



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3209302 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/661 (2006.01)
A61K 31/6615 (2006.01)
A61P 25/16 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

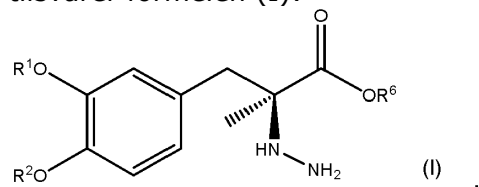
(21)	Translation Published	2019.09.09
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.04.24
(86)	European Application Nr.	15791424.3
(86)	European Filing Date	2015.10.21
(87)	The European Application's Publication Date	2017.08.30
(30)	Priority	2014.10.21, US, 201462066771 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	AbbVie Inc., 1 North Waukegan Road, North Chicago, IL 60064, USA
(72)	Inventor	CARDINAL-DAVID, Benoit, 4814 North Clark Street Apt 510, Chicago, Illinois 60640, USA CHAN, Vincent S., 734 Hinman Ave 1, Evanston, Illinois 60202, USA DEMPAH, Kassibla E., 811 W Eastwood Avenue Apt 405, Chicago, Illinois 60640, USA ENRIGHT, Brian P., 5075 Bennington Drive, Gurnee, Illinois 60031, USA HENRY, Rodger F., 33067 Tomahawk Ct., Wildwood, Illinois 60030, USA HO, Raimundo, 998 Church St Unit 211, Glenview, Illinois 60025, USA HUANG, Ye, 33873 North Summerfields Drive, Gurnee, Illinois 60031, USA HUTERS, Alexander D., 2322 Palmer St. Apt. 2, Chicago, Illinois 60647, USA KLIX, Russell C., 841 Westbourne Lane, Buffalo Grove, Illinois 60089, USA KRABBE, Scott W., 2013 Old Elm Road, Lindenhurst, Illinois 60046, USA KYM, Philip R., 1002 Gracewood Drive, Libertyville, Illinois 60048, USA LAO, Yanbin, 29578 North Birch Avenue, Lake Bluff, Illinois 60044, USA LOU, Xiaochun, 8094 RFD Breckenridge Drive, Long Grove, Illinois 60047, USA MACKEY, Sean E., 744 Walton Lane, Grayslake, Illinois 60030, USA MATULENKO, Mark A., 1875 Countryside Drive, Libertyville, Illinois 60048, USA MAYER, Peter T., 1117 Avalon Lane, Libertyville, Illinois 60048, USA MILLER, Christopher P., 1685 Millburne Road, Lake Forest, Illinois 60045, USA STAMBULI, James, 533 Lasalle Lane, Buffalo Grove, Illinois 60089, USA VOIGHT, Eric A., 10615 48TH Avenue, Pleasant Prairie, Wisconsin 53158, USA WANG, Zhi, 1848 S. Waxwing Lane, Libertyville, Illinois 60048, USA ZHANG, Geoff G., 1372 Maidstone Drive, Vernon Hills, Illinois 60061, USA STELLA, Valentino J., 1135 West Campus Road, Lawrence, Kansas 66044, USA
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

(54)	Title	CARBIDOPA AND L-DOPA PRODRUGS AND THEIR USE TO TREAT PARKINSON'S DISEASE
(56)	References Cited:	US-A1- 2012 288 446 EP-A2- 0 393 781 US-A- 3 132 171 HIDEKO MAEDA ET AL.: "PHOSPHONYLATION OF L-DOPA WITH SODIUM PHOSPHONATE IN AQUEOUS SOLUTION", PHOSPHORUS RESEARCH BULLETIN, vol. 25, 2011, pages 56-60, XP002753575, PAWELEK ET AL.: "INCREASE IN MELANIN FORMATION AND PROMOTION OF CYTOTOXICITY IN CULTURED MELANOMA CELLS CAUSED BY PHOSPHORYLATED ISOMERS OF L-DOPA", CANCER RESEARCH, vol. 46, no. 2, February 1996 (1996-02), pages 493-497, XP002753574,

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/>

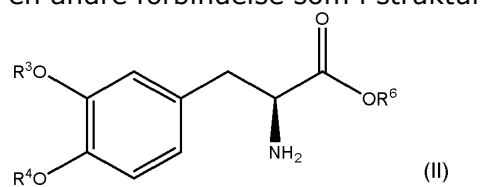
Patentkrav

1. Farmasøytisk sammensetning omfattende en første forbindelse som i struktur tilsvarende formelen (I):



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori **R¹** og **R²** hver for seg er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, -P(O)(OH)₂, og -**R⁵**-O-P(O)(OH)₂; **R⁵** er et C₁-C₄-alkyl; **R⁶** er hydrogen eller et C₁-C₄-alkyl; og forutsatt at minst én av **R¹** og **R²** er -P(O)(OH)₂ eller -**R⁵**-O-P(O)(OH)₂; og

