



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3246070 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61P 1/16 (2006.01)
A61K 31/42 (2006.01)
A61P 3/10 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)
C07D 261/08 (2006.01)
C07D 413/12 (2006.01)
C07D 413/14 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2024.05.06
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2024.03.20
(86)	European Application Nr.	17000383.4
(86)	European Filing Date	2012.07.12
(87)	The European Application's Publication Date	2017.11.22
(30)	Priority	2011.07.13, EP, 11005722 2011.07.13, US, 201161507153 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
(62)	Divided application	EP2987532, 2012.07.12
(73)	Proprietor	Gilead Sciences, Inc., 333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, USA
(72)	Inventor	Kinzel, Olaf, Am Hackteufel 8, 69117 Heidelberg, Tyskland Steeneck, Christoph, c/o Phenex Pharmaceuticals AG Donnersbergweg 1, 67059 Ludwigshafen, Tyskland Kremoser, Claus, Gugenmusweg 20, 69121 Heidelberg, Tyskland
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54)	Title	NOVEL FXR (NR1H4) BINDING AND ACTIVITY MODULATING AZOLES
(56)	References Cited:	EP-A1- 1 894 924 WO-A1-2011/020615 WO-A1-00/37077

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/>

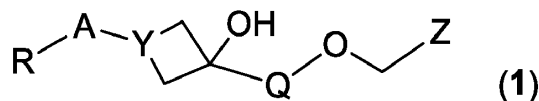
EP3246070

1

Patentkrav

1. Farmasøytisk sammensetning omfattende 7 mg til 350 mg av en forbindelse i samsvar med følgende formel (1), en enantiomer, diastereomer, tautomer eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav

5



hvor

10

R er valgt fra gruppen bestående av COOR₆, CONR₇R₈, tetrazolyl, SO₂NR₇R₈, C₁₋₆-alkyl, SO₂-C₁₋₆-alkyl og H, med R₆ uavhengig valgt fra gruppen bestående av H eller C₁₋₆-alkyl, og R₇ og R₈ uavhengig av hverandre valgt fra gruppen bestående av H, C₁₋₆-alkyl, halo-C₁₋₆-alkyl, C₁₋₆-alkylen-R₉, SO₂-C₁₋₆-alkyl, hvor R₉ er valgt fra gruppen bestående av COOH, OH og SO₃H;

15

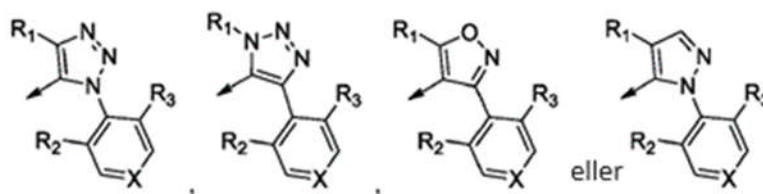
A er valgt fra gruppen bestående av fenyl, pyridyl, pyrimidyl, pyrazolyl, indolyl, tienyl, benztienyl, indazolyl, benzisoksazolyl, benzofuranyl, benzotriazolyl, furanyl, benzotiazolyl, tiazolyl, oksadiazolyl, hver eventuelt substituert med én eller to grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av OH, O-C₁₋₆-alkyl, O-halo-C₁₋₆-alkyl, C₁₋₆-alkyl, halo-C₁₋₆-alkyl, C₃₋₆-sykloalkyl og halogen;

20

Q er valgt fra gruppen bestående av fenyl, pyridyl, tiazolyl, tiofenyl, pyrimidyl, hver eventuelt substituert med én eller to grupper uavhengig valgt fra gruppen bestående av C₁₋₆-alkyl, halo-C₁₋₆-alkyl, halogen og CF₃;

Y er valgt fra N eller CH;

Z er valgt fra



25

hvor

X = CH, N, NO;

R₁ er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, C₁₋₃-alkyl, C₃₋₆-sykloalkyl, C₄₋₅-alkylsykloalkyl, hvor C₁₋₃-alkyl eventuelt er substituert med 1 til 3 substituenten uavhengig valgt fra halogen, hydrokso eller C₁₋₆-alkokso;

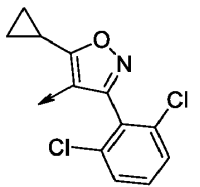
30

2. Farmasøytisk sammensetning for bruk ifølge krav 1 hvor forbindelsen er en forbindelse med formel (1) som angitt i krav 1 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

10



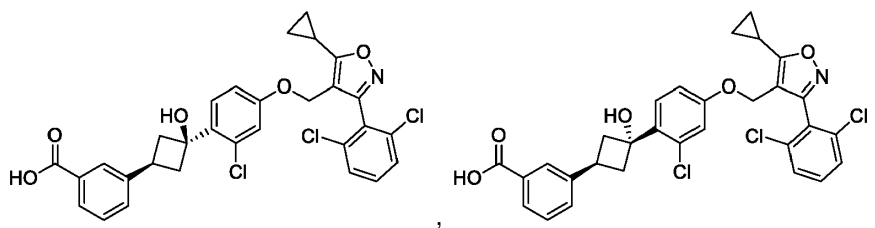
5. Farmasøytisk sammensetning for bruk ifølge ethvert av kravene 1 til 4 hvor Z er



