



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2820013 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 417/04 (2006.01)
A61K 31/4155 (2006.01)
A61K 31/4245 (2006.01)
A61K 31/433 (2006.01)
A61P 17/00 (2006.01)
C07D 413/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

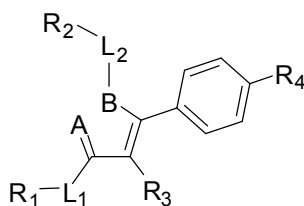
(21)	Translation Published	2018.11.19
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.07.11
(86)	European Application Nr.	13754329.4
(86)	European Filing Date	2013.02.28
(87)	The European Application's Publication Date	2015.01.07
(30)	Priority	2012.03.02, US, 201261606160 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
	Designated Extension States:	BA; ME
(73)	Proprietor	Ralexar Therapeutics, Inc., 101 Lindenwood Drive, Suite 400, Malvern, PA 19355, USA
(72)	Inventor	MOHAN, Raju, 3125 Caminito Ricardo, EncinitasCalifornia 92024, USA
(74)	Agent or Attorney	Murgitroyd & Company, 165-169 Scotland Street, G58PL GLASGOW, Storbritannia

(54)	Title	LIVER X RECEPTOR (LXR) MODULATORS FOR THE TREATMENT OF DERMAL DISEASES, DISORDERS AND CONDITIONS
(56)	References Cited:	WO-A1-2007/002559, WO-A2-2009/140089, WO-A2-2012/027710, WO-A2-2009/011850, FINN J ET AL: "DISCOVERY OF A POTENT AND SELECTIVE SERIES OF PYRAZOLE BACTERIAL METHIONYL-TRNA SYNTHETASE INHIBITORS", BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS, PERGAMON, AMSTERDAM, NL, vol. 13, no. 13, 1 January 2003 (2003-01-01), pages 2231-2234, XP008041498, ISSN: 0960-894X, DOI: 10.1016/S0960-894X(03)00298-1, WO-A2-2010/096170

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 strukturen i Formel (E):



Formel (E);

hvor:

A og B hver er nitrogen, hvor A og B er bundet sammen for å danne en femleddet heteroarylring;

L₁ er en binding, C₁-C₆-alkyl eller C₁-C₆-heteroalkyl;

L₂ er C₁-C₆-alkyl eller C₁-C₆-heteroalkyl;

R₁ er hydrogen, halogen, -CF₃, -OR₈, -N(R₈)₂, -C(=O)R₈, -C(=O)OR₈, -C(=O)N(R₈)₂, -C(=N-OH)R₈, -C(=S)N(R₈)₂, -C(=CH₂)CH₃ eller -C(=O)OCH₂SCH₃;

R₂ er -C(=O)OR₉, -C(=O)N(R₉)₂, -NR₁₀C(=O)R₉, -C(=N-OH)R₉, -C(=S)N(R₉)₂ eller -C(=O)OCH₂SCH₃;

R₃ er hydrogen, halogen, C₁-C₆-alkyl eller C₁-C₆-haloalkyl;

R₄ er aryl eller heteroaryl; hvor aryl eller heteroaryl er substituert med i det minste én R₁₁;

hver R₈ og hver R₁₀ er hver uavhengig hydrogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-heteroalkyl, -C₁-C₆-alkyl-aryl, aryl eller heteroaryl;

hver R₉ er uavhengig C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-heteroalkyl, -C₁-C₆-alkyl-aryl, aryl eller heteroaryl;

R₁₁ er uavhengig halogen, nitro, -OR₁₀, -N(R₁₀)₂, -CN, -C(=O)R₁₀, -C(=O)OR₁₀, -C(=O)N(R₁₀)₂, -NR₁₀C(=O)R₁₀, NR₁₀SO₂R₁₀, -SOR₁₀, -SO₂R₁₀, -SO₂N(R₁₀)₂, -

C(=O)OCH₂SCH₃, C₁-C₆-alkyl, C₃-C₈-sykloalkyl, C₁-C₆-haloalkyl, C₁-C₆-heteroalkyl, -C₁-

C₆-alkyl-aryl, valgfritt substituert aryl eller valgfritt substituert heteroaryl;

eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller farmasøytisk akseptabelt solvat derav.

