



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3373931 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/437 (2006.01)
A61P 1/00 (2006.01)
C07D 471/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2023.02.06
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2022.09.28
(86)	European Application Nr.	16865156.0
(86)	European Filing Date	2016.11.11
(87)	The European Application's Publication Date	2018.09.19
(30)	Priority	2015.11.13, US, 201562255041 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	Oppilan Pharma Ltd., St. John's Innovation Centre Cowley Road, Cambridge CB4 0WS, Storbritannia
(72)	Inventor	MOHAN, Raju, 3125 Caminito Ricardo, Encinitas, California 92024, USA NUSS, John, 3414 Corte Brezo, Carlsbad, CA 92009, USA HARRIS, Jason, 3332 Corte Verso, Carlsbad, CA 92009, USA
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54)	Title	HETEROCYCLIC COMPOUNDS FOR THE TREATMENT OF DISEASE
(56)	References Cited:	US-A1- 2007 043 014 US-A1- 2010 160 369 WO-A1-2006/131336 US-A1- 2013 158 001

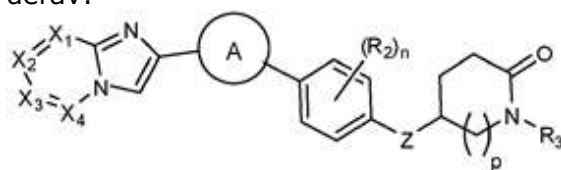
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters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

EP3373931

1

Patentkrav

1. Forbindelse med formel (I) eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav:



Formel (I);

hvor:

X₁, X₂, X₃ og X₄ hver er CR₁;



er



Z er -O-;

hver R₁ er uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydrogen, halogen, eventuelt substituert C₁-C₆alkyl, eventuelt substituert C₂-C₆alkenyl, eventuelt substituert C₂-C₆alkynyl, eventuelt substituert aryl, eventuelt substituert heteroaryl, eventuelt substituert C₃-C₈sykloalkyl, eventuelt substituert -(C₁-C₂alkylen)-(C₃-C₈sykloalkyl), eventuelt substituert C₂-C₉heterosykloalkyl, eventuelt substituert -(C₁-C₂alkylen)-(C₂-C₉heterosykloalkyl), eventuelt substituert -(C₁-C₂alkylen)-(aryl), eventuelt substituert -(C₁-C₂alkylen)-(heteroaryl), -CF₃, -OR₁₀, -SR₁₀, -N(R₁₁)R₁₂, -N(R₁₁)S(O)₂R₁₅, -N(R₁₃)N(R₁₁)R₁₂, -N(R₁₃)N(R₁₁)S(O)₂R₁₅, -C(O)R₁₄, -C(O)OR₁₀, -C(S)OR₁₀, -C(O)SR₁₀, -C(O)N(R₁₁)R₁₂, -C(S)N(R₁₁)R₁₂, -C(O)N(R₁₁)S(O)₂R₁₅, -C(S)N(R₁₁)S(O)₂R₁₅, -C(O)N(R₁₃)N(R₁₁)R₁₂, -C(S)N(R₁₃)N(R₁₁)R₁₂, og -C(O)N(R₁₃)N(R₁₁)S(O)₂R₁₅;

hver R₂ er uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, eventuelt substituert C₁-C₆alkyl, -OR₂₀, -SR₂₀, -N(R₂₁)R₂₂, -C(O)R₂₀, -C(O)N(R₂₁)R₂₂ og -N(R₂₃)C(O)R₂₀;

R₃ er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, eventuelt substituert C₁-C₆alkyl, eventuelt substituert C₂-C₆alkenyl, eventuelt substituert C₂-C₆alkynyl, eventuelt substituert C₃-C₈sykloalkyl, eventuelt substituert aryl, eventuelt substituert -(C₁-

EP3373931

2

C₂alkylen)-(aryl), eventuelt substituert heteroaryl og eventuelt substituert -(C₁-C₂alkylen)-(heteroaryl);

5 R₁₀, R₁₃ og R₁₄ er hver uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydrogen, eventuelt substituert C₁-C₆alkyl, eventuelt substituert C₂-C₆alkenyl, eventuelt substituert C₂-C₆alkynyl, eventuelt substituert C₃-C₈sykloalkyl, eventuelt substituert aryl, eventuelt substituert -(C₁-C₂alkylen)-(aryl), eventuelt substituert C₂-C₉heterosykloalkyl, eventuelt substituert heteroaryl og eventuelt substituert -(C₁-C₂alkylen)-(heteroaryl);

10 R₁₁ og R₁₂ hver er uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydrogen, eventuelt substituert C₁-C₆alkyl, eventuelt substituert C₂-C₆alkenyl, eventuelt substituert C₂-C₆alkynyl, eventuelt substituert C₃-C₈sykloalkyl, eventuelt substituert aryl, eventuelt substituert -(C₁-C₂alkylen)-(aryl), eventuelt substituert C₂-C₉heterosykloalkyl, eventuelt substituert heteroaryl og eventuelt substituert -(C₁-C₂alkylen)-(heteroaryl); eller eventuelt danner R₁₁ og R₁₂ sammen med
15 nitrogenatomet til hvilket de er festet en eventuelt substituert C₂-C₉heterosykloalkylring;

