



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3206692 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.

A61K 31/513 (2006.01)

A61P 1/16 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

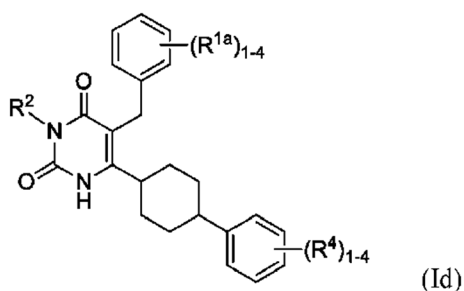
(45)	Translation Published	2024.06.10
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2024.04.03
(86)	European Application Nr.	15851238.4
(86)	European Filing Date	2015.10.14
(87)	The European Application's Publication Date	2017.08.23
(30)	Priority	2014.10.15, US, 201462064358 P 2014.12.15, US, 201462092041 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	Corcept Therapeutics Incorporated, 149 Commonwealth Drive, Menlo Park, CA 94025, USA
(72)	Inventor	BELANOFF, Joseph K., 149 Commonwealth Drive, Menlo Park, California 94025, USA HUNT, Hazel, 149 Commonwealth Drive, Menlo Park, California 94025, USA MEIJER, Onno C., Department of Endocrinology and General Internal Medicine Einthoven Laboratory Leiden University Medical Center P.O. Box 9600, 2300 RC Leiden, Nederland VAN DEN HEUVEL, Jose, Leiden University Medical Center, NL-2300 RC Leiden, Nederland
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54)	Title	FATTY LIVER DISEASE TREATMENT USING GLUCOCORTICOID AND MINERALOCORTICOID RECEPTOR ANTAGONISTS
(56)	References Cited:	WO-A2-03/105838, US-A1- 2007 066 557, US-A1- 2009 312 246, US-A1- 2010 144 764, US-A1- 2013 072 486, RAY ET AL: "Discovery and optimization of novel, non-steroidal glucocorticoid receptor modulators", BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS, PERGAMON, AMSTERDAM, NL, vol. 17, no. 17, 4 August 2007 (2007-08-04), pages 4901-4905, XP022184932, ISSN: 0960-894X, DOI: 10.1016/J.BMCL.2007.06.036 HAZEL J. HUNT ET AL: "Discovery of a novel non-steroidal GR antagonist with in vivo efficacy in the olanzapine-induced weight gain model in the rat", BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS, vol. 22, no. 24, 1 December 2012 (2012-12-01), pages 7376-7380, XP055136322, ISSN: 0960-894X, DOI: 10.1016/j.bmcl.2012.10.074 TSUTOMU WADA ET AL: "Spironolactone Improves Glucose and Lipid Metabolism by Ameliorating Hepatic Steatosis and Inflammation and Suppressing Enhanced Gluconeogenesis Induced by High-Fat and High-Fructose Diet", ENDOCRINOLOGY, vol. 151, no. 5, 1 May 2010 (2010-05-01), pages 2040-2049, XP055470049, US ISSN: 0013-7227, DOI: 10.1210/en.2009- 0869

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 av formel Id for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av fettlevversykdom, idet fremgangsmåten omfatter å administrere til et subjekt med behov for dette en terapeutisk virksam mengde av forbindelsen av formel Id, idet
- 5 fettlevversykdommen derved behandles, hvor forbindelsen av formel Id har strukturen:



hvor

- 10 hver R^{1a} er uavhengig av hverandre H, C_{1-6} -alkyl, halogen eller C_{1-6} -haloalkyl;
 R^2 er H eller C_{1-6} -alkyl; og
 hver R^4 er H, C_{1-6} -alkyl, halogen eller C_{1-6} -haloalkyl;
 eller er et salt derav.

2. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvor fettlevversykdommen er
- 15 alkoholrelatert leversykdom (ARLD) eller ikke-alkoholisk fettlevversykdom (NAFLD).

3. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 2, hvor den alkoholrelaterte leversykdom er alkoholisk fettlevversykdom (AFL), alkoholisk steatohepatitt (ASH) eller alkoholisk cirrhose.

20

4. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 2, hvor den ikke-alkoholiske fettlevversykdom er ikke-alkoholisk steatohepatitt (NASH) eller ikke-alkoholisk cirrhose.

- 25 5. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvor hver R^{1a} er C_{1-6} -haloalkyl.

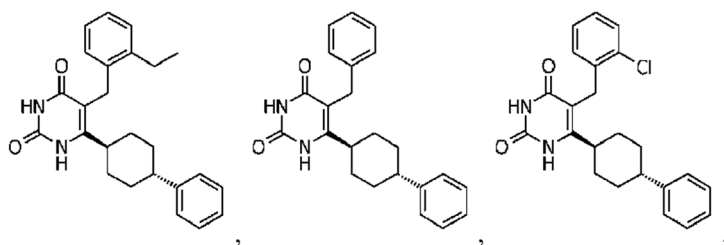
6. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvor hver R^{1a} velges uafhængig af hverandre fra gruppen bestående af H, Me, Et, F, Cl eller $-CF_3$.

7. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvor hver R^{1a} er $-CF_3$.

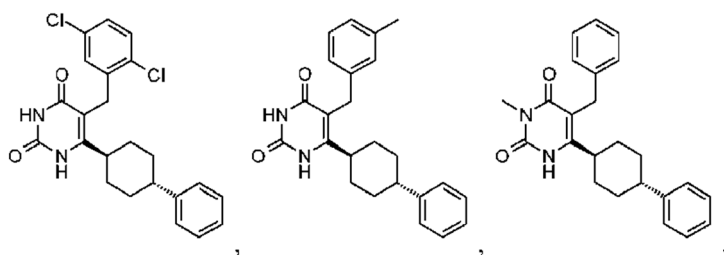
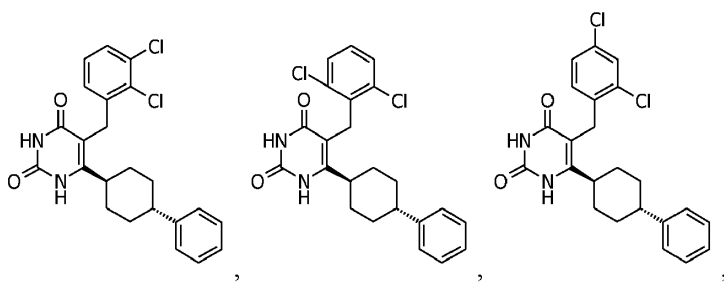
5

8. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvor R^2 is H.

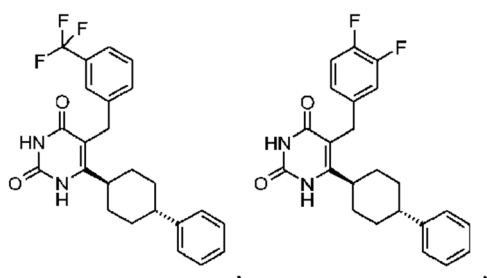
9. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvor forbindelsen velges fra gruppen bestående af

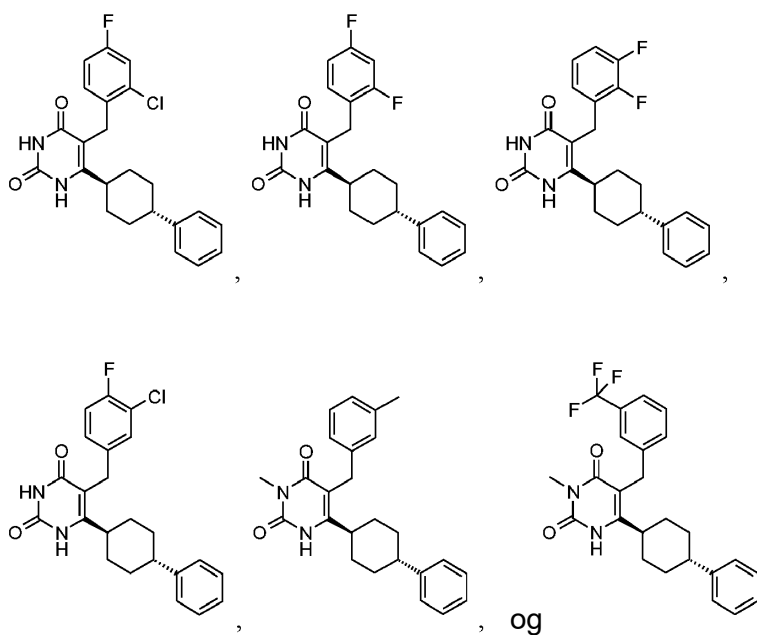


10



15

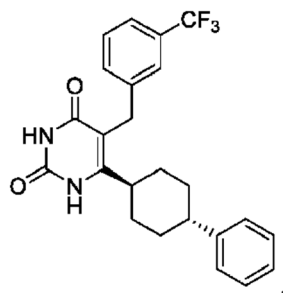




og salter derav.

5

10. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvor forbindelsen har formelen:



eller et salt derav.

10 **11.** Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvor nevnte forbindelse er en antagonist av glukokortikoidreseptor- og mineralokortikoidreseptor-aktivitet.

12. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvor nevnte forbindelse er en mineralokortikoidreseptor-antagonist og har en hemmingskonstant (K_i) mot den humane glukokortikoidreseptor på mellom 0,0001 nanomolar (nM) og 1000 nM.

15