



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3388064 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/4439 (2006.01)
A61P 25/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.05.03
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.03.10
(86)	European Application Nr.	18173541.6
(86)	European Filing Date	2015.04.01
(87)	The European Application's Publication Date	2018.10.17
(30)	Priority	2014.04.02, EP, 14382130
(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	EP3125888, 2015.04.01
(73)	Proprietor	Minoryx Therapeutics S.L., Av. Ernest Lluch 32, 08302 Mataró, Barcelona, Spania
(72)	Inventor	GARCÍA COLLAZO, Ana María, MINORYX THERAPEUTICS S.L.Av. Ernest Lluch 32, TCM2, E-08302 Mataró, Barcelona, Spania ECKLAND, David John Augustus, 17 Berceau Walk, Watford, Hertfordshire WD17 3BL, Storbritannia PIZCUETA LALANZA, Maria Pilar, MINORYX THERAPEUTICS S.L.Av. Ernest Lluch 32, TCM2, E-08302 Mataró, Barcelona, Spania MARTINELL PEDEMONTE, Marc, MINORYX THERAPEUTICS S.L.Av. Ernest Lluch 32, TCM2, E-08302 Mataró, Barcelona, Spania
(74)	Agent or Attorney	Nordic Patent Service A/S, Bredgade 30, 1260 KØBENHAVN K, Danmark

(54)	Title	2,4-THIAZOLIDINEDIONE DERIVATIVES IN THE TREATMENT OF CENTRAL NERVOUS SYSTEM DISORDERS
(56)	References Cited:	US-A1- 2013 274 295 WO-A1-92/18501 WO-A1-2014/152843 WO-A1-2013/040419

SUNDARARAJAN S ET AL: "PPARgamma as a therapeutic target in central nervous system diseases", NEUROCHEMISTRY INTERNATIONAL, PERGAMON PRESS, OXFORD, GB, vol. 49, no. 2, 1 July 2006 (2006-07-01), pages 136-144, XP027957978, ISSN: 0197-0186 [retrieved on 2006-07-01]

TOSHIMASA ITOH ET AL: "Peroxisome proliferator activated receptor δ and oxidized docosahexaenoic acids as new class of ligand", NAUNYN-SCHMIEDEBERG'S ARCHIVES OF PHARMACOLOGY, SPRINGER, BERLIN, DE, vol. 377, no. 4-6, 8 January 2008 (2008-01-08), pages 541-547, XP019620914, ISSN: 1432-1912

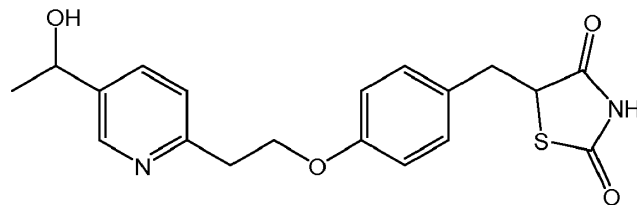
STÉPHANE FOURCADE ET AL: "Mitochondrial dysfunction and oxidative damage cooperatively fuel axonal degeneration in X-linked adrenoleukodystrophy", BIOCHIMIE, vol. 98, 1 March 2014 (2014-03-01), pages 143-149, XP055118520, ISSN: 0300-9084, DOI: 10.1016/j.biochi.2013.09.012

SOHDA T ET AL: "STUDIES ON ANTIDIABETIC AGENTS. XII. SYNTHESIS AND ACTIVITY OF THE METABOLITES OF (PLUS OR MINUS)-5- α -2-(5-ETHYL-2-PYRIDYL)ETHOXY-2,4-THIAZOLIDINEDIONE (PIOGLITAZONE)", CHEMICAL AND PHARMACEUTICAL BULLETIN, PHARMACEUTICAL SOCIETY OF JAPAN, JP, vol. 43, no. 12, 1 December 1995 (1995-12-01), pages 2168-2172, XP008057606, ISSN: 0009-2363

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. Forbindelse av formel (1) eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse ved behandling eller forebygging av en lidelse i sentralnervesystemet



(1),

hvor i lidelsen i sentralnervesystemet er valgt fra gruppen som består av Friedreichs ataksi, en hjerneskade, en sjelden metabolsk sykdom, global eller lokal iskemi, intracerebral blødning, hjerneslag, vaskulær demens, meningitt forårsaket av virusinfeksjon i nervesystemet, encefalitt forårsaket av virusinfeksjon i nervesystemet, og en metastase av en primær
hjernesvulst.

2. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 1, valgt fra forbindelsene (2) til (5):

(2) (R)-5-(4-(2-(5-((R)-1-hydroksyetyl)pyridin-2-yl)etoksy)benzyl)thiazolidin-2,4-dion;

(3) (R)-5-(4-(2-(5-((S)-1-hydroksyetyl)pyridin-2-yl)etoksy)benzyl)thiazolidin-2,4-dion;

(4) (S)-5-(4-(2-(5-((R)-1-hydroksyetyl)pyridin-2-yl)etoksy)benzyl)thiazolidin-2,4-dion;

og

(5) (S)-5-(4-(2-(5-((S)-1-hydroksyetyl)pyridin-2-yl)etoksy)benzyl)thiazolidin-2,4-dion;

eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

3. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 1 eller 2, hvor i ikke mer enn 0,015 % av det totale antallet hydrogenatomer pr. mol forbindelse er i form av ^2H -isotopen.

4. Blanding av to eller flere av forbindelsene valgt fra forbindelsene (2) til (5):

(2) (R)-5-(4-(2-(5-((R)-1-hydroksyetyl)pyridin-2-yl)etoksy)benzyl)thiazolidin-2,4-dion;

(3) (R)-5-(4-(2-(5-((S)-1-hydroksyetyl)pyridin-2-yl)etoksy)benzyl)thiazolidin-2,4-dion;

(4) (S)-5-(4-(2-(5-((R)-1-hydroksyetyl)pyridin-2-yl)etoksy)benzyl)thiazolidin-2,4-dion;

og

(5) (S)-5-(4-(2-(5-((S)-1-hydroksyetyl)pyridin-2-yl)etoksy)benzyl)thiazolidin-2,4-dion;

eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav,

for anvendelse ved behandling eller forebygging av en lidelse i sentralnervesystemet, hvori lidelsen er valgt fra gruppen som består av Friedreichs ataksi, en hjerneskade, en sjelden metabolsk sykdom, global eller lokal iskemi, intracerebral blødning, hjerneslag, vaskulær demens, hjernehinnebetennelse forårsaket av virusinfeksjon i nervesystemet, encefalitt
5 forårsaket av virusinfeksjon i nervesystemet, og en metastase av en primær hjernesvulst.

5. Blandingen for anvendelse ifølge krav 4, valgt fra gruppen som består av:

(a) blandinger omfattende forbindelsene **(2)** og **(3)**;

(b) blandinger omfattende forbindelsene **(4)** og **(5)**;

10 (c) blandinger omfattende forbindelsene **(2)** og **(4)**; og

(d) blandinger omfattende forbindelsene **(3)** og **(5)**.

6. Forbindelsen eller blandingen av forbindelser for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–5, hvori lidelsen er Friedreichs ataksi.

15

7. Forbindelsen eller blandingen av forbindelser for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–5, hvori lidelsen i sentralnervesystemet er en sjelden metabolsk sykdom.

8. Forbindelsen eller blandingen av forbindelser for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–7, hvori et annet terapeutisk middel også administreres.

20

9. Forbindelsen eller blandingen av forbindelser for anvendelse ifølge krav 8, hvori forbindelsen eller blandingen av forbindelser og det andre terapeutiske midlet tilveiebringes i kombinasjon.

25

10. Forbindelsen eller blandingen av forbindelser for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–9, hvori forbindelsen eller blandingen av forbindelser tilveiebringes i en farmasøytisk sammensetning, slik som en oral form av den farmasøytiske sammensetningen.

30 11. Forbindelsen eller blandingen av forbindelser for anvendelse ifølge krav 10, hvori den orale formen er en oral løsning eller en oral suspensjon; eller den orale formen velges fra gruppen som består av tabletter, kapsler, piller og granuler.

12. Forbindelsen eller blandingen av forbindelser for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 9–11, hvori forbindelsen eller blandingen av forbindelser i den farmasøytiske sammensetningen er i en dosering på fra 0,1 mg til 200 mg eller fra 10 mg til 100 mg.

- 5 **13.** Forbindelsen eller blandingen av forbindelser for anvendelse ifølge krav 9, hvori den farmasøytiske sammensetningen er egnet for topisk, epikutan, subkutan, transdermal, intramuskulær, parenteral, okulær, rektal, vaginal, inhalasjon, bukkal, sublingual eller intranasal levering, slik som en sublingual doseringsform.