



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3227294 B1

NORWAY

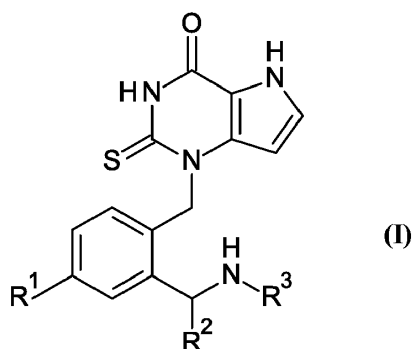
(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 487/04 (2006.01)
A61K 31/519 (2006.01)
A61P 9/10 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2019.12.02
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.08.14
(86)	European Application Nr.	15802075.0
(86)	European Filing Date	2015.11.30
(87)	The European Application's Publication Date	2017.10.11
(30)	Priority	2014.12.01, US, 201462085722 P 2015.05.27, US, 201562166808 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
(73)	Proprietor	Astrazeneca AB, 151 85 Södertälje, Sverige
(72)	Inventor	INGHARDT, Tord Bertil, AstraZeneca, S-431 83 Mölndal, Sverige TOMKINSON, Nicholas, AstraZeneca Alderley Park, Macclesfield Cheshire SK10 4TG, Storbritannia GAN, Li-Ming, AstraZeneca, S-431 83 Mölndal, Sverige STONEHOUSE, Jeffrey, Paul, c/o AstraZeneca Intellectual PropertyAstraZeneca35 Gatehouse Drive Waltham, MA 02451, USA JOHANNESSON, Petra, AstraZeneca, S-431 83 Mölndal, Sverige JURVA, Ulrik, AstraZeneca, S-431 83 Mölndal, Sverige MICHAËLSSON, Erik, AstraZeneca, S-431 83 Mölndal, Sverige LINDSTEDT-ALSTERMARK, Eva-Lotte, AstraZeneca, S-431 83 Mölndal, Sverige
(74)	Agent or Attorney	TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

(54)	Title	1-[2-(AMINOMETHYL)BENZYL]-2-THIOXO-1,2,3,5-TETRAHYDRO-4H-PYRROLO[3,2-D]PYRIMIDIN-4-ONES AS INHIBITORS OF MYELOPEROXIDASE
(56)	References Cited:	WO-A1-2009/025618 WO-A1-2006/062465

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/>

Patentkrav5 **1.** Forbindelse med formel **(I)**

hvor

R¹ er H, F, Cl eller CF₃;

R² er H, CH₃ eller C₂H₅; og

- 10 **R³** er H, CH₃, C₂H₅, n-propyl, isopropyl, n-butyl, isobutyl, sek-butyl, tert-butyl, syklopropyl, syklopropylmetyl, syklobutyl, syklobutylmetyl eller syklopentyl; eller et farmasøytisk akseptabelt salt deriv.

2. Forbindelse ifølge krav 1, hvor **R¹** er Cl.

15

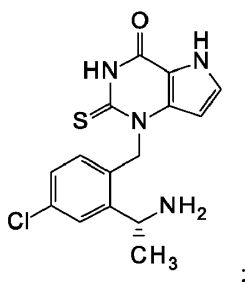
3. Forbindelse ifølge krav 1, hvor **R²** er CH₃.

4. Forbindelse ifølge krav 1, hvor **R²** er H.

20 **5.** Forbindelse ifølge krav 1, hvor **R³** er H.

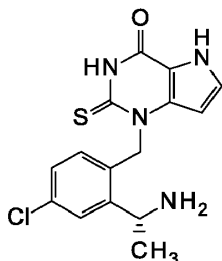
6. Forbindelse ifølge krav 1, hvor karbonatomet som **R²** er bundet til har R-konfigurasjonen når **R²** er CH₃ eller C₂H₅.

