

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

PATENTTI- JA REKISTERIHALLITUS
PATENT- OCH REGISTERSTYRELSEN
FINNISH PATENT AND REGISTRATION OFFICE

(10)

FI/EP3595665 T3

(12)

**EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION**

(45)

Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning -
Translation available to the public

18.11.2024

(97)

Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för
det europeiska patentet - Date of grant of European patent

28.08.2024

(51)

Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -
International patent classification
A61K 31/497 (2006 . 01)
C07D 295/205 (2006 . 01)
C07D 401/02 (2006 . 01)
C07D 471/10 (2006 . 01)

(96)

Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan -
European patent application

EP18768237.2

(22)

Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date

12.03.2018

(97)

Patenttihakemuksen julkiseksitulosopäivä - Patentansökans
publiceringsdag - Patent application available to the public

22.01.2020

(86)

Kansainvälinen hakemus - Internationell
ansökan - International application

12.03.2018 PCT/US2018022049

(30)

Etuoikeus - Prioritet - Priority

13.03.2017 US US201762470830 P

(73)

Haltija - Innehavare - Holder

1• Lundbeck La Jolla Research Center, Inc., 251 Little Falls Drive , Wilmington, New Castle County, DE 19808 , (US)

(72)

Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1• GRICE, Cheryl A., 10835 Road to the Cure Suite 250 , San Diego, California 92121 , (US)

2• CISAR, Justin S., 10835 Road to the Cure Suite 250 , San Diego, California 92121 , (US)

3• DUNCAN, Katharine K., 10835 Road to the Cure Suite 250 , San Diego, California 92121 , (US)

4• FENG, Yu, 10835 Road to the Cure Suite 250 , San Diego, California 92121 , (US)

5• WIENER, John J. M., 10835 Road to the Cure Suite 250 , San Diego, California 92121 , (US)

6• WEBER, Olivia D., 10835 Road to the Cure Suite 250 , San Diego, California 92121 , (US)

(74)

Asiamies - Ombud - Agent

Kolster Oy Ab, Salmisaarenaukio 1 , 00180 Helsinki , (FI)

(54)

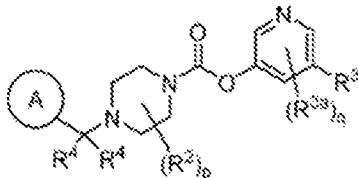
Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

MAGL:N JA FAAH:N KAKSOISESTÄJIÄ

DUAL MAGL AND FAAH INHIBITORS

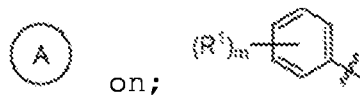
PATENTTIVAATIMUKSET

1. Yhdiste, jolla on kaavan (I) mukainen rakenne:



5 Kaava (I);

jossa:



10

15

20

25

30

kukin R^1 valitaan toisista riippumattomasti C_2 -alkynyylistä, C_{1-6} -alkyyli- OR^7 :stä, C_{3-8} -sykloalkyylistä, $-NR^5R^6$:sta, OR^7 :stä, $-SO_2R^{12}$:sta, $-SF_5$:stä, $-SR^8$:sta, aryylistä ja heteroaryylistä, jossa aryyli ja heteroaryyli substituoidaan yhdellä tai kahdella ryhmällä, jotka toisistaan riippumattomasti valitaan $-C(O)NR^8R^9$:stä; tai kaksi vierekkäistä R^1 :tä muodostaa heterosykloalkyylirenkaan, joka on valinnaisesti substituoitu yhdellä tai kahdella R^{11} :llä;

R^2 on C_{1-6} -alkyyli;

