



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3587417 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

C07D 417/14 (2006.01) A61P 13/00 (2006.01)
A61K 31/433 (2006.01) A61P 25/16 (2006.01)
A61K 31/4439 (2006.01) A61P 25/28 (2006.01)
A61K 31/497 (2006.01) A61P 29/00 (2006.01)
A61K 31/501 (2006.01) A61P 31/18 (2006.01)
A61K 31/506 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2022.03.28
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2022.01.05
(86)	European Application Nr.	19181710.5
(86)	European Filing Date	2015.12.07
(87)	The European Application's Publication Date	2020.01.01
(30)	Priority	2014.12.09, EP, 14196954
(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
	Designated Validation States:	MA
(62)	Divided application	EP3230281, 2015.12.07
(73)	Proprietor	Bayer AG, Kaiser-Wilhelm-Allee 1, 51373 Leverkusen, Tyskland
(72)	Inventor	Davenport, Adam, c/o Evotec (UK) Limited, 114 Innovation Drive, Milton Park, Hamburg, Abingdon Oxfordshire OX14 4RZ, Storbritannia Bräuer, Nico, Ruppiner Str. 103, 14612 Falkensee, Tyskland Fischer, Oliver Martin, Brester Ring 4, 13127 Berlin, Tyskland Rotgeri, Andrea, Damwildsteig 21, 13503 Berlin, Tyskland Rottmann, Antje, Schneehornpfad 11A, 13089 Berlin, Tyskland Neagoe, Ioana, c/o Evotec SE, Essener Bogen 7, 22419 Hamburg, Tyskland Nagel, Jens, Gemeindegarten 9, 55442 Daxweiler, Tyskland Godinho-Coelho, Anne-Marie, c/o Evotec SE, Essener Bogen 7, 22419 Hamburg, Tyskland Klar, Jürgen, Leipziger Straße 6, 42109 Wuppertal, Tyskland
(74)	Agent or Attorney	RWS, Europa House, Chiltern Park, Chiltern Hill, SL99FG CHALFONT ST PETER, Storbritannia

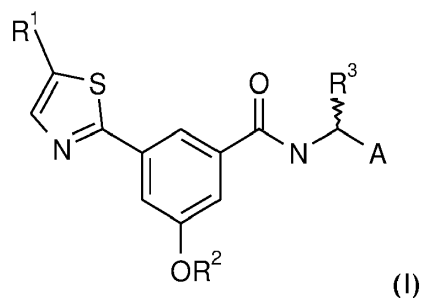
(54) Title **1,3-THIAZOL-2-YL SUBSTITUTED BENZAMIDES**

(56) References
Cited: WO-A2-2009/110985
 WO-A2-2013/173441
 US-A1- 2013 296 310

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 på den generelle formelen (I):



5 der

R¹ står for C₁–C₄-alkyl;

R² står for -(CH₂)_q-morfolinyl som er substituert med R^c;

R³ står for C₁–C₄-alkyl;

R^c står for metyl;

10 A står for CF₃-pyrimidinyl

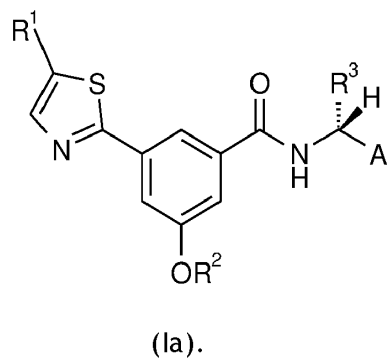
q står for et heltall av 1;

eller en enantiomer, en diastereomer, et racemat, et hydrat, et solvat, eller et salt av dette,

eller en blanding av dette.

15

2. Forbindelse ifølge krav 1 på den generelle formelen (Ia):



3. Forbindelse ifølge et av kravene 1 til 2, der

20 R¹ står for metyl eller etyl.

4. Forbindelse ifølge et av kravene 2 til 3, der

R³ står for metyl.

25 5. Forbindelse ifølge et av kravene 1 til 4, der A står for 2-CF₃-pyrimidin-5-yl.

