



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2683244 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 401/14 (2006.01)
A61K 31/4427 (2006.01)
A61P 31/12 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)
C07D 401/06 (2006.01)
C07D 401/10 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01)
C07D 405/10 (2006.01)
C07D 405/12 (2006.01)
C07D 405/14 (2006.01)
C07D 413/10 (2006.01)
C07D 471/04 (2006.01)
C07D 487/04 (2006.01)
C07D 491/048 (2006.01)
C07D 491/052 (2006.01)
C07D 491/10 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

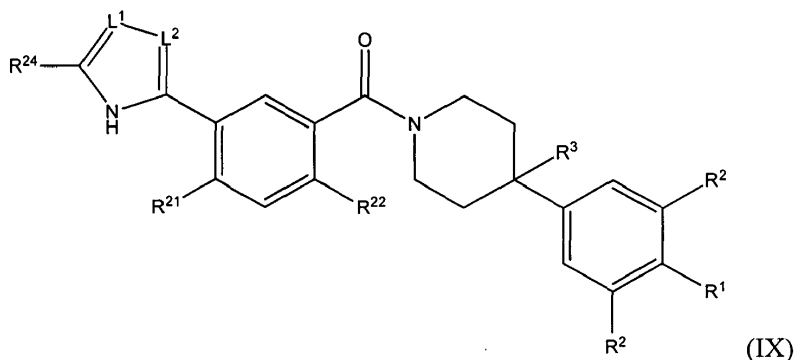
(21)	Translation Published	2017.05.22
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2017.02.01
(86)	European Application Nr.	12754969.9
(86)	European Filing Date	2012.03.08
(87)	The European Application's Publication Date	2014.01.15
(30)	Priority	2011.03.08, US, 201161450482 P 2011.03.08, US, 201161450561 P 2011.07.16, US, 201161508611 P 2012.01.11, US, 201261585642 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	3-V Biosciences, Inc., 3715 Haven Ave., Suite 220, Menlo Park, CA 94025, US-USA
(72)	Inventor	OSLOB, Johan D., c/o 3-V Biosciences, Inc.3715 Haven Ave., Suite 220, Menlo Park, CA 94025, US-USA McDOWELL, Robert S., c/o 3-V Biosciences, Inc.3715 Haven Ave., Suite 220, Menlo Park, CA 94025, US-USA JOHNSON, Russell, c/o 3-V Biosciences, Inc.3715 Haven Ave., Suite 220, Menlo Park, CA 94025, US-USA YANG, Hanbiao, c/o 3-V Biosciences, Inc.3715 Haven Ave., Suite 220, Menlo Park, CA 94025, US-USA EVANCHIK, Marc, c/o 3-V Biosciences, Inc.3715 Haven Ave., Suite 220, Menlo Park, CA 94025, US-USA ZAHARIA, Cristiana A., c/o 3-V Biosciences, Inc.3715 Haven Ave., Suite 220, Menlo Park, CA 94025, US-USA CAI, Haiying, c/o 3-V Biosciences, Inc.3715 Haven Ave., Suite 220, Menlo Park, CA 94025, US-USA HU, Lily W., c/o 3-V Biosciences, Inc.3715 Haven Ave., Suite 220, Menlo Park, CA 94025, US-USA
(74)	Agent or Attorney	Bryn Aarflot AS, Postboks 449 Sentrum, 0104 OSLO, Norge

-
- (54) Title **HETEROCYCLIC MODULATORS OF LIPID SYNTHESIS**
- (56) References
Cited: WO-A1-2007/063012
US-A1- 2008 103 208
US-A1- 2009 105 305

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 struktur (IX):



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori:

R^1 er H, -CN, halogen, C_1 - C_4 -rettkjedet eller forgrenet alkyl, -O-(C_3 - C_5 -sykloalkyl), -O-(C_1 - C_4 -rettkjedet eller forgrenet alkyl) hvori:

C_3 - C_5 -sykloalkyl eventuelt inkluderer et oksygen- eller nitrogenheteroatom, og
når R^1 ikke er H, -CN eller halogen, er det eventuelt substituert med ett eller flere halogenatomer,

hver R^2 er uavhengig hydrogen, halogen eller C_1 - C_4 -rettkjedet eller forgrenet alkyl,

R^3 er H, -OH eller halogen,

R^{21} er H, halogen, C_1 - C_4 -rettkjedet eller forgrenet alkyl, C_3 - C_5 -sykloalkyl hvori C_3 - C_5 -sykloalkylet eventuelt inkluderer et oksygen- eller nitrogenheteroatom,

R^{22} er H, halogen eller C_1 - C_2 -alkyl,

R^{24} er H, C_1 - C_4 -rettkjedet eller forgrenet alkyl, -(C_1 - C_4 -alkyl)_t-OH, -(C_1 - C_4 -alkyl)_t-O-(C_3 - C_5 -sykloalkyl), eller
-(C_1 - C_4 -alkyl)_t-O-(C_1 - C_4 -rettkjedet eller forgrenet alkyl) hvori:

t er 0 eller 1,

C_3 - C_5 -sykloalkylet eventuelt inkluderer et oksygen- eller nitrogenheteroatom,