25 **7.** Forbindelse ifølge krav 1, som er 1-{2-[(1*R*)-1-aminoetyl]-4-klorbenzyl}-2-tiokso-1,2,3,5-tetrahydro-4*H*-pyrrolo[3,2-*d*]pyrimidin-4-on:



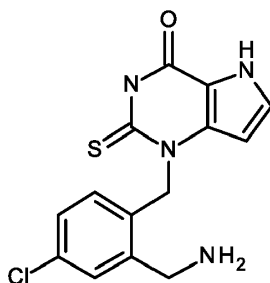
eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

8. Forbindelse ifølge krav 1, som er 1-{2-[(1*R*)-1-aminoetyl]-4-klorbenzyl}-2-tiokso-1,2,3,5-tetrahydro-4*H*-pyrrolo[3,2-*d*]pyrimidin-4-on:



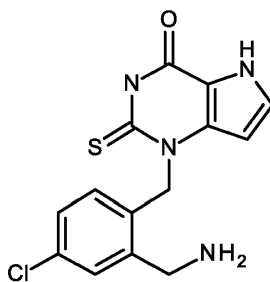
5

9. Forbindelse ifølge krav 1, som er 1-[2-(aminometyl)-4-klorbenzyl]-2-tiokso-1,2,3,5-tetrahydro-4*H*-pyrrolo[3,2-*d*]pyrimidin-4-on:



10 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

10. Forbindelse ifølge krav 1, som er 1-[2-(aminometyl)-4-klorbenzyl]-2-tiokso-1,2,3,5-tetrahydro-4*H*-pyrrolo[3,2-*d*]pyrimidin-4-on:



15

11. Forbindelse ifølge krav 1, valgt blant

1-{2-[(1*R*)-1-aminopropyl]-4-klorbenzyl}-2-tiokso-1,2,3,5-tetrahydro-4*H*-pyrrolo[3,2-*d*]pyrimidin-4-on;

1-[2-(1-aminoetyl)-4-klorbenzyl]-2-tiokso-1,2,3,5-tetrahydro-4*H*-pyrrolo[3,2-*d*]pyrimidin-4-on;

1-{2-[(1*S*)-1-aminoetyl]-4-klorbenzyl}-2-tiokso-1,2,3,5-tetrahydro-4*H*-pyrrolo[3,2-*d*]pyrimidin-4-on;

20

- 1-{4-klor-2-[1-(metylamino)etyl]benzyl}-2-tiokso-1,2,3,5-tetrahydro-4*H*-pyrrolo[3,2-d]pyrimidin-4-on;
 1-{4-klor-2-[(etylamino)metyl]benzyl}-2-tiokso-1,2,3,5-tetrahydro-4*H*-pyrrolo[3,2-d]pyrimidin-4-on;
 5 1-{4-klor-2-[(metylamino)metyl]benzyl}-2-tiokso-1,2,3,5-tetrahydro-4*H*-pyrrolo[3,2-d]pyrimidin-4-on;
 1-(2-{[(syklobutylmetyl)amino]metyl}benzyl)-2-tiokso-1,2,3,5-tetrahydro-4*H*-pyrrolo[3,2-d]pyrimidin-4-on;
 1-(2-[(syklobutylamino)metyl]benzyl)-2-tiokso-1,2,3,5-tetrahydro-4*H*-pyrrolo[3,2-d]pyrimidin-4-on;
 10 1-{2-[(syklopentylamino)metyl]benzyl}-2-tiokso-1,2,3,5-tetrahydro-4*H*-pyrrolo[3,2-d]pyrimidin-4-on;
 1-(2-{[(2-metylpropyl)amino]metyl}benzyl)-2-tiokso-1,2,3,5-tetrahydro-4*H*-pyrrolo[3,2-d]pyrimidin-4-on;
 15 1-(2-[(propan-2-ylamino)metyl]benzyl)-2-tiokso-1,2,3,5-tetrahydro-4*H*-pyrrolo[3,2-d]pyrimidin-4-on;
 1-[2-(aminometyl)-4-(trifluormetyl)benzyl]-2-tiokso-1,2,3,5-tetrahydro-4*H*-pyrrolo[3,2-d]pyrimidin-4-on;
 1-{2-[(metylamino)metyl]-4-(trifluormetyl)benzyl}-2-tiokso-1,2,3,5-tetrahydro-4*H*-pyrrolo[3,2-d]pyrimidin-4-on;
 20 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

12. Farmasøytisk sammensetning omfattende en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 11, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, eventuelt i blanding med
 25 en farmasøytisk akseptabel adjuvans, fortynningsmidler eller bærer.

13. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 11 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse som et medikament.

30 **14.** Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 11 for anvendelse i behandling av hjertesvikt.

15. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 11 for anvendelse i behandling av hjertesvikt med redusert utstøtingsfraksjon.

35

16. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 11 for anvendelse i behandling av hjertesvikt med konserverte utstøtingsfraksjon.