



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3461812 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 211/46 (2006.01)
A61K 31/445 (2006.01)
A61P 3/00 (2006.01)
A61P 9/10 (2006.01)
A61P 25/16 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2022.01.17
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.10.13
(86)	European Application Nr.	18191316.1
(86)	European Filing Date	2015.03.23
(87)	The European Application's Publication Date	2019.04.03
(30)	Priority	2014.03.27, EP, 14162104
(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
(62)	Divided application	EP3122726, 2015.03.23
(73)	Proprietor	Academisch Medisch Centrum, Meibergdreef 9, 1105 AZ Amsterdam Zuidoost, Nederland Universiteit Leiden, Rapenburg 70, 2311 EZ Leiden, Nederland
(72)	Inventor	OVERKLEEF, Herman Steven, c/o Rapenburg 70, 2311 EZ Leiden, Nederland VAN BOECKEL, Stan, c/o Rapenburg 70, 2311 EZ Leiden, Nederland AERTS, Johannes Maria Franciscus Gerardus, c/o Universiteit Leiden, Leiden Institute of Chemistry (LIC) Afdeling Medische Biochemie Einsteinweg 55, 2333 CC Leiden, Nederland GHISAIDOOBE, Amar, c/o Rapenburg 70, 2311 EZ Leiden, Nederland VAN DEN BERG, Richard, c/o Rapenburg 70, 2311 EZ Leiden, Nederland
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54) Title **N-(5-(BIPHEN-4-YLMETHYLOXY)PENTYL)-SUBSTITUTED IMINOSUGARS AS INHIBITORS OF GLUCOSYLCERAMIDE SYNTHASE**

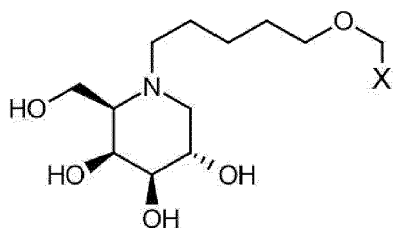
(56) References
Cited: TOM WENNEKES ET AL: "Dual-Action Lipophilic Iminosugar Improves Glycemic Control in Obese Rodents by Reduction of Visceral Glycosphingolipids and Buffering of Carbohydrate Assimilation", JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, vol. 53, no. 2, 2010, pages 689-698, XP055066863, ISSN: 0022-2623, DOI: 10.1021/jm901281m
AMAR T. GHISAIDOOBE ET AL: "Identification and Development of Biphenyl Substituted Iminosugars as Improved Dual Glucosylceramide Synthase/Neutral Glucosylceramidase Inhibitors", JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, vol. 57, no. 21, 24 September 2014 (2014-09-24), pages 9096-9104, XP055192380, ISSN: 0022-2623, DOI: 10.1021/jm501181z

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/>

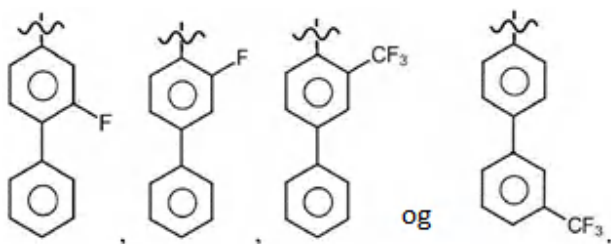
1

PATENTKRAV

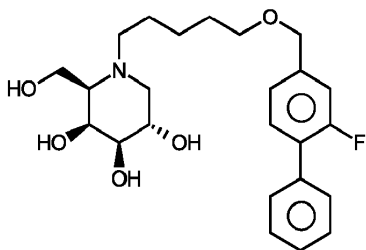
1. Forbindelse med følgende struktur:



5 hvor X er valgt blant:

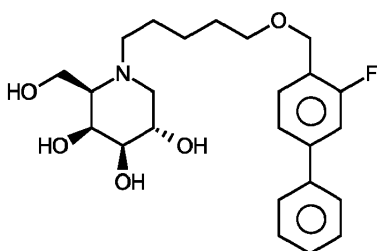


2. Forbindelse ifølge krav 1, hvor forbindelsen er:



10

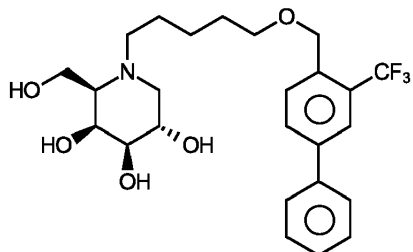
3. Forbindelse ifølge krav 1, hvor forbindelsen er:



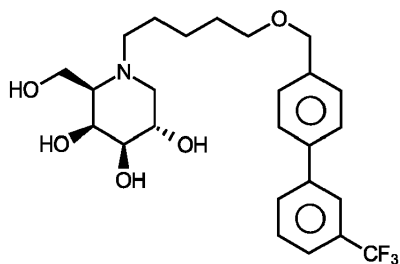
15

2

4. Forbindelse ifølge krav 1, hvor forbindelsen er:



5 5. Forbindelse ifølge krav 1, hvor forbindelsen er:



10 6. Farmasøytisk sammensetning omfattende en forbindelse ifølge hvilket som helst av kravene 1-5 og et farmasøytisk akseptabelt hjelpestoff.

15 7. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-5 eller en farmasøytisk sammensetning ifølge krav 6 for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av menneskekroppen eller dyrekroppen ved terapi.

20 8. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-5 eller en farmasøytisk sammensetning ifølge krav 6 for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av en sykdom som involverer uregelmessige nivåer av glykosylseramid og/eller høyere glykosfingolipider.

9. Forbindelse for anvendelse eller farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 8, hvor sykdommen som involverer uregelmessige nivåer av glykosylseramid og/eller høyere glykosfingolipider er en lysosomal lagringsforstyrrelse, slik som
5 Gauchers sykdom, Fabrys sykdom, Tay-Sachs sykdom, Sandhoffs sykdom, GM1 gangliosidose, Sialidosis, Niemann Picks sykdom type C og Action Myoclonic Renal Failure syndrom, eller et symptom på en av sykdommene samlet klassifisert som metabolsk syndrom, som fedme, insulinresistens, hyperlipidemi, hyperkolesterolemi, polycystisk
10 nyresykdom, type II diabetes og kronisk betennelse, eller en nevrogenativ lidelse, for eksempel Parkinsons sykdom eller Lewy-body demens, eller åreforkalkning.

10. Forbindelse for anvendelse eller farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 8 eller 9, der sykdommen som involverer
15 uregelmessige nivåer av glykosylseramid og/eller høyere glykosfingolipider er Gauchers sykdom, Tay-Sachs sykdom, Sandhoffs sykdom, GM1 gangliosidose, Sialidosis, Niemann Picks sykdomstype C, Action Myoclonic Renal Failure syndrom, Parkinsons sykdom eller Lewy-
20 body demens.

11. Forbindelse for anvendelse eller farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 8-10, hvor sykdommen som involverer uregelmessige nivåer av glykosylseramid
25 og/eller høyere glykosfingolipider er Gauchers sykdom eller Niemann Picks sykdom type C.

12. Anvendelse av en forbindelse ifølge hvilket som helst av kravene 1-5 for inhibering av glykosylseramidsyntase (GCS) og/eller nøytral
30 glukosylseramidase (GBA2) in vitro.