



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3199533 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 401/12 (2006.01)
A61K 31/4155 (2006.01)
A61K 31/4178 (2006.01)
A61K 31/454 (2006.01)
A61P 3/10 (2006.01)
A61P 43/00 (2006.01)
C07D 403/12 (2006.01)
C07D 405/12 (2006.01)
C07D 405/14 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2019.06.24
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.02.27
(86)	European Application Nr.	17157922.0
(86)	European Filing Date	2012.08.30
(87)	The European Application's Publication Date	2017.08.02
(30)	Priority	2011.08.31, JP, 2011188121 2011.09.06, US, 201161573433 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	Japan Tobacco Inc., 2-1 Toranomom 2-chome, Minato-ku, Tokyo 105-8422, Japan
(72)	Inventor	MIURA, Tomoya, c/o Central Pharmaceutical Research Institute of Japan Tobacco Inc., 1-1, Murasaki-cho, Takatsuki-shi, Osaka 569-1125, Japan OGOSHI, Yosuke, c/o Central Pharmaceutical Research Institute of Japan Tobacco Inc., 1-1, Murasaki-cho, Takatsuki-shi, Osaka 569-1125, Japan UEYAMA, Kazuhito, c/o Central Pharmaceutical Research Institute of Japan Tobacco Inc., 1-1, Murasaki-cho, Takatsuki-shi, Osaka 569-1125, Japan MOTODA, Dai, c/o Central Pharmaceutical Research Institute of Japan Tobacco Inc., 1-1, Murasaki-cho, Takatsuki-shi, Osaka 569-1125, Japan IWAYAMA, Toshihiko, c/o Central Pharmaceutical Research Institute of Japan Tobacco Inc., 1-1, Murasaki-cho, Takatsuki-shi, Osaka 569-1125, Japan SUZAWA, Koichi, c/o Central Pharmaceutical Research Institute of Japan Tobacco Inc., 1-1, Murasaki-cho, Takatsuki-shi, Osaka 569-1125, Japan NAGAMORI, Hironobu, c/o Central Pharmaceutical Research Institute of Japan Tobacco Inc., 1-1, Murasaki-cho, Takatsuki-shi, Osaka, 569-1125, Japan UENO, Hiroshi, c/o Central Pharmaceutical Research Institute of Japan Tobacco Inc., 1-1, Murasaki-cho, Takatsuki-shi, Osaka 569-1125, Japan TAKAHASHI, Akihiko, c/o Central Pharmaceutical Research Institute of Japan Tobacco Inc., 1-1, Murasaki-cho, Takatsuki-shi, Osaka 569-1125, Japan SUGIMOTO, Kazuyuki, c/o Central Pharmaceutical Research Institute of Japan Tobacco Inc., 1-1, Murasaki-cho, Takatsuki-shi, Osaka 569-1125, Japan

(74) Agent or Attorney ZACCO NORWAY AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

(54) Title **PYRAZOLE COMPOUND AND PHARMACEUTICAL USE THEREOF**

(56) References

Cited:

JP-A- 2008 520 642

JP-A- 2006 514 942

JP-A- 2008 285 481

JP-A- 2009 517 388

JP-A- 2010 222 298

WO-A2-2007/034279

JP-A- 2008 501 745

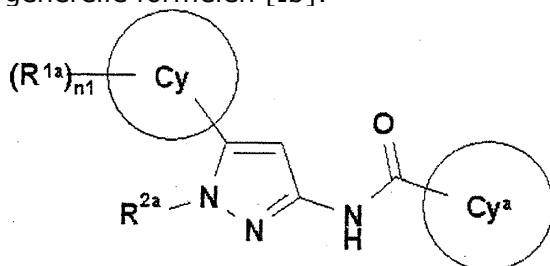
JP-A- 2008 024 693

OHSUMI K ET AL: "Pyrazole-O-Glucosides as Novel Na⁺-Glucose Cotransporter (SGLT)Inhibitors", BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS, PERGAMON, AMSTERDAM, NL, vol. 13, 1 January 2003 (2003-01-01), pages 2269-2272, XP002987944, ISSN: 0960-894X, DOI: 10.1016/S0960-894X(03)00466-9

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 eller farmasøytisk akseptabelt salt derav representert ved den generelle formelen [Ib]:



[Ib]