R^3 valitaan halogeenista, $-CN$:sta, C_{1-6} -alkyylistä, C_{1-6} -haloalkyylistä, $-NR^8R^9$:stä, $-C(O)NR^8R^9$:stä, $-NR^8C(O)R^9$:stä ja $-NR^9SO_2R^8$:sta; R^{3a} valitaan halogeenista, C_{1-6} -alkyylistä ja C_{1-6} -haloalkyylistä;

kukin R^4 valitaan toisista riippumattomasti H:stä ja C_{1-6} -alkyylistä;

kukin R^5 ja R^6 valitaan toisista riippumattomasti H:stä, C_{1-6} -alkyylistä ja C_{3-8} -sykloalkyylistä; tai R^5 ja R^6 yhdessä sen tyyden, johon ne

- ovat kiinnittyneet, kanssa muodostavat heterosykloalkyylin, joka on valinnaisesti substituoitu yhdellä tai kahdella R^{10} :llä;
- 5 kukin R^7 valitaan toisista riippumattomasti H:stä, C_{1-6} -alkyyli-O- C_{1-6} -alkyylistä, C_{1-6} -haloalkyylistä, C_{3-8} -sykloalkyylistä, heterosykloalkyylistä, aryylistä ja heteroaryylistä, jossa heterosykloalkyyli, aryyli ja heteroaryyli substituoidaan valinnaisesti yhdellä tai
- 10 kahdella ryhmällä, jotka toisistaan riippumattomasti valitaan halogeenista, C_{1-6} -alkyylistä ja C_{1-6} -haloalkyylistä;
- kukin R^8 ja R^9 valitaan toisista riippumattomasti H:stä, C_{1-6} -alkyylistä, C_{3-8} -sykloalkyylistä, aryylistä ja heteroaryylistä;
- 15 kukin R^{10} valitaan toisista riippumattomasti C_{1-6} -alkyylistä, C_{3-8} -sykloalkyylistä, C_{1-6} -haloalkyylistä, halogeenista, oksosta, -CN:sta, -C(O)OR⁸:sta, -C(O)R⁸:sta, -C(O)NR⁸R⁹:stä, -SO₂R⁸:sta, -NR⁹C(O)R⁸:sta ja -NR⁹SO₂R⁸:sta;
- 20 kukin R^{11} valitaan toisista riippumattomasti halogeenista ja C_{1-6} -alkyylistä;
- kukin R^{12} valitaan toisista riippumattomasti C_{1-6} -alkyylistä ja C_{3-8} -sykloalkyylistä;
- 25 m on 1, 2, 3, 4 tai 5;
- p on 1; ja
- q on 0 tai 1;
- tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, solvaatti, isotooppileimattu muoto tai stereoisomeeri.
- 30 2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, solvaatti, isotooppileimattu muoto tai stereoisomeeri, jossa kukin R^4 on H.
- 35 3. Patenttivaatimuksen 1 tai 2 mukainen yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola,

solvaatti, isotooppileimattu muoto tai stereoisomeeri, jossa R^2 on $-CH_3$.

4. Jonkin patenttivaatimuksista 1 - 3 mukainen yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, solvaatti, isotooppileimattu muoto tai stereoisomeeri, jossa m on 1 tai 2.

5. Jonkin patenttivaatimuksista 1 - 4 mukainen yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, solvaatti, isotooppileimattu muoto tai stereoisomeeri, jossa R^3 on C_{1-6} -haloalkyyli, $-CF_3$, halogeeni, $-C(O)NH_2$ tai $-CN$.

6. Jonkin patenttivaatimuksista 1 - 5 mukainen yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, solvaatti, isotooppileimattu muoto tai stereoisomeeri, jossa q on 0.

7. Jonkin patenttivaatimuksista 1 - 5 mukainen yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, solvaatti, isotooppileimattu muoto tai stereoisomeeri, jossa q on 1.

