



(12) Translation of
european patent specification

(11) NO/EP 2491029 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 405/10 (2006.01)
A61K 31/70 (2006.01)
A61P 3/10 (2006.01)
C07D 407/10 (2006.01)
C07D 413/10 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2016.05.18
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2016.02.10
(86)	European Application Nr.	10768927.5
(86)	European Filing Date	2010.10.19
(87)	The European Application's Publication Date	2012.08.29
(30)	Priority	2009.10.20, IN, DE21732009 2009.12.23, IN, DE26892009
(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
(73)	Proprietor	Novartis AG, Lichtstrasse 35, 4056 Basel, CH-Sveits
(72)	Inventor	BEBERNITZ, Gregory, Raymond, Novartis Institutes for BioMedical Research Inc.100 Technology Square, Cambridge, MA 02139, US-USA BOCK, Mark, G., Novartis Institutes for BioMedical Research Inc.250 Massachusetts Avenue, Cambridge, MA 02139, US-USA REDDY, Dumbala Srinivas, Alpha 605, Jayabheri Silicon County, Hi-Tec City Road Kondapur, Hyderabad, Andhra Pradesh 500 032, IN-India HAJARE, Atul Kashinath, Plot No. 28, Sadik Mala, Mali Lane Bhingar, Ahmednagar, Maharashtra 414 002, IN-India VYAVAHARE, Vinod, Advinus Therapeutics (P) Limited, of 21 and 22 Phase II, Peenya Industrial Area, Bangalore 560 058, IN-India BHOSALE, Sandeep Bhausaheb, 1385 Sambhajinagar (HUDCO)A/P&Tal. : Shirur, Pune, Maharashtra 412 210, IN-India KURHADE, Suresh Eknath, Lawanwadi, Post Ale, Tal. Junnar, Pune, Maharashtra 412 411, IN-India SALUNKHE, Videsh, Advinus Therapeutics (P) Limited, of 21 and 22 Phase II, Peenya Industrial Area, Bangalore 560 058, IN-India SHAIKH, Nadim, S., Advinus Therapeutics (P) Limited, of 21 and 22 Phase II, Peenya Industrial Area, Bangalore 560 058, IN-India BHUNIYA, Debnath, Post Khalisani, Howrah, West Bengal 711 037, IN-India PALLE, P., Venkata, 24 Gera Green Ville, Survey No. 64 Kharadi, Pune, Maharashtra 411 014, IN-India FENG, Lili, Novartis Pharmaceuticals Corporation, One Health Plaza, Bldg. 436, East Hanover, NJ 07936-1080, US-USA LIANG, Jessica, Novartis Pharmaceuticals Corporation, One Health Plaza, East Hanover, NJ 07936-1080, US-USA
(74)	Agent or Attorney	Zacco Norway AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

(56) References

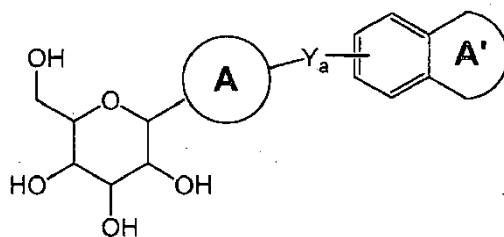
Cited:

EP-A1- 1 609 785
EP-A1- 1 803 721
WO-A1-01/27128
JP-A- 2001 288 178

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. Forbindelsen, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, representert av Formel (V):

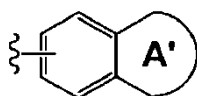


(V)

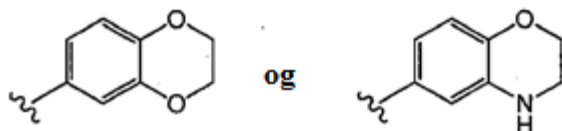
hvor:

ring A er fenyl som er substituert med én substituent valgt fra halo, C₁₋₄alkyl, og C₃₋₇sykloalkyl; hvori Y_a er situert *meta* til tetrahydropyranringen og den ene substituenten er situert *para* til tetrahydropyranringen;

strukturen er representert ved følgende formel:

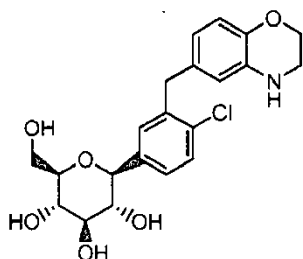


er valgt fra gruppen bestående av:



og Y_a er CH₂.

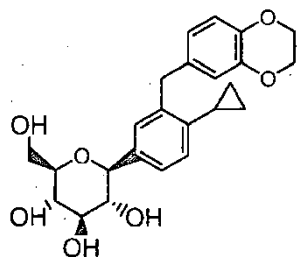
2. Forbindelsen ifølge krav 1 representert ved den følgende formelen:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

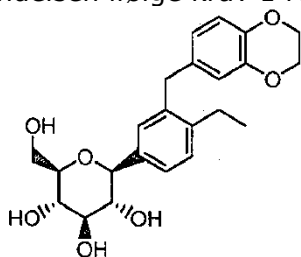
3. Forbindelsen ifølge krav 1 representert ved den følgende formelen:

2



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

4. Forbindelsen ifølge krav 1 representert ved den følgende formelen:



5

eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

5. Farmasøytisk sammensetning omfattende en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og et farmasøytisk akseptabelt hjelpestoff.

10

6. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse i terapi.

15

7. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse i behandling av diabetes.

8. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 7, hvori diabetes er type I-diabetes.

20

9. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 7, hvori diabetes er type II-diabetes.

10. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse i behandling av fedme.

25

11. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse i behandling av en sykdom eller tilstand mediert av natrium D-glukose kotransporter i et pattedyr, hvori sykdommen eller tilstanden er valgt fra gruppen bestående av diabetes,

syndrom X, insulinresistens, svekket glukosetoleranse, dyslipidemi, fedme, hypertensjon, mikroalbuminemi, hyperurikaemi og hyperkoagubilitet.

5 **12.** Farmasøytisk sammensetning omfattende en terapeutisk effektiv mengde av
en forbindelse av formel (V) ifølge hvilke som helst av kravene 1 til 4 i
kombinasjon med en terapeutisk effektiv mengde av insulin, insulinderivat eller
mimetika; insulinsekretagog; insulinotropisk sulfonylurea-reseptorligand; PPAR-
ligand; insulinsensibilisator; biguanider; alfa-glukosidaseinhibitorer; GLP-1, GLP-
1-analog eller mimetika; DPPIV-inhibitor; HMG-CoA reduktaseinhibitorer;
10 skvalen syntaseinhibitor; FXR- eller LXR-ligand; kolestyramin; fibrater;
nikotinsyre; eller aspirin.

15 **13.** Produkt omfattende en forbindelse med formel (V) ifølge hvilke som helst av
kravene 1 til 4 og et middel valgt fra gruppen bestående av insulin,
insulinderivat eller mimetika; insulinsekretagog; insulinotropisk sulfonylurea-
reseptorligand; PPAR-ligand; insulinsensibilisator; biguanid; alfa-glukosidase
inhibitorer; GLP-1, GLP-1-analog eller -mimetika; DPPIV-inhibitor; HMG-CoA-
reduktase inhibitor; skvalen syntaseinhibitor; FXR- eller LXR-ligand;
kolestyramin; fibrater; nikotinsyre, og aspirin for samtidig, separat eller
20 sekvensiell anvendelse i terapi.