5

hvor

ring Cy er

(1) C₆₋₁₀-aryl,

(2) C₃₋₈-sykloalkyl eller

10

(3) C₃₋₈-sykloalkenyl,

n₁ er 0, 1, 2, 3 eller 4,

R^{1a} er

(1) et halogenatom,

(2) hydroksy,

15

(3) karboksy,

(4) en C₁₋₆-alkylgruppe,

(5) en C₂₋₈-alkenylgruppe,

(6) en C₂₋₈-alkynylgruppe,

(7) en C₁₋₆-alkoksygruppe,

20

(8) en C₃₋₆-sykloalkylgruppe,

(9) en halo-C₁₋₆-alkylgruppe,

(10) en hydroksy-C₁₋₆-alkylgruppe,

(11) en C₁₋₆-alkoksy-C₁₋₆-alkylgruppe,

(12) en halo-C₁₋₆-alkoksy-C₁₋₆-alkylgruppe,

25

(13) en C₁₋₆-alkylsulfonyl-C₁₋₆-alkylgruppe,

(14) en halo-C₁₋₆-alkylsulfonyl-C₁₋₆-alkylgruppe,

(15) en halo-C₁₋₆-alkylamino-C₁₋₆-alkylgruppe,

(16) en C₃₋₆-sykloalkyl-C₂₋₆-alkynylgruppe,

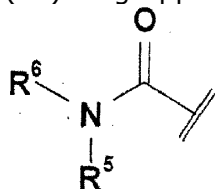
(17) en halo-C₁₋₆-alkoksygruppe,

30

(18) en karboksy-C₁₋₆-alkoksygruppe,

(19) en C₁₋₆-alkylsulfonylgruppe,

- (20) en C₁₋₆-alkylsulfonylgruppe,
 (21) en halo-C₁₋₆-alkylsulfonylgruppe,
 (22) en C₁₋₈-alkylkarbonylgruppe,
 (23) en C₁₋₆-alkyloksykarbonylgruppe,
 5 (24) en gruppe representert ved formelen:



hvor

R⁵ er

(a) et hydrogenatom eller

10 (b) en C₁₋₆-alkylgruppe, og

R⁶ er

(a) en C₁₋₆-alkylgruppe eller

(b) en halo-C₁₋₆-alkylgruppe,

15 (25) en mettet heterosyklo-C₁₋₆-alkylgruppe (den mettede heterosyklusen er av 4-leddet til 6-leddet mettet heterosyklus med 1 til 2 heteroatomer valgt fra nitrogen, oksygen og sulfur) eller

(26) en mettet heterosyklo-oksy-C₁₋₆-alkylgruppe (den mettede heterosyklusen er av 4-leddet til 6-leddet mettet heterosyklus med 1 til 2 heteroatomer valgt fra nitrogen, oksygen og sulfur),

20 forutsatt at når n₁ er 2, 3 eller 4, er R^{1a} henholdsvis lik eller forskjellig,

R^{2a} er

(1) en C₁₋₈-alkylgruppe,

(2) en C₃₋₈-sykloalkyl-C₁₋₆-alkylgruppe,

(3) en C₆₋₁₀-aryl-C₁₋₆-alkylgruppe,

25 (4) en mettet heterosyklo-C₁₋₆-alkylgruppe (den mettede heterosyklusen er av 4-leddet til 6-leddet mettet heterosyklus med 1 til 2 heteroatomer valgt fra nitrogen, oksygen og sulfur),

(5) en C₃₋₈-sykloalkylgruppe,

(6) en halo-C₁₋₆-alkylgruppe,

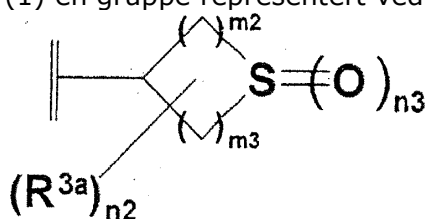
30 (7) en C₁₋₆-alkoksy-C₁₋₆-alkylgruppe,

(8) en halo-C₃₋₈-sykloalkylgruppe,

(9) en C₆₋₁₀-arylgruppe (C₆₋₁₀-arylgruppen er eventuell substituert med 1 til 4 substituenten valgt fra