L^1 er CR^{23} eller N,

L^2 er CH eller N,

minst én av L^1 eller L^2 er N, og

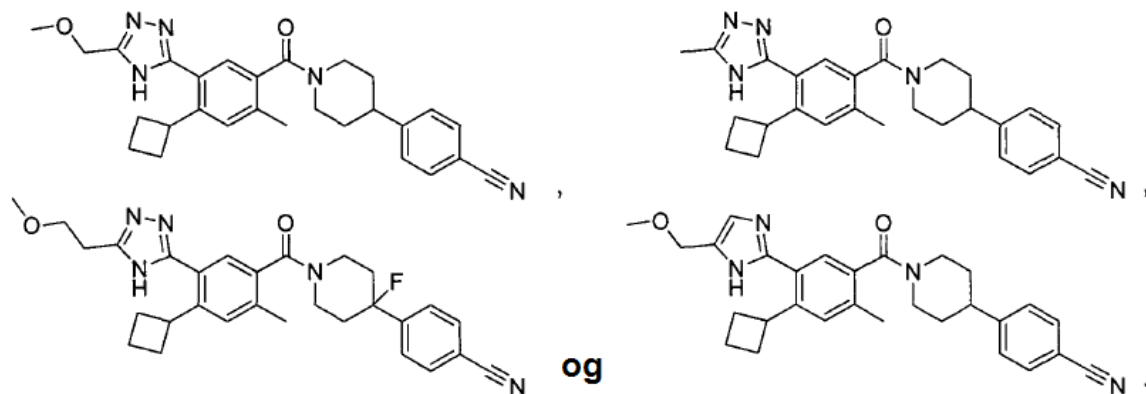
R^{23} er H eller C_1 - C_4 -rettkjedet eller forgrenet alkyl.

2. Forbindelsen ifølge krav, 1 hvori R^{24} er C_1 - C_4 -rettkjedet eller forgrenet alkyl eller -(C_1 - C_4 -alkyl)_t-O-(C_1 - C_4 -rettkjedet eller forgrenet alkyl) hvori t er 0 eller 1.

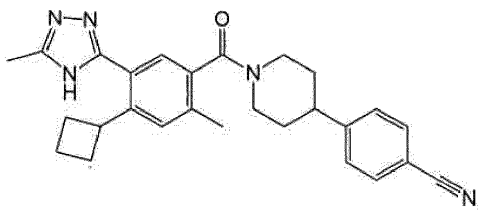
3. Forbindelsen ifølge krav 2, hvori R^{24} er C_1 - C_4 -rettkjedet eller forgrenet alkyl.
4. Forbindelsen ifølge krav 3 hvori R^{24} er metyl.
5. Forbindelsen ifølge krav 1 eller 2, hvori både L^1 og L^2 er N.
6. Forbindelsen ifølge krav 1 eller 2, hvori R^{21} er halogen, C_1 - C_4 -rettkjedet eller forgrenet alkyl eller C_3 - C_5 -sykloalkyl hvori C_3 - C_5 -sykloalkylet eventuelt inkluderer et oksygen- eller nitrogenheteroatom.
7. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori R^{21} er C_3 - C_5 -sykloalkyl.
8. Forbindelsen ifølge krav 7, hvori R^{21} er syklobutyl.
9. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1, 2 eller 5, hvori R^{22} er H, metyl eller etyl.
10. Forbindelsen ifølge krav 9, hvori R^{22} er metyl.
11. Forbindelsen ifølge krav 1 eller 2, hvori R^3 er H eller halogen.
12. Forbindelsen ifølge krav 11, hvori R^3 er H.
13. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori hver R^2 er H.
14. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1, 2 eller 4, hvori R^1 er halogen, -CN eller C_1 - C_2 -haloalkyl.
15. Forbindelsen ifølge krav 14, hvori R^1 er -CN.
16. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori R^{21} er C_1 - C_2 -alkyl eller C_3 - C_5 -sykloalkyl, og R^{22} er C_1 - C_2 -alkyl.
17. Forbindelsen ifølge krav 16, hvori R^{21} er C_3 - C_5 -sykloalkyl og R^{22} er C_1 - C_2 -alkyl.
18. Forbindelsen ifølge krav 17, hvori R^{24} er C_1 - C_2 -alkyl.

19. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori R^1 er -CN, hver R^2 er H, R^3 er H eller F, R^{21} er C₃-C₄-sykloalkyl, R^{22} er metyl, L^1 og L^2 er N, og R^{24} er metyl, etyl, hydroksymetyl, metoksymetyl, 2-metoksyetyl.

20. Forbindelsen ifølge krav 1 som har en formel valgt fra gruppen som består av:



21. Forbindelsen ifølge krav 1, som har følgende formel:



22. Farmasøytisk sammensetning omfattende en hvilken som helst av forbindelsene ifølge kravene 1–21 og en farmasøytisk akseptabel bærer, eksipiens eller fortynner.

23. Terapeutisk effektiv mengde av en hvilken som helst av forbindelsene ifølge kravene 1–21 for anvendelse ved behandling av en virusinfeksjon hos et individ.

24. Forbindelsene for anvendelse ifølge krav 23, hvori virusinfeksjonen omfatter hepatitt-C-infeksjon.

25. Terapeutisk effektiv mengde av en hvilken som helst av forbindelsene ifølge kravene 1–21 for anvendelse ved behandling av en tilstand **karakterisert ved** feilregulering av en fettsyresyntasefunksjon hos et individ.

26. Terapeutisk effektiv mengde av en hvilken som helst av forbindelsene ifølge kravene 1–21 for anvendelse ved behandling av kreft hos et individ.

27. Forbindelsene for anvendelse ifølge krav 26, hvori kreften er brystkreft.

28. Forbindelsene for anvendelse ifølge krav 26, hvori kreften er brystkreft.

29. Forbindelsene for anvendelse ifølge krav 26, hvori kreften er lungekreft, eggstokkreft, prostatakreft, tykktarmskreft, rektalkreft, kreft i skjoldbruskkjertelen, lymfeknutekreft, spiserørkreft, kreft i nesesvelgrommet, orofarynxkreft, spyttkjertelkreft eller kreft i hjernen.