



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3030323 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 295/185 (2006.01)
A61K 31/166 (2006.01)
A61K 31/40 (2006.01)
A61K 31/4453 (2006.01)
A61K 31/495 (2006.01)
A61K 31/5375 (2006.01)
A61K 31/54 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)
C07C 237/22 (2006.01)
C07D 213/81 (2006.01)
C07D 233/90 (2006.01)
C07D 295/26 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2019.09.16
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.04.24
(86)	European Application Nr.	14834451.8
(86)	European Filing Date	2014.08.06
(87)	The European Application's Publication Date	2016.06.15
(30)	Priority	2013.08.06, US, 201361862759 P 2014.03.17, US, 201461954276 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	Imago Biosciences Inc., 2729 Debbie Court, San Carlos, CA 94070, USA
(72)	Inventor	MCCALL, John M., 2729 Debbie Court, San Carlos, CA 94070, USA RIENHOFF, Jr. Hugh, Young, 2729 Debbie Court, San Carlos, CA 94070, USA CLARE, Michael, 2729 Debbie Court, San Carlos, CA 94070, USA
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54) Title **KDM1A INHIBITORS FOR THE TREATMENT OF DISEASE**

(56) References
Cited:
EP-A1- 2 927 212
WO-A1-2014/164867
US-A1- 2012 108 500
US-A1- 2013 090 386
WO-A1-2012/107498

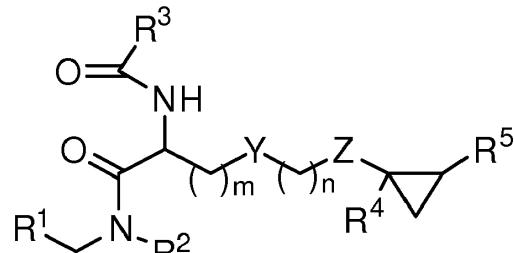
WO-A2-2012/135113

DAISUKE OGASAWARA ET AL: "Lysine-Specific Demethylase 1-Selective Inactivators: Protein-Targeted Drug Delivery Mechanism", ANGEWANDTE CHEMIE INTERNATIONAL EDITION, vol. 52, no. 33, 3 July 2013 (2013-07-03), pages 8620-8624, XP055255288, DE ISSN: 1433-7851, DOI: 10.1002/anie.201303999 & Wiley-Vch 2013 ET AL: "Supporting Information Lysine-Specific Demethylase 1-Selective Inactivators: Protein- Targeted Drug Delivery Mechanism**", , 3 July 2013 (2013-07-03), pages S1-S38, XP055317984, DOI: 10.1002/anie.201303999 Retrieved from the Internet: URL:http://onlinelibrary.wiley.com/store/10.1002/anie.201303999/asset/supinfo/anie_2_01303999_sm_miscellaneous_information.pdf?v=1&s=6308e8df3abddd84c333793397176612e63e9037 [retrieved on 2016-11-09]

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 I:



(I)

eller et salt derav, hvor:

Y er valgt fra en binding, NR^{4a}, O, C(O)NH, NHC(O), S, SO₂ og CH₂;

Z er valgt fra en binding, NR^{4b}, O, C(O)NH, NHC(O), S, SO₂, og CH₂;

10 m er et heltall fra 0 til 5;

n er et heltall fra 0 til 3;

R¹ og R² er hver uavhengig valgt fra alkyl, aminoalkyl, alkylsulfonylalkyl, alkoxalkyl, aryl, arylalkyl, cykloalkyl, cykloalkylalkyl, feny, bifeny, heteroaryl, heteroarylalkyl, heterocykloalkyl og heterocykloalkylalkyl og R¹ og R², danner sammen med nitrogenet som de bundet til, en nitrogenholdig heterocykloalkylring som eventuelt kan være substituert med mellom 0 og 3 R⁶ grupper;

R³ er valgt fra alkylamino, cykloalkylamino, arylamino, heteroarylamino, heterocykloalkylamino, cykloalkyl, cykloalkylalkyl, aryl, arylalkyl, heteroaryl, heteroarylalkyl, heterocykloalkyl og heterocykloalkylalkyl, hvor hvilken som helst

20 eventuelt kan være substituert med mellom 0 og 3 R⁶ grupper;

R⁴, R^{4a}, og R^{4b} er uavhengig valgt fra hydrogen, alkyl, alkenyl, alkynyl og cykloalkyl;

R⁵ er valgt fra aryl og heteroaryl, hvor hvilken som helst eventuelt kan være substituert med mellom 0 og 3 R⁶ grupper;