(a) et halogenatom,

- (b) hydroksy,
 (c) en C₁₋₆-alkylgruppe,
 (d) en C₂₋₈-alkenylgruppe,
 (e) en C₂₋₆-alkynylgruppe,
 5 (f) en C₁₋₆-alkoksygruppe,
 (g) en halo-C₁₋₆-alkylgruppe,
 (h) en C₁₋₆-alkoksy-C₁₋₆-alkylgruppe,
 (i) en halo-C₁₋₆-alkoksygruppe,
 (j) en hydroksy-C₁₋₆-alkoksygruppe,
 10 (k) en C₁₋₆-alkoksy-C₁₋₆-alkoksygruppe,
 (l) en karboksy-C₁₋₆-alkoksygruppe,
 (m) en C₆₋₁₀-aryl-C₁₋₆-alkoksygruppe,
 (n) en C₁₋₆-alkylsulfanyl-C₁₋₆-alkoksygruppe,
 (o) en C₁₋₆-alkylsulfonyl-C₁₋₆-alkoksygruppe,
 15 (p) en C₆₋₁₀-aryl-C₁₋₆-alkoksy-C₁₋₆-alkoksygruppe,
 (q) en mettet heterosyklo-C₁₋₆-alkoksygruppe (den mettede heterosyklusen er av 4-leddet til 6-leddet mettet heterosyklus med 1 til 2 heteroatomer valgt fra nitrogen, oksygen og sulfur og er eventuell substituert med 1 til 2 C₁₋₆-alkylgrupper),
 20 (r) en mettet heterosyklo-oksygruppe (den mettede heterosyklusen er en 4-leddet til 6-leddet mettet heterosyklus med 1 til 2 heteroatomer valgt fra nitrogen, oksygen og sulfur),
 (s) en C₃₋₈-sykloalkoksygruppe,
 (t) en C₁₋₆-alkoksykarbonyloksygruppe og
 25 (u) en C₁₋₆-alkylsulfonylgruppe), eller
 (10) en mettet heterosyklusgruppe (den mettede heterosyklusen er av 4-leddet til 6-leddet mettet heterosyklus med 1 til 2 heteroatomer valgt fra nitrogen, oksygen og sulfur og er eventuell substituert med 1 til 4 C₁₋₆-alkylgrupper), og ring Cy^a er en gruppe valgt fra
 30 (1) en gruppe representert ved formelen:



hvor

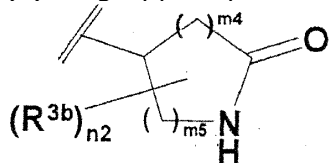
m₂ er 1, 2 eller 3,

4

m₃ er 1, 2 eller 3,

n₃ er 1 eller 2,

(2) en gruppe representert ved formelen:



5

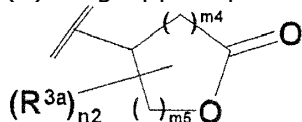
hvor

m₄ er 0, 1, 2 eller 3,

m₅ er 0, 1 eller 2,

forutsatt at summen av m₄ og m₅ er 1 eller mer,

(3) en gruppe representert ved formelen:



10

hvor

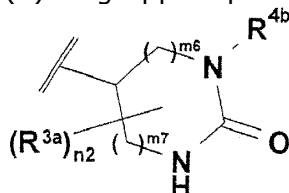
m₄ er 0, 1, 2 eller 3,

m₅ er 0, 1 eller 2,

forutsatt at summen av m₄ og m₅ er 1 eller mer,

15

(4) en gruppe representert ved formelen:



hvor

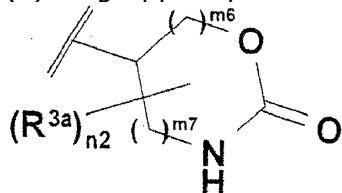
m₆ er 0, 1 eller 2,

m₇ er 0, 1 eller 2,

20

forutsatt at summen av m₆ og m₇ er 1 eller mer,

(5) en gruppe representert ved formelen:



hvor

m₆ er 0, 1 eller 2,

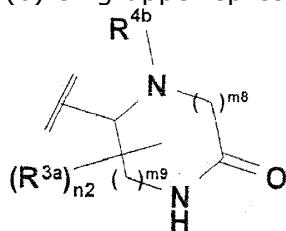
25

m₇ er 0, 1 eller 2,

5

forutsatt at summen av m6 og m7 er 1 eller mer,

(6) en gruppe representert ved formelen:

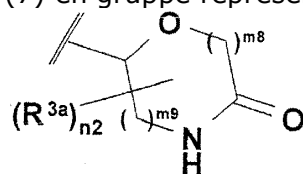


hvor

5 m8 er 1 eller 2,

m9 er 1 eller 2, og

(7) en gruppe representert ved formelen:



hvor

10 m8 er 1 eller 2,

m9 er 1 eller 2,

n2 er 0, 1, 2, 3 eller 4,

R^{3a} er

(1) hydroksey,

15 (2) en C₁₋₆-alkylgruppe eller

(3) en hydroksey-C₁₋₆-alkylgruppe,

forutsatt at når n2 er 2, 3 eller 4, er R^{3a} henholdsvis lik eller forskjellig,

R^{3b} er

(1) hydroksey,

20 (2) en C₁₋₆-alkylgruppe (som eventuelt danner en C₃₋₆-sykloalkylgruppe sammen med karbonet som den er bundet til og karbonet tilgrensende dertil) eller

(3) en hydroksey-C₁₋₆-alkylgruppe, eller

(4) når to R^{3b} er bundet til det samme karbonet, danner de eventuelt en C₃₋₆-sykloalkylgruppe sammen med karbonet som de er bundet til,

25 forutsatt at når n2 er 2, 3 eller 4, er R^{3b} henholdsvis lik eller forskjellig, og

R^{4b} er

(1) et hydrogenatom,

(2) en C₁₋₆-alkylgruppe,

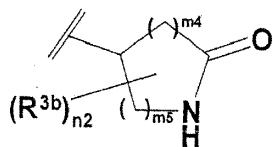
(3) en karboksey-C₁₋₆-alkylgruppe,

30 (4) en halo-C₁₋₆-alkylgruppe eller

(5) en C₁₋₆-alkoksy-C₁₋₆-alkylgruppe.