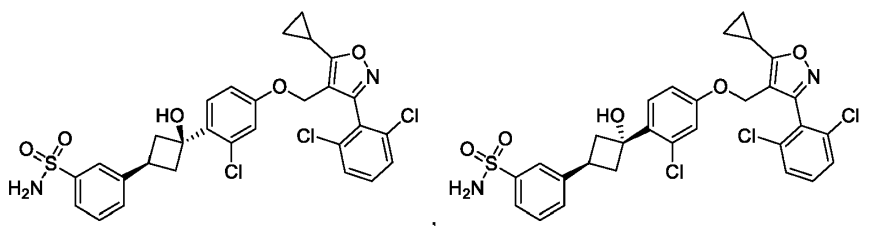
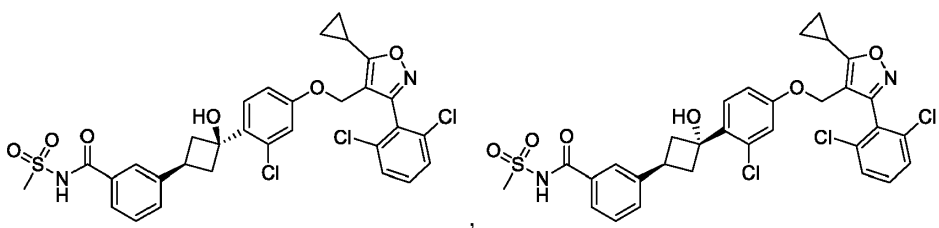
EP3246070

3

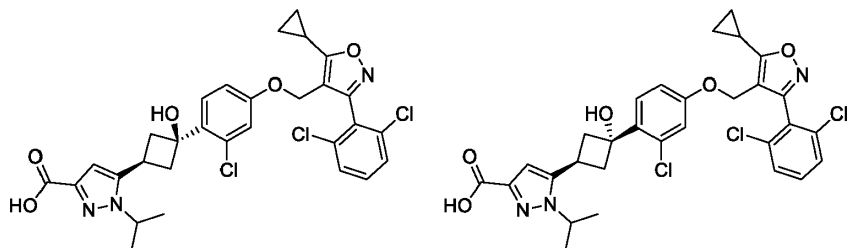
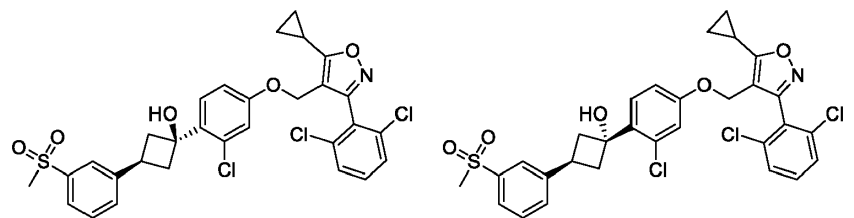
6. Farmasøytisk sammensetning for bruk ifølge ethvert av kravene 1 til 5 hvor forbindelsen med formel (1) er valgt fra

