



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3464336 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

C07K 5/065 (2006.01)

A61K 38/00 (2006.01)

A61K 38/22 (2006.01)

C07K 5/02 (2006.01)

C07K 5/06 (2006.01)

C07K 14/475 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

- (45) Translation Published 2022.06.20
- (80) Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent 2022.03.16
- (86) European Application Nr. 17807519.8
- (86) European Filing Date 2017.06.01
- (87) The European Application's Publication Date 2019.04.10
- (30) Priority 2016.06.01, US, 201662344305 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 Athira Pharma, Inc., 18706 North Creek Parkway, Suite 104, Bothell, WA 98011, USA
- (72) Inventor KAWAS, Leen, H., c/o M3 Biotechnology Inc. 4000 Mason Road Suite 300 Box 352141, Seattle WA 98195, USA
SINGH, Jasbir, c/o M3 Biotechnology Inc. 4000 Mason Road Suite 300 Box 352141, Seattle WA 98195, USA
STEWART, Lansing Joseph, c/o M3 Biotechnology Inc. 4000 Mason Road Suite 300 Box 352141, Seattle WA 98195, USA
BAKER, William, R., c/o M3 Biotechnology Inc. 4000 Mason Road Suite 300 Box 352141Seattle, WA 98195, USA
- (74) Agent or Attorney CURO AS, Vestre Rosten 81, 7075 TILLER, Norge
-

(54) Title **COMPOUNDS**

(56) References

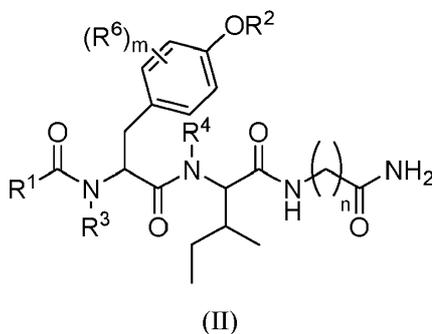
Cited:

US-A1- 2014 051 633, US-A1- 2013 165 392, US-A1- 2005 118 643, WO-A1-97/08193, US-A1- 2005 214 859
JIN-MI NOH ET AL: "Kojic acid-tripeptide amide as a new tyrosinase inhibitor", BIOPOLYMERS, vol. 88, no. 2, 1 January 2007 (2007-01-01), pages 300-307, XP55649603, US ISSN: 0006-3525, DOI: 10.1002/bip.20670
DATABASE PUBCHEM [Online] 04 December 2007 XP055447500 Database accession no. 18232021
DEBORAH HEYL ET AL: "Peptide Inhibitors of a-Amylase Based on Tendamistat: Development of Analogues with [pi]-Amino Acids Linking Critical Binding Segments", PROTEIN AND PEPTIDE LETTERS: INTERNATIONAL JOURNAL FOR RAPID PUBLICATION OF SHORT PAPERS IN PROTEIN AND PEPTIDE SCIENCE, vol. 12, no. 3, 1 April 2005 (2005-04-01), pages 275-280, XP55649610, NL ISSN: 0929-8665, DOI: 10.2174/0929866053587110
GHOSH ET AL.: 'Organic Carbamates in Drug Design and Medicinal Chemistry' JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY vol. 58, 07 January 2015, pages 2895 - 2940, XP055425367

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 med formel II:



hvor:

- 5 n er 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, eller 9;
- m er 0, 1, 2, 3, eller 4;
- R¹ er valgt fra gruppen bestående av: C₁-C₁₂ alkyl, C₁-C₁₂ substituert alkyl, C₁-C₁₂ alkenyl, C₁-C₁₂ substituert alkenyl, C₁-C₁₂ alkynyl, og C₁-C₁₂ substituert alkynyl;
- R² er valgt fra gruppen bestående av: hydrogen, $\frac{1}{2}$ PO(OY)₂, $\frac{1}{2}$ PO(OH)₂, -C(=O)-Y og -CO-U;
- 10 Y er -Z-(CH₂)_q-W-R^b, eller alternativt -C(=O)-Y danner en amidbinding gjennom et nitrogenatom på Y hvori i hvert tilfelle Y er valgt fra gruppen bestående av: glysin, sarcosin, N,N-dimetylglysin, alanin, valin, leucin, isoleucin, lysin, ornitin, arginin, serin og threonin;
- q er 0-4;
- 15 Z og W er uavhengig valgt fra gruppen bestående av: CH₂, O, S, NR^c og R^b, hvori valgfritt Z og W er tatt sammen for å danne et C₃-C₈ heterosykloalkyl eller C₄-C₁₀ heteroaryl eller bisyklisk ringsystem hvori én av ringene er et C₄-C₁₀ heteroaryl;
- R^c er valgt fra gruppen bestående av: hydrogen, C₁-C₄ alkyl, og C₃-C₆ sykloalkyl;
- R^b er valgt fra gruppen bestående av: hydrogen, C₁-C₁₂ alkyl, C₁-C₁₂ substituert alkyl, C₃-C₈ sykloalkyl, C₃-C₈ substituert sykloalkyl, C₃-C₈ heterosykloalkyl, og C₃-C₈ substituert heterosykloalkyl;
- 20 U er valgt fra gruppen bestående av: pyridin, 1,4-dihydropyridin, N-alkyl-1,4-dihydropyridin, og C-imidazol, eller U er valgt fra aryl, heteroaryl eller heterosykloalkyl;
- R³ og R⁴ sammen er bundet for å danne et spiroyklisk ringsystem;

hver R^6 er uavhengig valgt fra gruppen bestående av: hydrogen, deuterium, CH_3 , F, ^{19}F , og ^{18}F ;

og hvori hver heterosyklisk og heteroaryl ring inneholder opptil fire heteroatomer valgt fra gruppen bestående av: O, N, og S;

5 forutsatt at når både Z og W er heteroatomer, kan ikke verdien av q være 1;

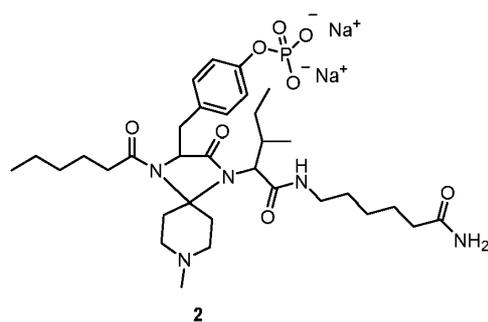
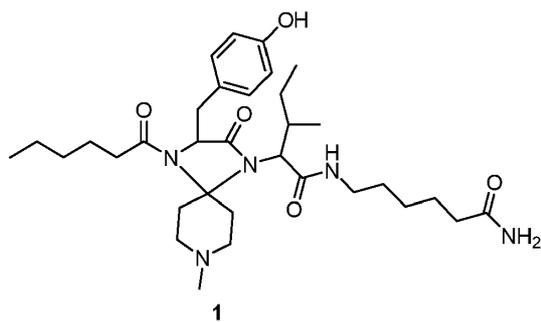
eller en tautomer og/eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

2. Forbindelse ifølge krav 1, hvor m er 0, R^1 er C_1 - C_{12} alkyl, og R^3 og R^4 sammen danner et spiroyklisk ringsystem.