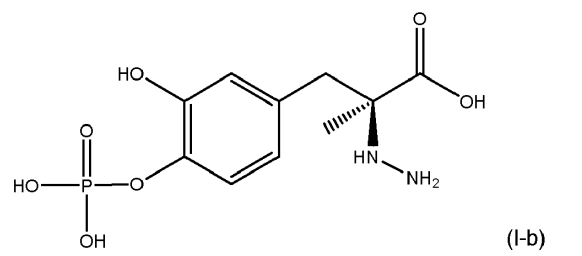
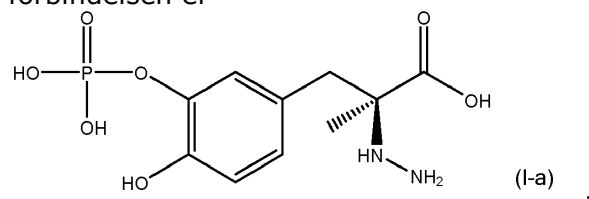
10 en andre forbindelse som i struktur tilsvarende formelen (II):



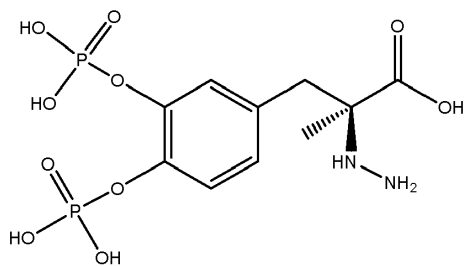
eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori **R³** og **R⁴** hver for seg er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, -P(O)(OH)₂ og -**R⁵**-O-P(O)(OH)₂; **R⁵** er et C₁-C₄-alkyl; **R⁶** er hydrogen eller et C₁-C₄-alkyl; og forutsatt at minst én av **R³** og **R⁴** er -P(O)(OH)₂ eller -**R⁵**-O-P(O)(OH)₂.

15

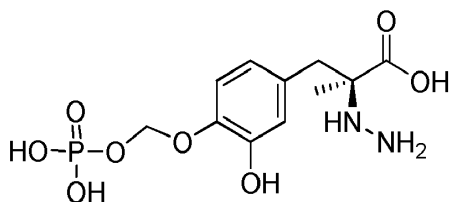
2. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1, hvori den første forbindelsen er



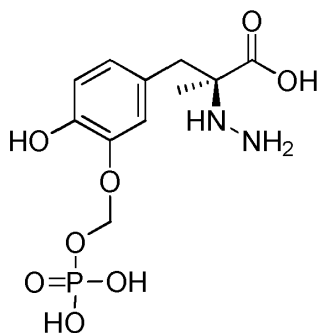
2



(I-c) ,



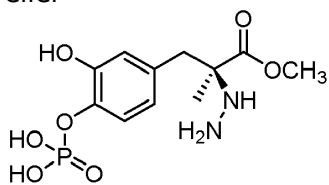
(I-d),



(I-e),

5

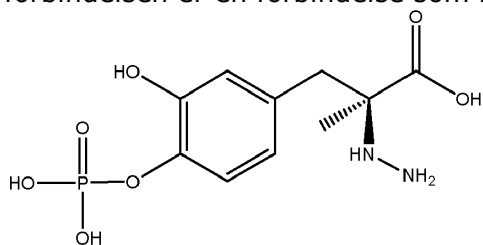
eller



(I-f).

10

3. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1 eller 2, hvori den første forbindelsen er en forbindelse som i struktur tilsvarer formelen (I-b):



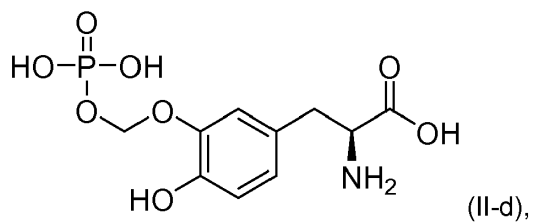
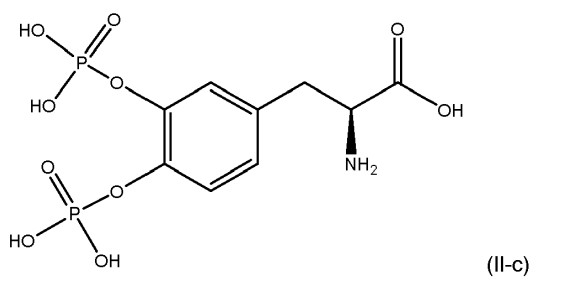
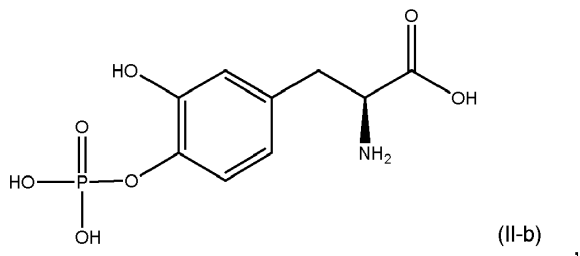
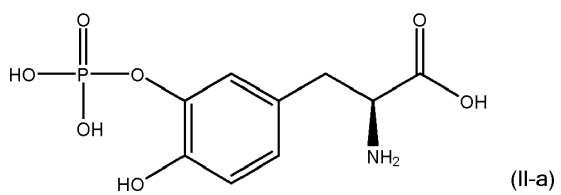
(I-b) ,

eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

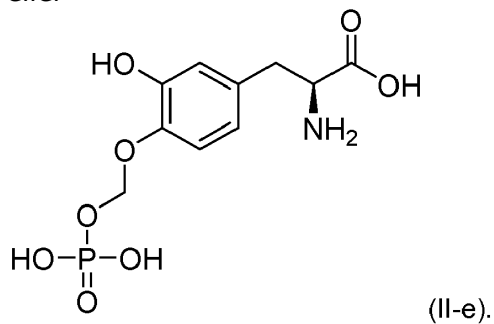
15

4. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvori den andre forbindelsen er