2. Forbindelsen eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge krav 1, hvori ring Cy^a er valgt fra

5 (1) en gruppe representert ved formelen:



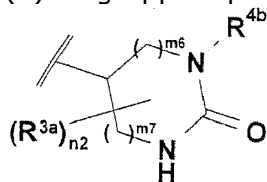
hvori

m₄ er 0, 1, 2 eller 3,

m₅ er 0, 1 eller 2,

10 forutsatt at summen av m₄ og m₅ er 1 eller mer,

(2) en gruppe representert ved formelen:



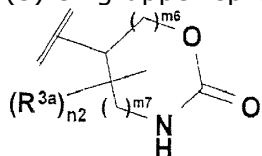
hvori

m₆ er 0, 1 eller 2,

15 m₇ er 0, 1 eller 2,

forutsatt at summen av m₆ og m₇ er 1 eller mer,

(3) en gruppe representert ved formelen:



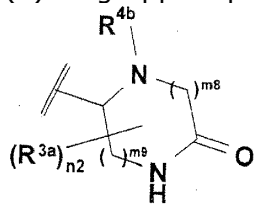
hvori

20 m₆ er 0, 1 eller 2,

m₇ er 0, 1 eller 2,

forutsatt at summen av m₆ og m₇ er 1 eller mer,

(4) en gruppe representert ved formelen:

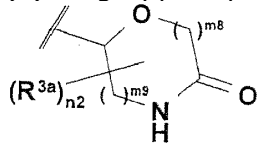


25 hvori

m8 er 1 eller 2,

m9 er 1 eller 2, og

(5) en gruppe representert ved formelen:



5 hvori

m8 er 1 eller 2,

m9 er 1 eller 2,

n2 er 0, 1, 2, 3 eller 4,

R^{3a} er

10

(1) hydroksy,

(2) en C₁₋₆-alkylgruppe eller

(3) en hydroksy-C₁₋₆-alkylgruppe,

forutsatt at når n2 er 2, 3 eller 4, er R^{3a} henholdsvis lik eller forskjellig,

R^{3b} er

15

(1) hydroksy,

(2) en C₁₋₆-alkylgruppe (som eventuelt danner en C₃₋₆-sykloalkylgruppe sammen med karbonet som den er bundet til og karbonet tilgrensende dertil) eller

(3) en hydroksy-C₁₋₆-alkylgruppe, eller

(4) når to R^{3b} er bundet til det samme karbonet, danner de eventuelt en C₃₋₆-sykloalkylgruppe sammen med karbonet som de er bundet til,

20

forutsatt at når n2 er 2, 3 eller 4, er R^{3b} henholdsvis lik eller forskjellig, og

R^{4b} er

(1) et hydrogenatom,

(2) en C₁₋₆-alkylgruppe,

25

(3) en karboksy-C₁₋₆-alkylgruppe,

(4) en halo-C₁₋₆-alkylgruppe eller

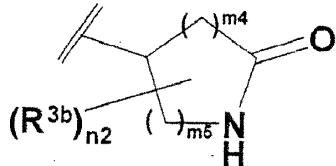
(5) en C₁₋₆-alkoksy-C₁₋₆-alkylgruppe.

3. Forbindelsen eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge krav 1, hvori

30

ring Cy^a er valgt fra

(1) en gruppe representert ved formelen:



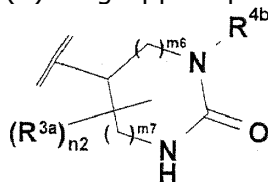
hvor,

m_4 er 0, 1, 2 eller 3,

m_5 er 0, 1 eller 2,

forutsatt at summen av m_4 og m_5 er 1 eller mer, og

5 (2) en gruppe representert ved formelen:



hvor

m_6 er 0, 1 eller 2,

m_7 er 0, 1 eller 2,

10 forutsatt at summen av m_6 og m_7 er 1 eller mer,

n_2 er 0, 1, 2, 3 eller 4,

R^{3a} er

(1) hydroksy,

(2) en C_{1-6} -alkylgruppe eller

15 (3) en hydroksy- C_{1-6} -alkylgruppe,

forutsatt at når n_2 er 2, 3 eller 4, er R^{3a} henholdsvis lik eller forskjellig,

R^{3b} er

(1) hydroksy,

(2) en C_{1-6} -alkylgruppe (som eventuelt danner en C_{3-6} -sykloalkylgruppe sammen med karbonet som den er bundet til og karbonet tilgrensende dertil) eller