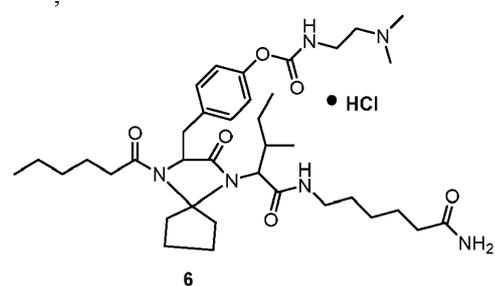
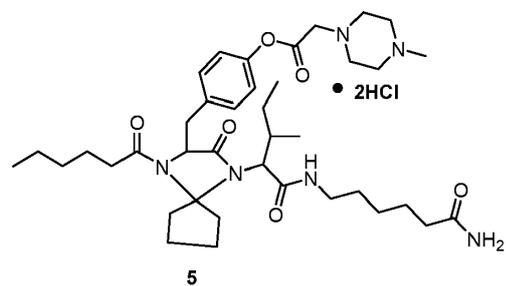
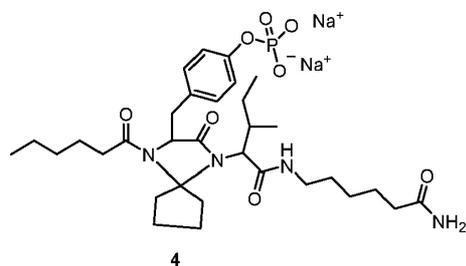
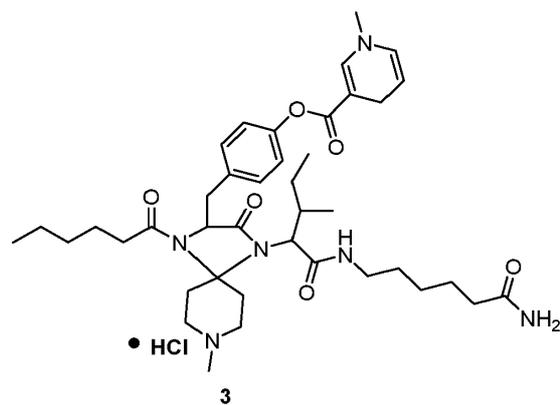
10 3. Forbindelse ifølge krav 1, hvor m er 1 eller 2, R^1 er C_1 - C_{12} alkyl, R^3 og R^4 sammen danner et spiroyklisk ringsystem, og R^6 er valgt fra gruppen bestående av: hydrogen, deuterium, F, ^{19}F , og ^{18}F .

