



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3348557 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 471/04 (2006.01)
A61K 31/437 (2006.01)
A61P 19/06 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

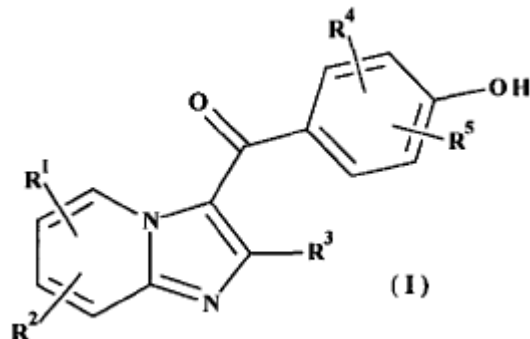
(45)	Translation Published	2020.08.24
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.04.29
(86)	European Application Nr.	16843670.7
(86)	European Filing Date	2016.09.08
(87)	The European Application's Publication Date	2018.07.18
(30)	Priority	2015.09.10, CN, 201510576110
(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	Jiangsu Atom Bioscience And Pharmaceutical Co., Ltd, 99 Chuqiao Road Building 18, Zhenjiang, Jiangsu 212009, Kina
(72)	Inventor	SHI, Dongfang, Building 1899 Jing 15 RoadDingmaoXinqu, ZhenjiangJiangsu 212009, Kina FU, Changjin, Building 1899 Jing 15 RoadDingmaoXinqu, ZhenjiangJiangsu 212009, Kina CHENG, Xi, Building 1899 Jing 15 RoadDingmaoXinqu, ZhenjiangJiangsu 212009, Kina ZHU, Jianghua, Building 1899 Jing 15 RoadDingmaoXinqu, ZhenjiangJiangsu 212009, Kina WEN, Jie, Building 1899 Jing 15 RoadDingmaoXinqu, ZhenjiangJiangsu 212009, Kina GU, Jie, Building 1899 Jing 15 RoadDingmaoXinqu, ZhenjiangJiangsu 212009, Kina
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54)	Title	IMIDAZO[1,2A]PYRIDINES FOR TREATING OR PREVENTING HYPERURICEMIA OR GOUT
(56)	References Cited:	WO-A1-2014/017643, WO-A2-2012/048058, FR-B1- 2 647 451 US-A- 4 400 387, MOOG, C. ET AL.: 'Bicyclic imidazo derivatives, a new class of highly selective inhibitors for the human immunodeficiency virus type 1' ANTIVIRAL RESEARCH vol. 24, no. 4, 31 August 1994, ISSN 0166-3542 page 280, XP055366740

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)



5

eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor:

R1 og R2 er uavhengig valgt fra en eller flere av hydrogen, deuterium, halogen, cyano, hydroksyl, C₁₋₅ alkyl, substituert C₁₋₅ alkyl, C₁₋₃ alkoxy, substituert C₁₋₃ alkoxy, C₁₋₃ alkyltio og substituert C₁₋₃ alkyltio;

10

R3 er valgt fra substituert eller usubstituert C₁₋₄ alkylgruppe og substituert eller usubstituert C₃₋₄ cykloalkyl, og dets substituent er valgt fra gruppen bestående av deuterium, halogen, C₁₋₂ alkyl og C₃₋₄ cykloalkyl;

15

R4 og R5 er uavhengig valgt fra en eller flere av deuterium, halogen, cyano, C₂₋₃ alkenyl, C₂₋₃ alkynyl, C₁₋₃ alkyl, substituert C₁₋₃ alkyl, C₁₋₃ alkoxy, substituert C₁₋₃ alkoxy, C₁₋₃ alkyltio og substituert C₁₋₃ alkyltio;

hvor substituentene i R1, R2, R4 og R5 er uavhengig valgt fra deuterium, halogen, C₁₋₃ alkyl, C₃₋₄ cycloalkyl og C₁₋₃ alkoksyl.

20

2. Forbindelse ifølge krav 1 med formel (I) eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor:

25

R1 og R2 er uavhengig valgt fra en eller flere av hydrogen, deuterium, fluor, klor, brom, cyano, hydroksyl, C₁₋₃ alkyl, substituert C₁₋₃ alkyl, C₁₋₃ alkoksyl, og substituert C₁₋₃ alkoksyl;

hvor substituentene uavhengig er valgt fra gruppen bestående av deuterium, halogen, C₁₋₃ alkyl, C₃₋₄ cycloalkyl og C₁₋₃ alkoksyl.