20

(3) en hydroksy- C_{1-6} -alkylgruppe, eller

(4) når to R^{3b} er bundet til det samme karbonet, danner de eventuelt en C_{3-6} -sykloalkylgruppe sammen med karbonet som de er bundet til, forutsatt at når n_2

er 2, 3 eller 4, er R^{3b} henholdsvis lik eller forskjellig, og

25

R^{4b} er

(1) et hydrogenatom,

(2) en C_{1-6} -alkylgruppe,

(3) en karboksy- C_{1-6} -alkylgruppe,

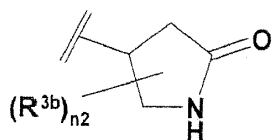
(4) en halo- C_{1-6} -alkylgruppe eller

30

(5) en C_{1-6} -alkoksy- C_{1-6} -alkylgruppe.

4. Forbindelsen eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge krav 1, hvori ring Cy^a er valgt fra

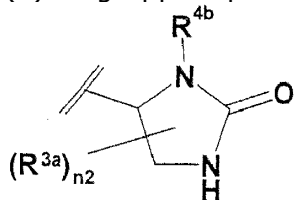
(1) en gruppe representert ved formelen:



hvor

n_2 er 0, 1, 2, 3 eller 4, og

(2) en gruppe representert ved formelen:



5

hvor

n_2 er 0 eller 1,

R^{3a} er

(1) hydroksey,

10 (2) en C_{1-6} -alkylgruppe eller

(3) en hydroksey- C_{1-6} -alkylgruppe, og

R^{3b} er

(1) hydroksey,

15 (2) en C_{1-6} -alkylgruppe (som eventuelt danner en C_{3-6} -sykloalkylgruppe sammen med karbonet som den er bundet til og karbonet tilgrensende dertil) eller

(3) en hydroksey- C_{1-6} -alkylgruppe, eller

(4) når to R^{3b} er bundet til det samme karbonet, danner de eventuelt en C_{3-6} -sykloalkylgruppe sammen med karbonet som de er bundet til,

forutsatt at når n_2 er 2, 3 eller 4, er R^{3b} henholdsvis lik eller forskjellig, og

20

R^{4b} er

(1) et hydrogenatom,

(2) en C_{1-6} -alkylgruppe,

(3) en karboksy- C_{1-6} -alkylgruppe,

(4) en halo- C_{1-6} -alkylgruppe eller

25

(5) en C_{1-6} -alkoksy- C_{1-6} -alkylgruppe.

5. Forbindelsen eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, hvor ringen Cy er C_{6-10} -aryl.

30

6. Forbindelsen eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge krav 5, hvor ringen Cy er fenyl.

7. Forbindelsen eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6, hvori R^{1a} er

- (1) et halogenatom,
 (2) en C_{1-6} -alkylgruppe,
 (3) en C_{1-6} -alkoksygruppe,
 (4) en halo- C_{1-6} -alkylgruppe,
 (5) en C_{1-6} -alkoksy- C_{1-6} -alkylgruppe,
 (6) en halo- C_{1-6} -alkoksy- C_{1-6} -alkylgruppe eller
 (7) en halo- C_{1-6} -alkoksygruppe,

5

10

forutsatt at når n_1 er 2, 3, eller 4, er R^{1a} henholdsvis lik eller forskjellig.

8. Forbindelsen eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7, hvori R^{2a} er en C_{6-10} -arylgruppe (C_{6-10} -arylgruppen er eventuell substituert med 1 til 4 substituenten valgt fra

- (a) et halogenatom,
 (b) en C_{1-6} -alkylgruppe,
 (c) en C_{1-6} -alkoksygruppe og
 (d) en karboksy- C_{1-6} -alkoksygruppe).

15

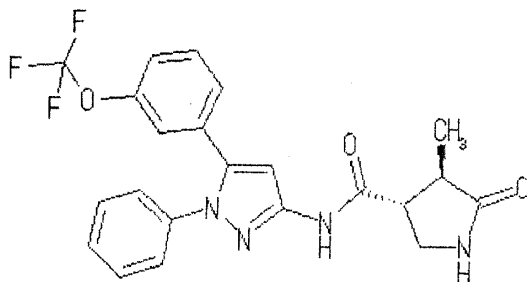
9. Forbindelsen eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge krav 8, hvori R^{2a} er en fenylgruppe (fenylgruppen er eventuell substituert med 1 til 4 substituenten valgt fra

- (a) et halogenatom,
 (b) en C_{1-6} -alkylgruppe,
 (c) en C_{1-6} -alkoksygruppe og
 (d) en karboksy- C_{1-6} -alkoksygruppe).