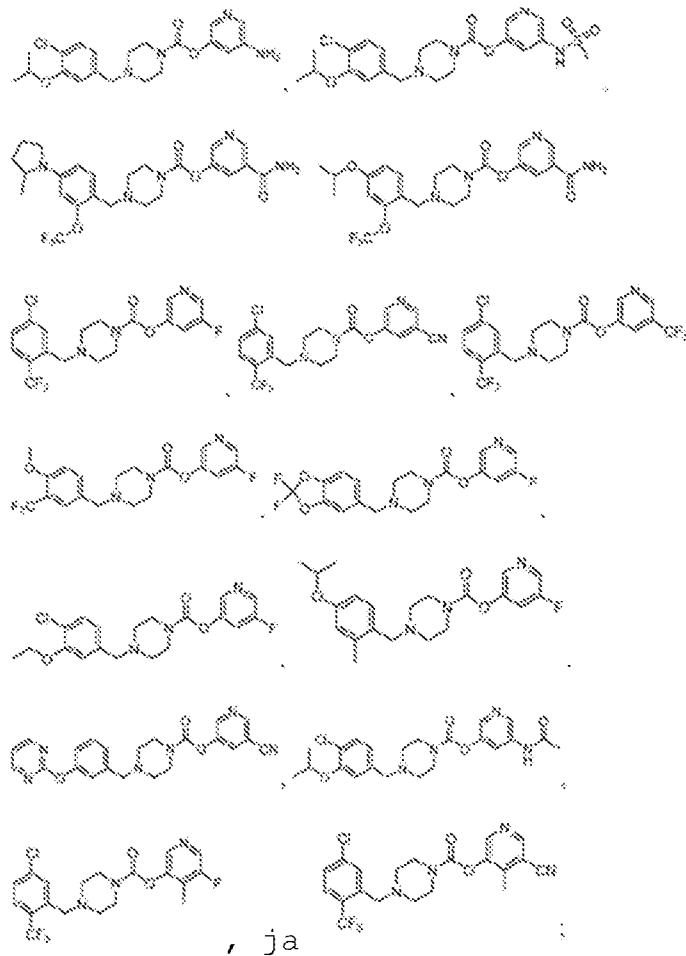
8. Jonkin patenttivaatimuksista 1 - 7 mukainen yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, solvaatti, isotooppileimattu muoto tai stereoisomeeri, jossa kukin R^1 valitaan toisista riippumattomasti $-OR^7$:stä.

9. Jonkin patenttivaatimuksista 1 - 8 mukainen yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, solvaatti, isotooppileimattu muoto tai stereoisomeeri, jossa R^7 valitaan toisista riippumattomasti C_{1-6} -haloalkyylistä, C_{3-8} -sykloalkyylistä, aryylistä ja heteroaryylistä.

10. Jonkin patenttivaatimuksista 1 - 9 mukainen yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, solvaatti, isotooppileimattu muoto tai stereoisomeeri, jossa R^7 valitaan toisista riippumattomasti aryylistä ja C_{1-6} -haloalkyylistä.

11. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, joka valitaan seuraavista:

12. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste,
joka valitaan seuraavista:



tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, solvaatti, isotooppileimattu muoto tai stereoisomeeri.

- 5 13. Farmaseuttinen koostumus, joka käsittää aktiivisena aineosana vaikuttavan määrän jonkin patenttivaatimuksista 1 - 12 mukaista yhdistettä tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävää suolaa, solvaattia, isotooppileimattua muotoa tai stereoisomeeriä; ja vähintään yhtä farmaseuttisesti hyväksyttävää apuainetta.

- 10 14. Jonkin patenttivaatimuksista 1 - 12 mukainen yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, solvaatti, isotooppileimattu muoto tai stereoisomeeri, tai patenttivaatimuksen 13 mukainen farmaseuttinen koostumus käytettäväksi menetelmässä kivun hoitamiseksi potilaalla.

- 15 15. Jonkin patenttivaatimuksista 1 - 12 mukainen yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, solvaatti, isotooppileimattu muoto tai stereoisomeeri,

tai patenttivaatimuksen 13 mukainen farmaseuttinen koostumus käytettäväksi menetelmässä neurologisen häiriönhoitamiseksi potilaalla.