2,4'-(4H)-tiopyran-1',1'-dioksid]-4-yl)etanon, til anvendelse ved oral behandling av psoriasis.