20

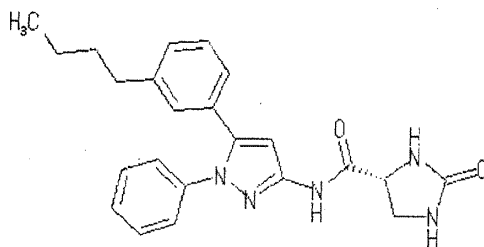
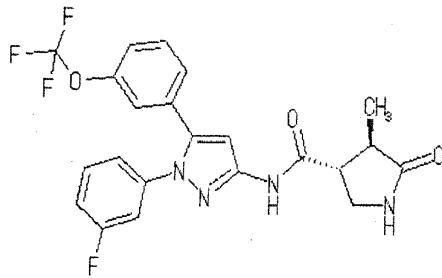
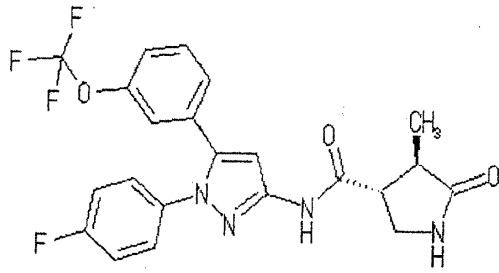
25

10. Forbindelsen eller det farmasøytisk akseptable saltet derav ifølge krav 1, hvori forbindelsen er valgt fra de følgende formlene:

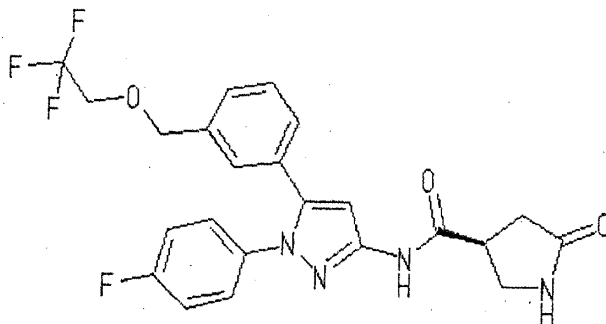
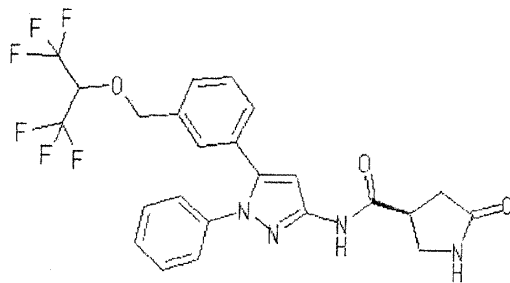


30

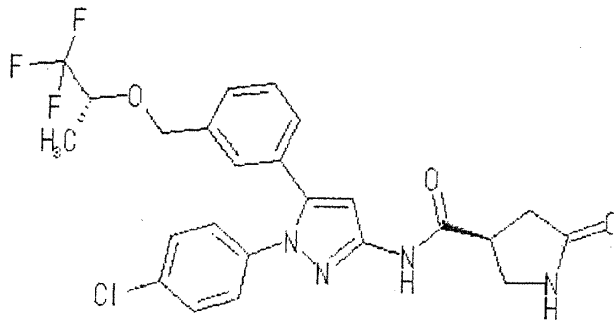
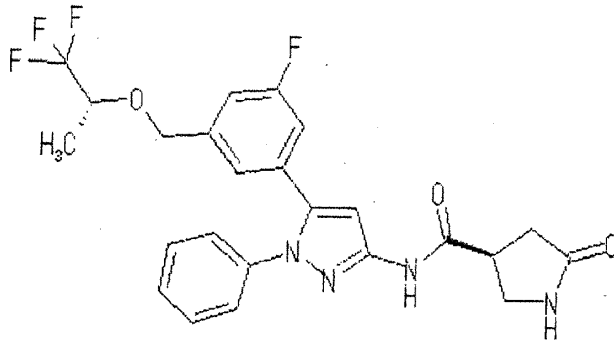
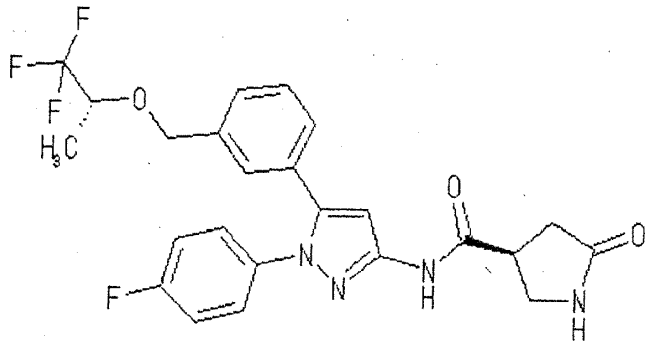
11