30

3. Forbindelse ifølge krav 2 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor:
R1 og R2 er uavhengig valgt fra ett eller flere av hydrogen, deuterium, fluor, klor,
5 brom, CN, C₁₋₃ alkyl, C₁₋₃ halogenert alkyl og C₁₋₃ alkoksy.
4. Forbindelse ifølge krav 1 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor:
R3 er valgt fra substituert eller usubstituert C₁₋₃ alkylgruppe og substituert eller
10 usubstituert C₃₋₄ cykloalkyl; hvor substituentene uavhengig er valgt fra gruppen
bestående av deuterium, halogen, C₁₋₂ alkyl og C₃₋₄ cykloalkyl.
5. Forbindelse ifølge krav 1 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor:
15 R4 og R5 er uavhengig valgt fra ett eller flere deuterium, halogen, cyano, etylen,
acetylen, C₁₋₂ alkyl, substituert C₁₋₂ alkyl, C₁₋₂ alkoxy, substituert C₁₋₂ alkoxy, C₁₋₂
alkyltio og substituert C₁₋₂ alkyltio; hvor substituentene uavhengig er valgt fra gruppen
bestående av deuterium, halogen, C₁₋₂ alkyl, C₃₋₄ cycloalkyl og C₁₋₃ alkoksy.
- 20
6. Forbindelse ifølge krav 1 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor:
R4 og R5 er uavhengig valgt fra en eller flere av deuterium, halogen, cyano, C₁₋₂
alkyl, C₁₋₂ halogenert alkyl, C₁₋₂ alkoxy og C₁₋₂ alkylthio.
- 25
7. Forbindelse ifølge krav 1 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav valgt fra
gruppen bestående av:
(3,5-Dibrom-4-hydroksy-fenyl)(2-etylimidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)metanon;
30 (2-Ethylimidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)(4-hydroksy-3,5-diiodofenyl)metanon;
(3-Klor-4-hydroksy-5-jodfenyl)(2-etylimidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)metanon;
3-Klor-5-(2-etylimidazo[1,2-a]pyridin-3-karbonyl)-2-hydroksybenzonitril;
35 (3-Brom-4-hydroksy-5-jodfenyl)(2-etylimidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)metanon;

- (2-Ethylimidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)(4-hydroksy-3-jod-5-metyl-fenyl)-metanon;
- (3-Brom-5-klor-4-hydroksy-fenyl)(2-etyl-6-fluorimidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)metanon;
- 5 (3-Klor-4-hydroksy-5-jodfenyl)(2-etyl-6-fluorimidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)metanon;
- 5-(2-etylimidazo[1,2-a]pyridin-3-karbonyl)-2-hydroksy-3-metylbenzonitril;
- (3-Brom-4-hydroksy-5-(trifluormetyl) fenyl)(2-etylimidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)metanon;
- 10
- (3,5-Dibrom-4-hydroksy-fenyl)(2-etyl-6-metylimidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)metanon;
- (3,5-Dibrom-4-hydroksy-fenyl)(2-etyl-6-metoksyimidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)metanon;
- 15
- 3-Brom-5-(2-etylimidazo[1,2-a]pyridin-3-karbonyl)-2-hydroksybenzonitril;
- 5-(2-etylimidazo[1,2-a]pyridin-3-karbonyl)-2-hydroksy-3-jodbenzonitril;
- 20
- 5-(2-etylimidazo[1,2-a]pyridin-3-karbonyl)-3-fluor-2-hydroksybenzonitril;
- (3,5-Dibrom-4-hydroksy-fenyl)(2-propylimidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)metanon;
- (3-Brom-5-klor-4-hydroksy-fenyl)(2-etylimidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)metanon;
- 25
- (3-Brom-5-fluor-4-hydroksy-fenyl)(2-etyl-6-fluorimidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)metanon;
- (2-Etyl-6-fluorimidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)(3-fluor-4-hydroksy-5-jodfenyl)metanon;
- 30
- (3,5-Dibrom-4-hydroksy-fenyl)(2-etyl-6-hydroksyimidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)metanon;
- (6-Brom-2-ethyl-7-methylimidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)(3,5-dibrom-4-hydroksyfenyl)metanon;
- 35
- (3,5-Dibrom-4-hydroksy-fenyl)(2-etyl-7-(trifluormetyl) imidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)metanon;

3-(3,5-dibrom-4-hydroksyfenyl)-2-etylimidazo[1,2-a]pyridin-6-karbonitril;

(2-Deuterium-3,5-dibrom-4-hydroksy-fenyl)(2-etylimidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)metanon;

5

(6-Deuterium-2-etylimidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)(3,5-dibrom-4-hydroksyfenyl)metanon;

(2-Cyclopropylimidazo[1,2-a]pyridin-3-yl)(3,5-dibrom-4-hydroksyfenyl)metanon;

10

3-Bromo-5-(2-etylimidazo[1,2-a]pyridin-3-karbonyl)-2-hydroksybenzonitril-hydrogenklorid; og

5-(2-etylimidazo[1,2-a]pyridin-3-karbonyl)-2-hydroksy-3-jodbenzonitril-hydroklorid.

15

8. Farmasøytisk sammensetning som omfatter en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav som aktiv ingrediens eller hovedaktiv ingrediens, og en farmasøytisk akseptabel bærer.

20

9. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for bruk som et medikament.

25

10. Forbindelse ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 7 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse for å øke urinsyreutskillelse.

30

11. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse for behandling eller forhindring av hyperurisemi, nefrose eller gikt.