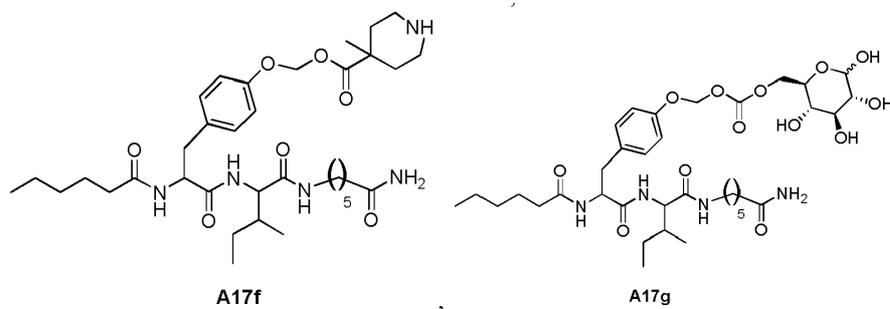
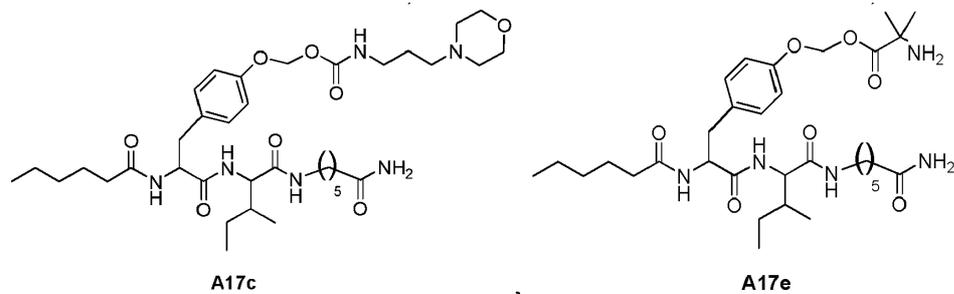
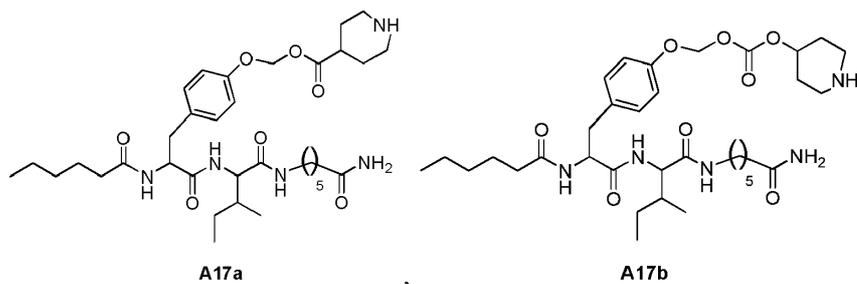
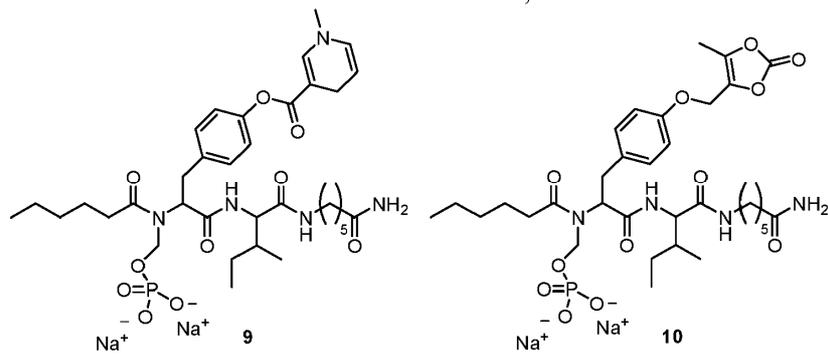
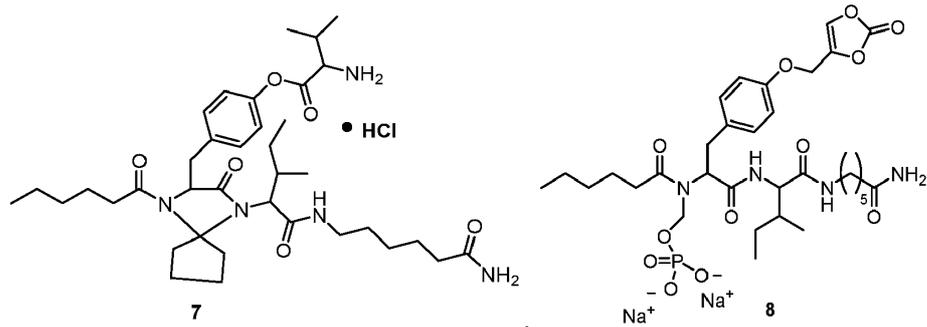
4. Forbindelse valgt fra de følgende strukturene:

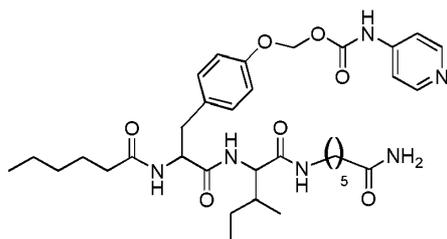
3



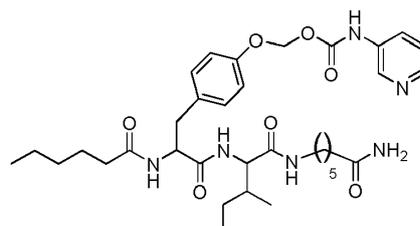
2



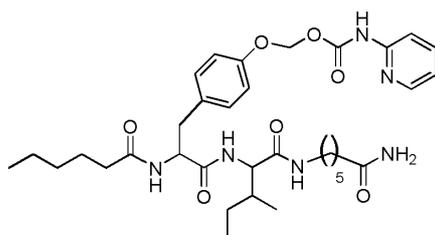




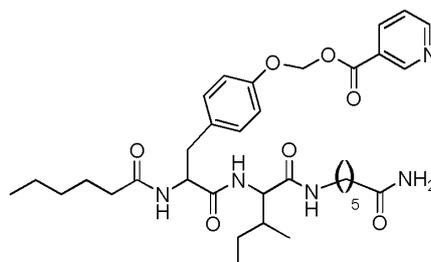
A17h



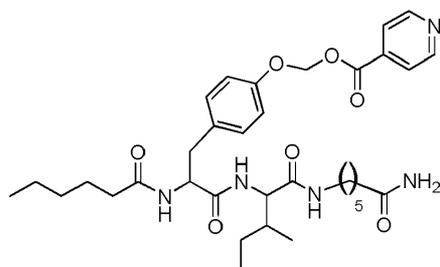
A17i



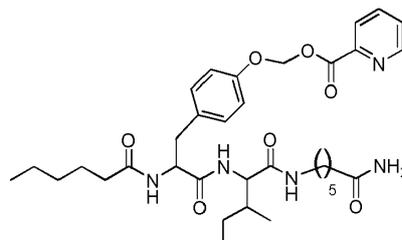
A17j



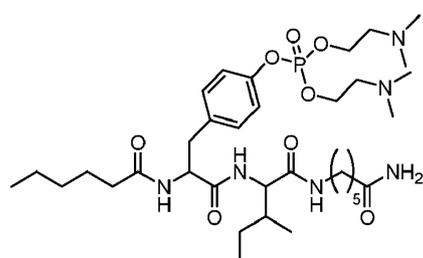
A17k



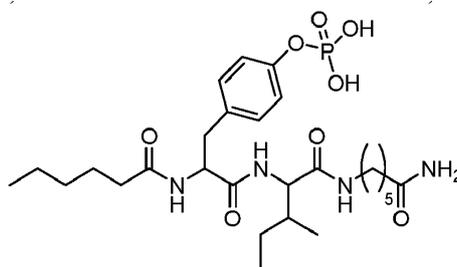
A17l



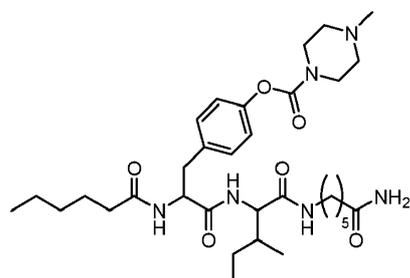
A17m



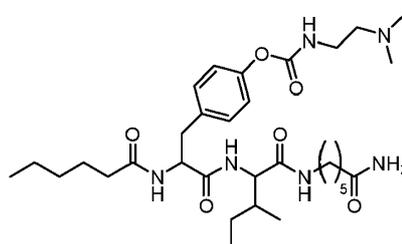
A18



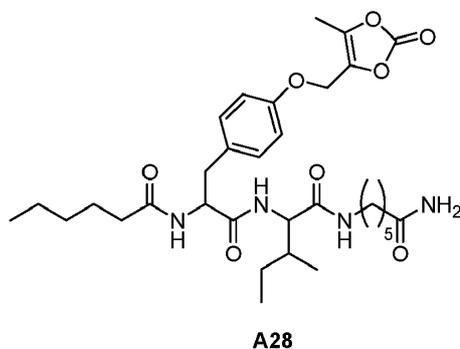
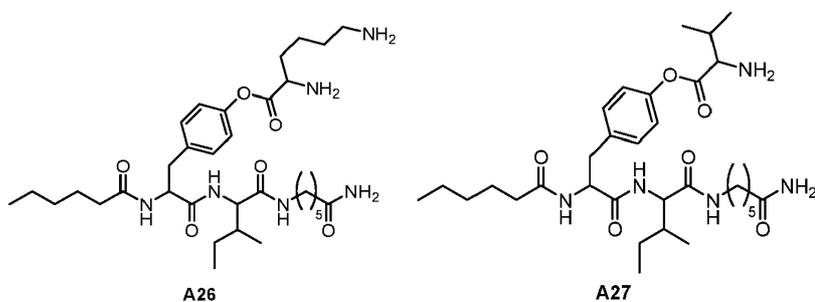
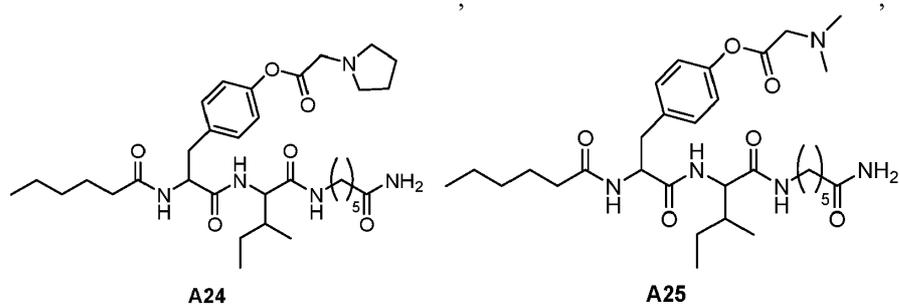
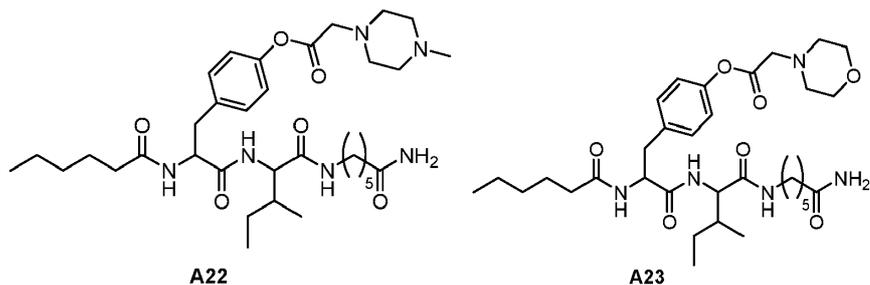
A19



A20



A21



- 5 eller en tautomer og/eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.
5. Blanding som omfatter i det minste én forbindelse som vist ifølge ett av kravene 1 - 4, eller tautomerer, stereoisomerer, salter, oppløsninger eller hydrater av samme.
6. Farmasøytisk blanding som omfatter minst én forbindelse som vist i ifølge ett av kravene 1 - 4, eller tautomerer, stereoisomerer, salter, oppløsninger eller hydrater av samme, og en farmasøytisk akseptabel bærer eller et hjelpestoff.
- 10 7. Farmasøytisk blanding ifølge krav 6, som videre omfatter N-heksano-L-tyrosin-L-isoleucin-(6)-aminoheksano-syre.

8. Forbindelse ifølge ett av kravene 1-4, eller en farmasøytisk blanding ifølge krav 6 eller 7, for anvendelse i en framgangsmåte for behandling av en neurodegenerativ sykdom.
9. Forbindelse ifølge ett av kravene 1-4, eller en farmasøytisk blanding ifølge krav 6 eller 7, for anvendelse ifølge krav 8, hvori den neurodegenerative sykdommen er valgt fra gruppen bestående
- 5 av: Alzheimers sykdom, Parkinsons sykdom, amyotrofisk sidesklerose, annen demens og neurodegenerative sykdommer, ryggmargskade, traumatisk hjerneskade, sensorineural hørselsnedsettelse og synstap, fortrinnsvis Alzheimers sykdom eller Parkinsons sykdom.