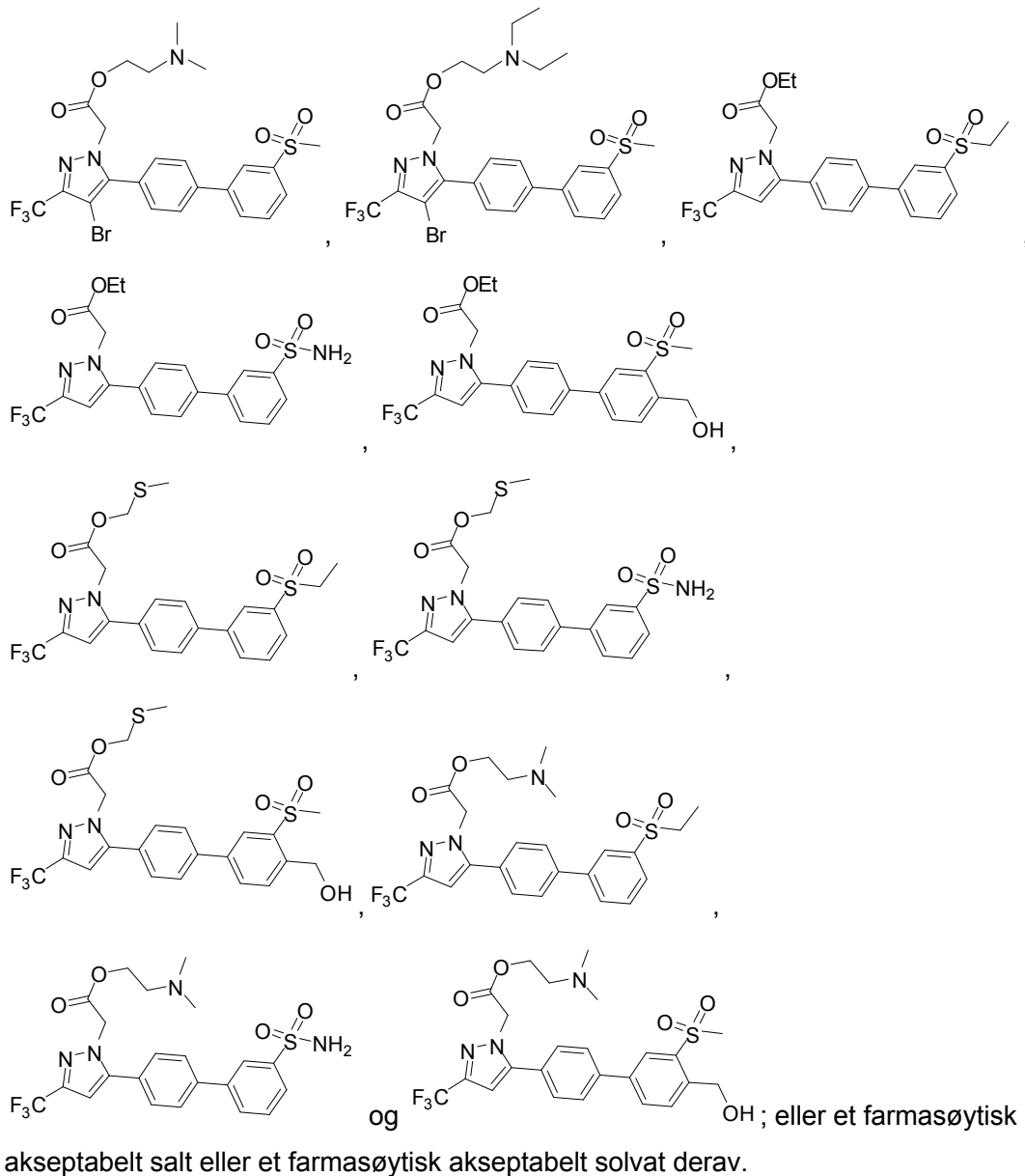
2. Forbindelse ifølge krav 1 eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller et farmasøytisk akseptabelt solvat derav, hvor R₄ er aryl.

3. Forbindelse ifølge krav 2 eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller et farmasøytisk akseptabelt solvat derav, hvor R₂ er -C(=O)OR₉; og R₉ er C₁-C₆-alkyl eller C₁-C₆-heteroalkyl.

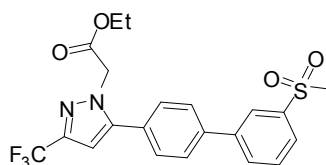
4. Forbindelse ifølge krav 3, hvor L₂ er C₁-C₆-alkyl.

-
- Chemical structures of 12 compounds (1-12) used in the study. The structures are arranged in a 4x3 grid. Each structure consists of a central biphenyl core. The left phenyl ring is substituted with a trifluoromethyl (F₃C) group and a 1,2,4-triazole ring. The right phenyl ring is substituted with a sulfonamide group (SO₂NH₂). The triazole ring is substituted with various groups: 1-methoxy (1), 1-(methylthiomethyl) (2), 1-(dimethylaminoethyl) (3), 1-(diethylaminoethyl) (4), 1-methoxy (5), 1-methoxy-4-chloro (6), 1-ethoxy (7), 1-methoxy-4-chloro (8), 1-methoxy-4-chloro (9), 1-(dimethylaminoethyl) (10), 1-methoxy-4-chloro (11), and 1-methoxy-4-bromo (12).

3



11. Forbindelse, som er:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller et farmasøytisk akseptabelt solvat derav.

5

12. Farmasøytisk sammensetning som omfatter et farmasøytisk akseptabelt fortynningsmiddel, en farmasøytisk akseptabelt eksipients eller et farmasøytisk akseptabelt bindemiddel, og en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 11; eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller et farmasøytisk akseptabelt solvat derav.

13. Forbindelse, salt eller solvat ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 11 for anvendelse i behandling av en dermal lidelse, sykdom eller tilstand hos et pattedyr som ville dra nytte av LXR-modulering.
- 5 14. Forbindelse, salt eller solvat for anvendelse ifølge krav 13, hvor den dermale lidelse, sykdom eller tilstand velges blant hudaldring, arrdannelse, psoriasis, dermatitt, eksem, urticaria, rosacea, brannskader, akne, iktyose, vitiligo, metastatisk melanom og xerose.
- 10 15. Forbindelse, salt eller solvat for anvendelse ifølge krav 14, hvor dermatitten er atopisk dermatitt.