R₁₅ er valgt fra gruppen bestående av eventuelt substituert C₁-C₆alkyl, eventuelt substituert C₂-C₆alkenyl, eventuelt substituert C₂-C₆alkynyl, eventuelt substituert C₃-C₈sykloalkyl, eventuelt substituert aryl, eventuelt substituert -(C₁-C₂alkylen)-(aryl), eventuelt substituert C₂-C₉heterosykloalkyl, eventuelt substituert heteroaryl og eventuelt substituert -(C₁-C₂alkylen)-(heteroaryl);
20

R₂₀ og R₂₃ hver er uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydrogen, eventuelt substituert C₁-C₆alkyl, eventuelt substituert C₂-C₆alkenyl, eventuelt substituert C₂-C₆alkynyl, eventuelt substituert C₃-C₈sykloalkyl, eventuelt substituert aryl, eventuelt substituert -(C₁-C₂alkylen)-(aryl), eventuelt substituert C₂-C₉heterosykloalkyl, eventuelt substituert heteroaryl og eventuelt substituert -(C₁-C₂alkylen)-(heteroaryl);
25

R₂₁ og R₂₂ hver er uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydrogen, eventuelt substituert C₁-C₆alkyl, eventuelt substituert C₂-C₆alkenyl, eventuelt substituert C₂-C₆alkynyl, eventuelt substituert C₃-C₈sykloalkyl, eventuelt substituert aryl, eventuelt substituert -(C₁-C₂alkylen)-(aryl), eventuelt substituert C₂-C₉heterosykloalkyl, eventuelt substituert heteroaryl og eventuelt substituert -(C₁-C₂alkylen)-(heteroaryl); eller eventuelt danner R₂₁ og R₂₂ sammen med
30

EP3373931

3

nitrogenatomet til hvilket de er festet en eventuelt substituert C₂-C₉heterosykloalkylring;

n er 0-4; og

p er 1

5

2. Forbindelsen ifølge krav 1 eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav, hvori hver R₁ er uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydrogen, halogen, eventuelt substituert C₁-C₆alkyl, -CF₃, -OR₁₀, -N(R₁₁)R₁₂, -C(O)R₁₄, -C(O)OR₁₀ og -C(O)N(R₁₁)R₁₂.

10

3. Forbindelsen ifølge krav 1 eller krav 2 eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav, hvori hver R₁ er uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydrogen, halogen og -CF₃.

15

4. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-3 eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav, hvori hver R₂ er uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, eventuelt substituert C₁-C₆alkyl, -OR₂₀ og -N(R₂₁)R₂₂.

20

5. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-4 eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav, hvori hver R₂ er uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen og eventuelt substituert C₁-C₆alkyl.

25

6. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-5 eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav, hvori R₃ er valgt fra gruppen bestående av hydrogen og eventuelt substituert C₁-C₆alkyl.

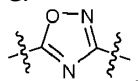
25

7. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-6 eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav, hvori:



30

er



EP3373931

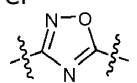
4

8. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-6 eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav, hvori:



5

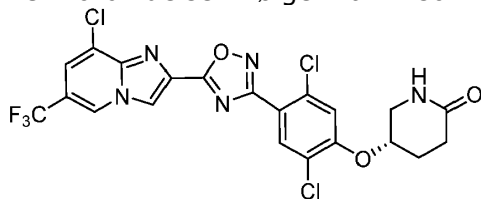
er



9. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-8 eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav, hvori n er 1 eller 2.

10

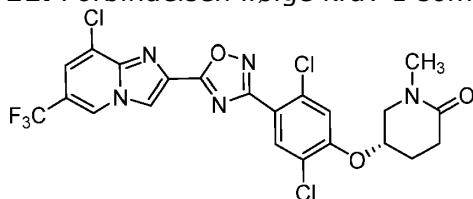
10. Forbindelsen ifølge krav 1 som er:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav.

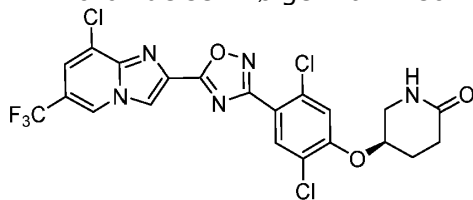
15

11. Forbindelsen ifølge krav 1 som er:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav.

12. Forbindelsen ifølge krav 1 som er:



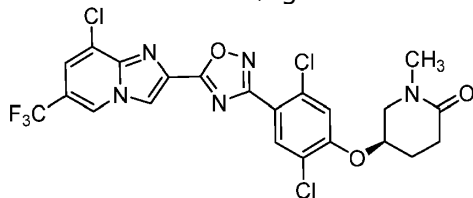
20

eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav.

EP3373931

5

13. Forbindelsen ifølge krav 1 som er:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav.

5 **14.** Farmasøytisk sammensetning omfattende en/et farmasøytisk akseptabel(t) tynner, eksipient eller bindemiddel og en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-13 eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav.

10 **15.** Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-13 eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav, for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av multippel sklerose, ulcerøs kolitt eller Crohns sykdom.