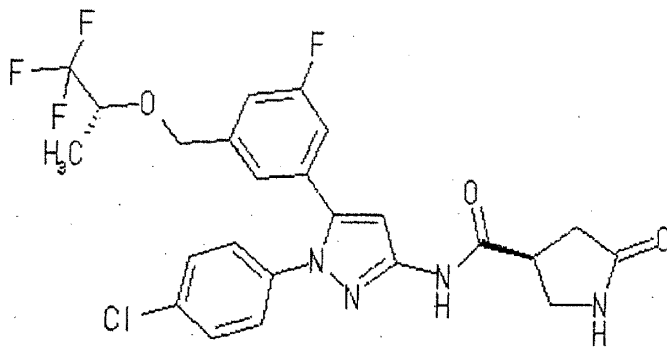
5

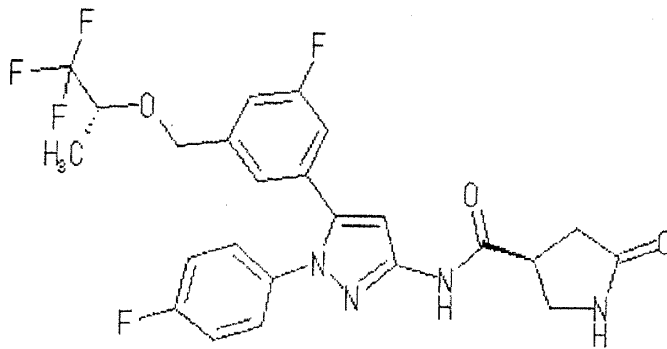
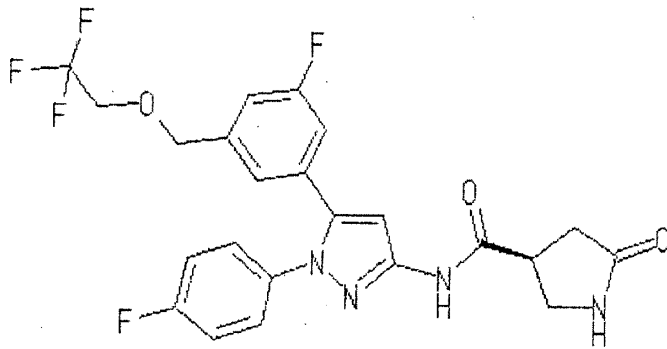
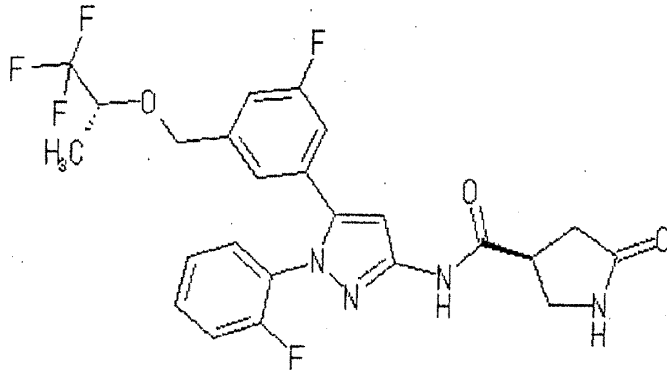


10

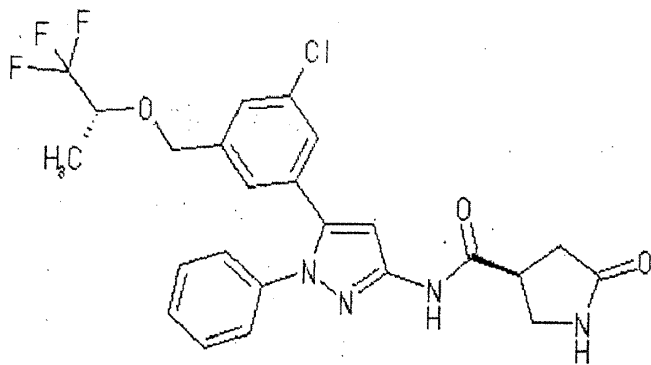


5

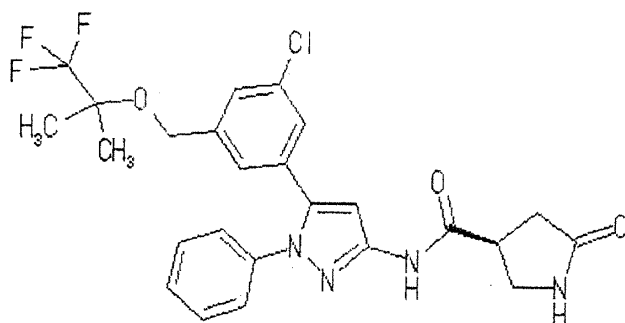
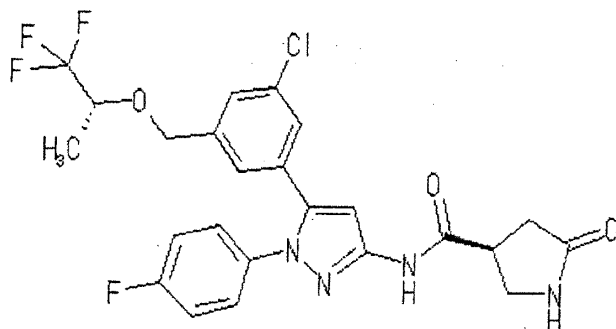