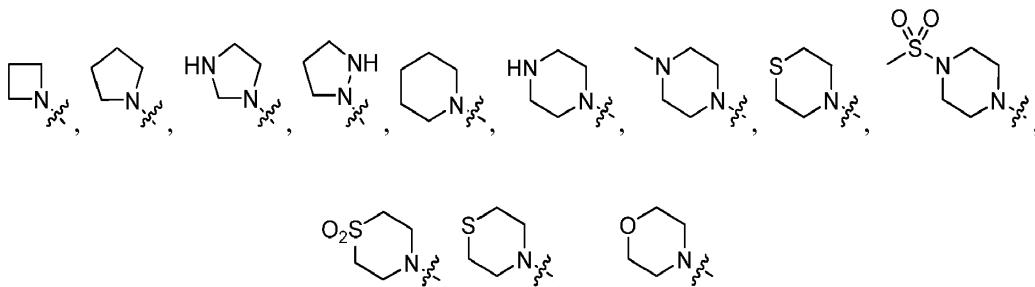
hver R⁶ er uavhengig valgt fra hydrogen, halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, cykloalkyl, haloalkyl, haloalkoxy, aryl, aralkyl, heterocykloalkyl, heteroaryl, heteroarylalkyl, cyano, alkoxsy, amino, alkylamino, dialkylamino, COR⁷, SO₂R⁷, NHSO₂R⁷, NHSO₂NHR⁷, NHCOR⁷, NHCONHR⁷, CONHR⁷, og CONR⁷R⁸; og

R⁷ og R⁸ er uavhengig valgt fra hydrogen og lavere alkyl; eller R⁷ og R⁸ kan sammen danne en nitrogenholdig heterocykloalkyl- eller heteroarylring, som eventuelt kan 30 være substituert med C₁-C₆ alkyl.

2. Forbindelse ifølge krav 1, hvor Z er NR^{4b}.
3. Forbindelse ifølge krav 2, hvor R^{4b} er valgt fra methyl og hydrogen.
- 5 4. Forbindelse ifølge krav 3, hvor alkylet, enten alene eller som en navngitt del av en annen ikke-cyklistisk substituent, er C₁-C₈ alkyl.
- 10 5. Forbindelse ifølge krav 4, hvor R³ er valgt fra aryl, arylalkyl, heteroaryl og heteroarylalkyl, hvor hvilken som helst eventuelt kan være substituert med mellom 0 og 3 R⁶ grupper.
6. Forbindelse ifølge krav 5, hvor R³ er valgt fra aryl og heteroaryl, hvor hvilken som helst eventuelt kan være substituert med mellom 0 og 3 R⁶ grupper.
- 15 7. Forbindelse ifølge krav 6, hvor m er et heltall fra 0 til 1; Y er valgt fra NR^{4a}, O, S, SO₂, og CH₂; n er et heltall fra 1 til 3; og R^{4a} er valgt fra hydrogen og alkyl.
8. Forbindelse ifølge krav 7, hvor m er 0; Y er CH₂; og n er et heltall fra 1 til 3.
- 20 9. Forbindelse ifølge krav 4, hvor R³ er aryl, eventuelt substituert med mellom 0 og 3 R⁶ grupper.
10. Forbindelse ifølge krav 9, hvor R³ er valgt fra fenyl og bifenyld, hvor hver av disse eventuelt kan være substituert med mellom 0 og 3 R⁶ grupper.
- 25 11. Forbindelse ifølge krav 10, hvor m er et heltall fra 0 til 1; Y er valgt fra NR^{4a}, O, S, SO₂, og CH₂; n er et heltall fra 1 til 3; og R^{4a} er valgt fra hydrogen og alkyl.
12. Forbindelse ifølge krav 11, hvor m er 0; Y er CH₂; og n er et heltall fra 1 til 3.
- 30 13. Forbindelse ifølge krav 12, hvor n er 2 eller 3.
14. Forbindelse ifølge krav 13, hvor det nitrogenholdige heterocykloalkyl dannet av R¹ og R² sammen med nitrogenet de er bundet til, inneholder 3 til åtte atomer.

15. Forbindelse ifølge krav 14, hvor R¹ og R² sammen danner et nitrogenholdig heterocykloalkyl, som eventuelt kan være substituert med mellom 0 og 3 R⁶ grupper.

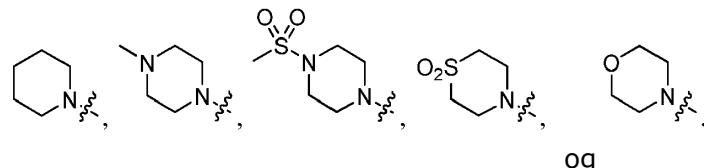
16. Forbindelse ifølge krav 15, hvor det nitrogenholdige heterocykloalkyl er valgt fra:



10

og

17. Forbindelse ifølge krav 16, hvor det nitrogenholdige heterocykloalkyl er valgt fra:



15

og

20

18. Forbindelse ifølge krav 14, hvor R⁵ er aryl som eventuelt kan være substituert med mellom 0 og 3 R⁶ grupper, som hver uavhengig er valgt fra C₁-C₆ alkyl, halogen, C₁-C₆ alkoksy, OCF₃ og CF₃.

25

19. Forbindelse ifølge krav 18, hvor R⁵ er fenyl som eventuelt kan være substituert med mellom 0 og 3 R⁶ grupper som hver uavhengig er valgt fra C₁-C₆ alkyl, halogen, C₁-C₆ alkoksy, OCF₃ og CF₃.

30

20. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, eller et salt derav, for anvendelse som et medikament.

21. Farmasøytisk sammensetning omfattende en forbindelse ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, eller et salt derav, sammen med en farmasøytisk akseptabel bærer.