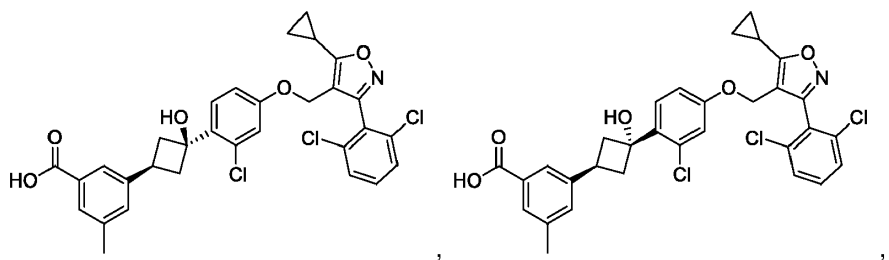
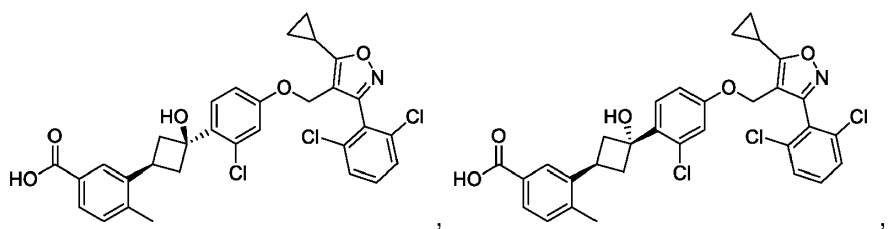
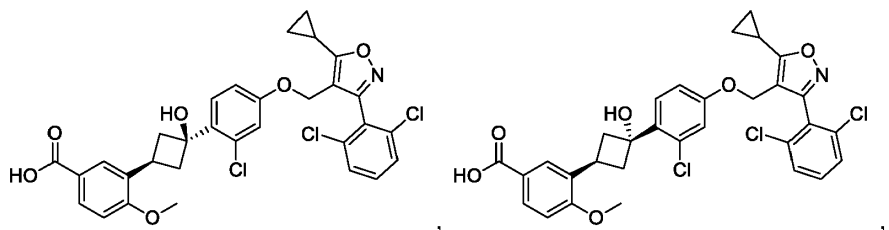
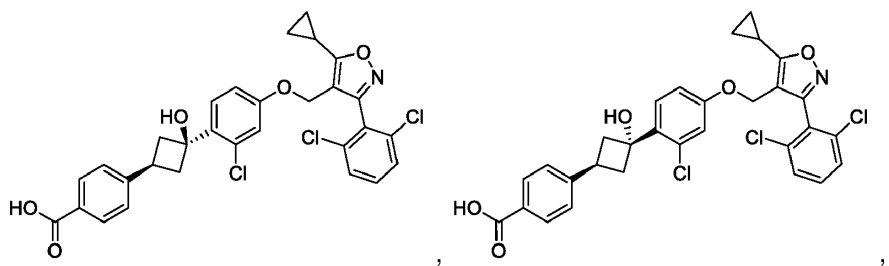
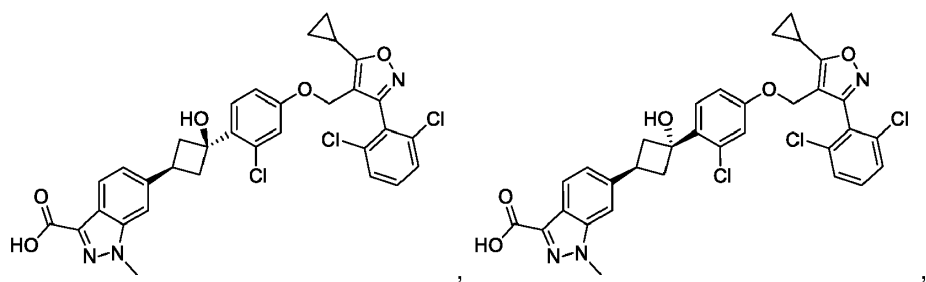


5



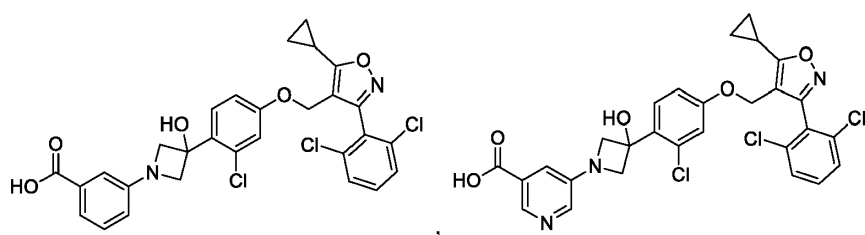
10



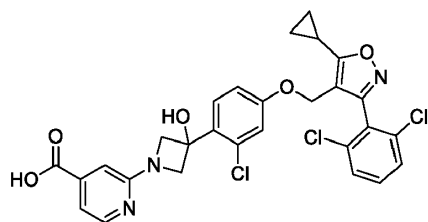


EP3246070

5

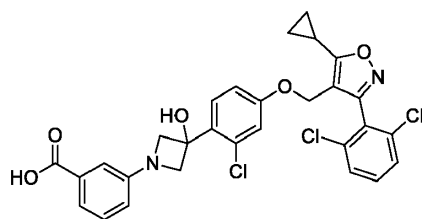


og



5

7. Farmasøytisk sammensetning for bruk ifølge ethvert av kravene 1 til 6 hvor forbindelsen har følgende struktur



10 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

8. Farmasøytisk sammensetning for bruk ifølge ethvert av kravene 1 til 7 formulert for oral, rektal, topisk, parenteral, okulær, pulmonal eller nasal administrering.

15 9. Farmasøytisk sammensetning for bruk ifølge ethvert av kravene 1 til 8, hvor den farmasøytiske sammensetningen er formulert som en tablett, pastill, dispersjon, suspensjon, løsning, kapsel, krem, salve eller aerosol.

10. Farmasøytisk sammensetning for bruk ifølge ethvert av kravene 1 til 8 formulert for oral
20 administrering.

11. Farmasøytisk sammensetning for bruk ifølge krav 10, hvor den farmasøytiske sammensetningen er formulert som en tablett eller kapsel.

EP3246070

6

12. Farmasøytisk sammensetning for bruk ifølge krav 10 eller krav 11, hvor den farmasøytiske sammensetningen er formulert som en tablett.