



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3251675 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 473/08 (2006.01)
A61K 31/522 (2006.01)
A61P 13/04 (2006.01)
A61P 13/12 (2006.01)
A61P 19/02 (2006.01)
A61P 19/06 (2006.01)
A61P 29/00 (2006.01)
C07D 473/06 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.08.23
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.04.21
(86)	European Application Nr.	16742632.9
(86)	European Filing Date	2016.01.28
(87)	The European Application's Publication Date	2017.12.06
(30)	Priority	2015.01.30, CN, 201510048096 2015.02.13, CN, 201510079809 2015.02.13, CN, 201510080714 2015.04.30, CN, 201510216089
(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
	Designated Validation States:	MA ; MD
(73)	Proprietor	Shanton Pharma Pte. Ltd., 80 Robinson Road 02-00, Singapore 068898, Singapore
(72)	Inventor	ZHANG, Qian, B302No.750Shunhua RoadHigh-tech Industrial Development Zone, JinanShandong 250101, Kina HUANG, Zhenhua, B302No.750Shunhua RoadHigh-tech Industrial Development Zone, JinanShandong 250101, Kina LIU, Jinrong, B302No.750Shunhua RoadHigh-tech Industrial Development Zone, JinanShandong 250101, Kina CHI, Shuangshuang, B302No.750Shunhua RoadHigh-tech Industrial Development Zone, JinanShandong 250101, Kina

(74) Agent or Attorney ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54) Title **PREVENTION OR TREATMENT OF URIC ACID OR GOUT DISEASE**

(56) References

Cited:

CN-A- 101 479 273

US-A1- 2011 136 835

WO-A1-93/16699

CN-A- 101 103 030

WEN-LIANG SONG: "Niacin, an old drug with a new twist", J LIPID RES., vol. 54, no. 10, 1 October 2013 (2013-10-01), pages 2585-2594,

DENIS A. FITZPATRICK: "Nocotinic acid inhibition of uricase", I. J. MED. SC., vol. 2, no. 11, 1 November 1969 (1969-11-01), pages 531-534,

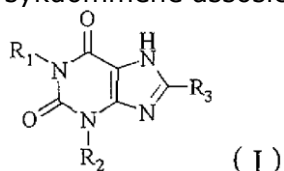
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters 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/>

[EP3151675]

1

Patentkrav

- 5 **1.** Forbindelse representert ved formel (I) eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav eller et solvat derav eller en farmasøytisk sammensetning inneholdende forbindelsen representert ved formel (I), eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav eller et solvat derav for anvendelse i forebygging eller behandling av sykdommene assosiert med økt urinsyrenivå i en organisme,



hvor

- 10 R_1 representerer hydrogen eller metyl,
 R_2 representerer etyl, propyl, 2-metylpropyl, butyl, 3-metylbutyl eller pentyl, og
 R_3 representerer fluor eller klor.

- 15 **2.** Forbindelsen eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav eller et solvat derav eller den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 1, hvor forbindelsen er valgt fra en gruppe bestående av:

- 8-klor-3-pentyl-3,7-dihydro-1H-purin-2,6-dion,
 8-klor-3-butyl-3,7-dihydro-1H-purin-2,6-dion,
 8-klor-1-metyl-3-butyl-3,7-dihydro-1H-purin-2,6-dion,
 20 8-klor-1-metyl-3-pentyl-3,7-dihydro-1H-purin-2,6-dion,
 8-klor-3-(3-metylbutyl)-3,7-dihydro-1H-purin-2,6-dion, 8-klor-3-(2-metylpropyl)-3,7-dihydro-1H-purin-2,6-dion og
 8-klor-1-metyl-3-(3-metylbutyl)-3,7-dihydro-1H-purin-2,6-dion.

- 25 **3.** Forbindelsen eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav eller et solvat derav eller den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 1, hvor forbindelsen er 8-klor-3-pentyl-3,7-dihydro-1H-purin-2,6-dion eller et hydrat derav.

[EP3151675]

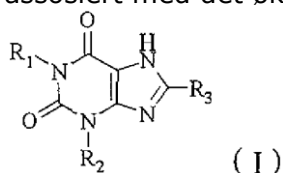
2

4. Forbindelsen eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav eller et solvat derav eller den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge hvilke som helst av kravene 1-3, hvori sykdommene assosiert med det økte urinsyrenivået er en uratsykdom og/eller giktskykdom.

5

5. Forbindelse representert ved formel (I) eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav eller et solvat derav eller en farmasøytisk sammensetning inneholdende forbindelsen representert ved formel (I) eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav eller et solvat derav for anvendelse i forebygging eller behandling av sykdommene assosiert med økt urinsyrenivå i en organisme, hvori sykdommene assosiert med det økte urinsyrenivået er en uratsykdom og/eller giktskykdom;

10



hvori R_1 er valgt fra en gruppe bestående av hydrogen og C_{1-4} -alkyl, hvori C_{1-4} -alkylet er usubstituert eller eventuelt substituert med ett eller flere halogen, cyano, CF_3 eller en kombinasjon derav;

15

R_2 er valgt fra en gruppe bestående av C_{1-10} -alkyl, C_{2-6} -alkenyl og C_{2-6} -alkynyl, hvori C_{1-10} -alkylet, C_{2-6} -alkenylet eller C_{2-6} -alkynylet er usubstituert eller eventuelt substituert med halogen eller cyano, eller en kombinasjon derav; og

20

R_3 er valgt fra en gruppe bestående av halogen og cyano.