3

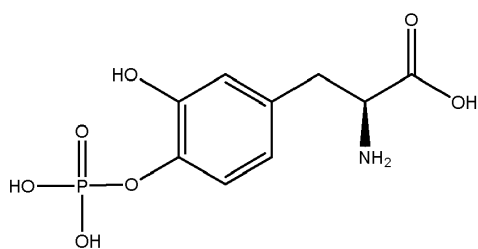


eller



5. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, hvori den andre forbindelsen er en forbindelse som i struktur tilsvarer formelen (II-b):

4



(II-b)

eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

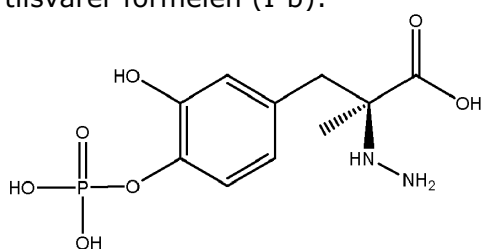
6. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5, ytterligere omfattende en farmasøytisk akseptabel bærer.

7. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6, hvori den første forbindelsen eller det farmasøytisk akseptable saltet derav har en løselighet på minst ca. 200 mg/ml i vandig løsning ved omtrent nøytral pH, og den andre forbindelsen eller det farmasøytisk akseptable saltet derav har en løselighet på minst ca. 400 mg/ml i vandig løsning ved omtrent nøytral pH.

8. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7, hvori sammensetningen ytterligere omfatter vann og er egnet for infusjon.

9. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8, hvori sammensetningen er en vandig sammensetning egnet for subkutan administrering.

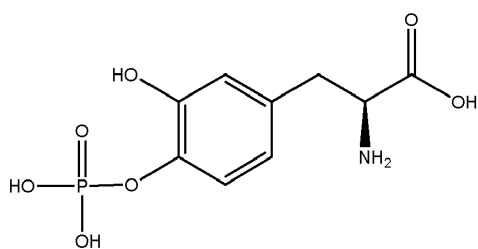
10. Farmasøytisk sammensetning omfattende en første forbindelse som i struktur tilsvare formelen (I-b):



(I-b)

eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav; og en andre forbindelse som i struktur tilsvare formelen (II-b):

5



(II-b)

eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav,

hvor sammensetningen er en vandig sammensetning egnet for subkutan administrering.

5

11. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 10, for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av Parkinsons sykdom hos et individ med behov for dette og/eller en fremgangsmåte for å tilveiebringe redningsterapi hos et individ med Parkinsons sykdom, der fremgangsmåten omfatter å administrere til individet en terapeutisk effektiv mengde av den farmasøytiske sammensetningen.

10

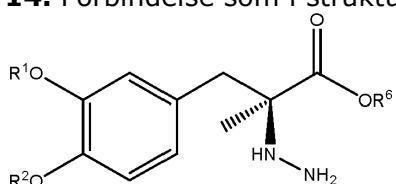
12. Sammensetningen for anvendelse ifølge krav 11, hvor fremgangsmåten omfatter i det vesentlige kontinuerlig administrering av den første forbindelse og den andre forbindelsen over et tidsrom på minst 12 timer.

15

13. Sammensetningen til anvendelse ifølge krav 11 eller 12, der fremgangsmåten ytterligere omfatter administrering av et annet middel mot Parkinson til individet.

20

14. Forbindelse som i struktur tilsvarer formelen (I):



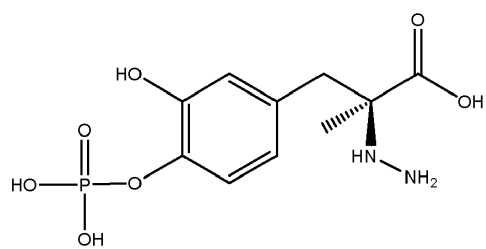
(I)

eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor **R¹** og **R²** hver for seg er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, -P(O)(OH)₂ og -**R⁵**-O-P(O)(OH)₂; **R⁵** er et C₁-C₄-alkyl; **R⁶** er hydrogen eller et C₁-C₄-alkyl; og forutsatt at minst én av **R¹** og **R²** er -P(O)(OH)₂ eller -**R⁵**-O-P(O)(OH)₂.

25

15. Forbindelsen eller saltet ifølge krav 14, hvor forbindelsen i struktur tilsvarer formelen (I-b):

6



(I-b)