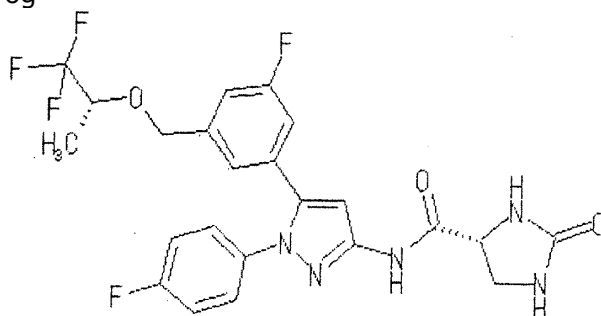
5



14



og



5

11. Forbindelsen eller det farmasøytisk akseptable saltet derav ifølge krav 1, hvori R^{2a} er

- (1) en C₁₋₈-alkylgruppe,
- 10 (2) en C₃₋₈-sykloalkyl-C₁₋₆-alkylgruppe,
- (3) en C₆₋₁₀-aryl-C₁₋₆-alkylgruppe,
- (4) en mettet heterosyklo-C₁₋₆-alkylgruppe (den mettede heterosyklusen er av 4-leddet til 6-leddet mettet heterosyklus med 1 til 2 heteroatomer valgt fra nitrogen, oksygen og sulfur),
- 15 (5) en C₃₋₈-sykloalkylgruppe,
- (6) en halo-C₁₋₆-alkylgruppe,
- (7) en C₁₋₆-alkoksy-C₁₋₆-alkylgruppe,
- (8) en halo-C₃₋₈-sykloalkylgruppe, eller

(9) en mettett heterosyklusgruppe (den mettede heterosyklusen er av 4-leddet til 6-leddet mettett heterosyklus med 1 til 2 heteroatomer valgt fra nitrogen, oksygen og sulfur og er eventuell substituert med 1 til 4 C₁₋₆-alkylgrupper).

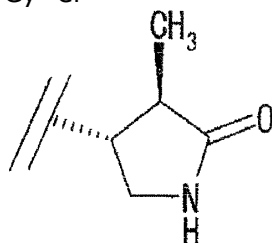
5 **12.** Forbindelsen eller det farmasøytisk akseptable saltet derav ifølge krav 1, hvori n₁ er 2, 3 eller 4.

13. Forbindelsen eller det farmasøytisk akseptable saltet derav ifølge krav 1, hvori R^{2a} er

- 10 (1) en C₁₋₈-alkylgruppe,
 (2) en C₃₋₈-sykloalkyl-C₁₋₆-alkylgruppe,
 (3) en C₆₋₁₀-aryl-C₁₋₆-alkylgruppe,
 (4) en mettett heterosyklo-C₁₋₆-alkylgruppe (den mettede heterosyklusen er av 4-leddet til 6-leddet mettett heterosyklus med 1 til 2 heteroatomer valgt fra nitrogen, oksygen og sulfur),
 15 (5) en C₃₋₈-sykloalkylgruppe,
 (6) en halo-C₁₋₆-alkylgruppe,
 (7) en C₁₋₆-alkoksy-C₁₋₆-alkylgruppe,
 (8) en halo-C₃₋₈-sykloalkylgruppe, eller
 20 (9) en mettett heterosyklusgruppe (den mettede heterosyklusen er av 4-leddet til 6-leddet mettett heterosyklus med 1 til 2 heteroatomer valgt fra nitrogen, oksygen og sulfur og er eventuell substituert med 1 til 4 C₁₋₆-alkylgrupper), og hvori n₁ er 2, 3 eller 4.

25 **14.** Forbindelsen eller det farmasøytisk akseptable saltet derav ifølge krav 1, hvori R^{2a} er trifluormetyl.

15. Forbindelsen eller det farmasøytisk akseptable saltet derav ifølge krav 1, hvori Cy^a er



30

16. Farmasøytisk sammensetning som omfatter forbindelsen eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 15 og en farmasøytisk akseptabel bærer.

5 **17.** SGLT1-inhibitor som omfatter forbindelsen eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 15.

10 **18.** Middel for anvendelse i behandling eller forebygging av diabetes som omfatter en forbindelse eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 15.

19. Middelet for anvendelse i behandling eller forebygging av diabetes ifølge krav 18, hvori diabetes er type II-diabetes mellitus.

15 **20.** Forbindelse eller farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 15 for anvendelse i behandling eller forebygging av diabetes.

20 **21.** Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 20, hvori diabetesen er type II-diabetes mellitus.