6. Forbindelsen eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav eller et solvat derav eller den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 5, hvori R_1 representerer hydrogen eller metyl,

25

R_2 representerer etyl, propyl, 2-metylpropyl, butyl, 3-metylbutyl eller pentyl, og R_3 representerer fluor eller klor.

7. Forbindelsen eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav eller et solvat derav eller den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 5, hvori forbindelsen er valgt fra en gruppe bestående av:

30

[EP3151675]

8-klor-3-pentyl-3,7-dihydro-1H-purin-2,6-dion,
 8-klor-3-butyl-3,7-dihydro-1H-purin-2,6-dion,
 8-klor-1-metyl-3-butyl-3,7-dihydro-1H-purin-2,6-dion,
 8-klor-1-metyl-3-pentyl-3,7-dihydro-1H-purin-2,6-dion,
 5 8-klor-3-(3-metylbutyl)-3,7-dihydro-1H-purin-2,6-dion,
 8-klor-3-(2-metylpropyl)-3,7-dihydro-1H-purin-2,6-dion og
 8-klor-1-metyl-3-(3-metylbutyl)-3,7-dihydro-1H-purin-2,6-dion.

10 **8.** Forbindelsen eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav eller et solvat derav
 eller den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 5, hvori
 forbindelsen er 8-klor-3-pentyl-3,7-dihydro-1H-purin-2,6-dion eller et hydrat
 derav.

15 **9.** Forbindelsen eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav eller et solvat derav
 eller den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 4 eller 5,
 hvori uratsykdommen eller giktsykdommen er hyperurikemi, gikt, giktisk
 inflammasjon, smerte eller urinsyrenevropati.

20 **10.** Forbindelsen eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav eller et solvat derav
 eller den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 9, hvori
 hyperurikemien omfatter primær hyperurikemi og sekundær hyperurikemi.

25 **11.** Forbindelsen eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav eller et solvat derav
 eller den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 9, hvori
 gikten omfatter primær gikt og sekundær gikt.

30 **12.** Forbindelsen eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav eller et solvat derav
 eller den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 9, hvori den
 giktiske inflammasjonen inkluderer akutt giktisk artritt, subkutan tophi og kronisk
 tophiartritt.

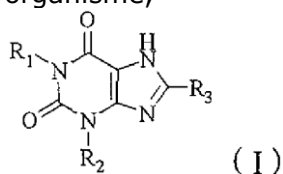
13. Forbindelsen eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav eller et solvat derav
 eller den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 9, hvori

[EP3151675]

4

urinsyrenevropatien inkluderer akutt urinsyrenevropati, kronisk uratnevropati og urinsyreolithiasis.

- 5 **14.** Forbindelse representert ved formel (I) eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav eller et solvat derav eller en farmasøytisk sammensetning inneholdende forbindelsen representert ved formel (I), eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav eller et solvat derav for anvendelse til å redusere urinsyrenivået i en organisme,



10

hvor R_1 er valgt fra en gruppe bestående av hydrogen og C_{1-4} -alkyl, hvor C_{1-4} -alkylet er usubstituert eller eventuelt substituert med én eller flere av halogen, cyano, CF_3 eller en kombinasjon derav;

15

R_2 er valgt fra en gruppe bestående av C_{1-10} -alkyl, C_{2-6} -alkenyl og C_{2-6} -alkynyl, hvor C_{1-10} -alkylet, C_{2-6} -alkenylet eller C_{2-6} -alkynylet er usubstituert eller eventuelt substituert med halogen eller cyano, eller en kombinasjon derav; og

R_3 er valgt fra en gruppe bestående av halogen og cyano.

20

- 15.** Forbindelsen eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav eller et solvat derav eller den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 14, hvor

R_1 representerer hydrogen eller metyl,

R_2 representerer etyl, propyl, 2-metylpropyl, butyl, 3-metylbutyl eller pentyl, og

R_3 representerer fluor eller klor.

25

- 16.** Forbindelsen eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav eller et solvat derav eller den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 14, hvor forbindelsen er valgt fra gruppen bestående av:

8-klor-3-pentyl-3,7-dihydro-1H-purin-2,6-dion,

8-klor-3-butyl-3,7-dihydro-1H-purin-2,6-dion,

[EP3151675]

5

8-klor-1-metyl-3-butyl-3,7-dihydro-1H-purin-2,6-dion, 8-klor-1-metyl-3-pentyl-
3,7-dihydro-1H-purin-2,6-dion,
8-klor-3-(3-metylbutyl)-3,7-dihydro-1H-purin-2,6-dion,
8-klor-3-(2-metylpropyl)-3,7-dihydro-1H-purin-2,6-dion, og
5 8-klor-1-metyl-3-(3-metylbutyl)-3,7-dihydro-1H-purin-2,6-dion.

17. Forbindelsen eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav eller et solvat derav
eller den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 14, hvori
forbindelsen er 8-klor-3-pentyl-3,7-dihydro-1H-purin-2,6-dion eller et hydrat
10 derav.