6. Forbindelse ifølge krav 1, der
R² står for (4-metylmorfolin-2-yl)metyl.
7. Forbindelse ifølge krav 6, der
5 R² står for [(2R)-4-metylmorfolin-2-yl)metyl eller [(2S)-4-metyl-morfolin-2-yl)metyl.
8. Forbindelse ifølge krav 7, der R² står for [(2R)-4-metylmorfolin-2-yl)metyl.
9. Forbindelse ifølge et av kravene 1 til 8, nemlig
10 3-(5-etyl-1,3-tiazol-2-yl)-5-{[(2R)-4-metylmorfolin-2-yl]metoksy}-N-{(1R)-1-[2-(trifluormetyl)pyrimidin-5-yl]etyl}benzamid;
3-{[(2R)-4-metylmorfolin-2-yl]metoksy}-5-(5-metyl-1,3-tiazol-2-yl)-N-{(1R)-1-[2-(trifluormetyl)pyrimidin-5-yl]etyl}benzamid.
- 15 10. Forbindelse ifølge krav 9, nemlig 3-{[(2R)-4-metylmorfolin-2-yl]metoksy}-5-(5-metyl-1,3-tiazol-2-yl)-N-{(1R)-1-[2-(trifluormetyl)pyrimidin-5-yl]etyl}benzamid.
11. Farmasøytisk sammensetning som omfatter forbindelse ifølge et av kravene 1 til 10, eller en enantiomer, en diastereomer, et racemat, et hydrat, et solvat, et farmasøytisk
20 akseptabelt salt av dette, eller en blanding av dette, og et farmasøytisk akseptabelt fortynningsmiddel eller en farmasøytisk akseptabel bærer.
12. Bruk av forbindelse ifølge et av kravene 1 til 10, eller en enantiomer, en diastereomer, et racemat, et hydrat, et solvat, eller et farmasøytisk akseptabelt salt av
25 dette, eller en blanding av dette, til framstilling av et legemiddel for forebygging eller behandling av en sykdom.
13. Forbindelse ifølge et av kravene 1 til 10, eller enantiomer, en diastereomer, et racemat, et hydrat, et solvat, eller et farmasøytisk akseptabelt salt av dette, eller en
30 blanding av dette, til bruk i behandlingen av en sykdom.
14. Forbindelse til bruk ifølge krav 13, der sykdommen er en sykdom valgt fra gruppen av urogenital, gastrointestinal, respiratorisk eller smerterelatert sykdom, tilstand eller lidelse; gynekologiske sykdommer inkludert dysmenoré, dyspareuni og endometriose;
35 endometriose-assosierte smerter;
endometriose-assosierte symptomer, der symptomene er dysmenoré, dyspareuni, dysuri eller dyschezi; sykdomstilstander i urinveiene som er assosiert med vanskeliggjort blæretømming; tilstander med urininkontinens (reduisert blærekapasitet, økt frekvens av

urinering, urgeinkontinens, stressinkontinens, eller hyperreaktiv blære); godartet prostatahypertrofi;

prostatahyperplasi; prostatitt; detrusorhyperrefleksi; overaktiv blære og symptomer som er relatert til overaktiv blære, der symptomene er økt urineringsfrekvens, nokturni,

5 urineringstrang eller urgeinkontinens;

bekkenhypersensitivitet; uretritt; prostatitt; prostatodyn; cystitt; idiopatisk blærehypersensitivitet; epilepsi; partielle og generaliserte anfall; luftveislidelser inkludert kronisk obstruktiv lungesykdom (COPD), astma, bronkospasme, kronisk hoste og liknende; mage-tarm-lidelser inkludert irritabel tarm-syndrom (IBS), inflammatorisk tarmsykdom (IBD), gallekolikk og andre galleveissykdommer, nyrekolikk, diaré-dominant IBS, gastroøsofageal refluks, gastrointestinal distensjon, Crohns sykdom;

10 Parkinsons sykdom; Alzheimers sykdom; hjerteinfarkt; lipidforstyrrelser;

Parkinsons sykdom; Alzheimers sykdom; hjerteinfarkt; lipidforstyrrelser;

og smerteassosierte sykdommer valgt fra gruppen som består av hyperalgesi, allodyn, funksjonelle tarmsykdommer (irritabel tarm-syndrom), artritt (osteoartritt, revmatoid artritt), forbrenning, migrene eller klasehodepine, nerveskade, nevritt, nevralgier, forgiftning, iskemisk skade, interstitiell cystitt, traumatisk nerveskade, post-traumatiske skader (inkludert brudd og idrettsskader), trigeminal nevralgi, småfibernevropati, diabetisk nevropati, kronisk artritt og relaterte nevralgier, HIV og HIV-behandlingsindusert nevropati, kløe.

20

15. Forbindelse til bruk ifølge krav 13, der sykdommen er assosiert med smertesyndromer, inkludert akutte, kroniske, betennelses- og nevropatiske smerter.

16. Forbindelse til bruk ifølge krav 15, der smertesyndromet er valgt fra gruppen av betennelsessmerter, operasjonssmerter, viscerale smerter, tannmerter, premenstruelle smerter, endometriose-assosierte smerter, sentrale smerter, smerter på grunn av brennende tunge-syndrom, smerter på grunn av forbrenning, smerter på grunn av migrene, klasehodepine, smerter på grunn av nerveskade, smerter på grunn av nevritt, nevralgier, smerter på grunn av forgiftning, smerter på grunn av iskemisk skade, smerter på grunn av interstitiell cystitt, kreftsmarter, smerter på grunn av virus-, parasitt- eller bakterieinfeksjoner, smerter på grunn av traumatisk nerveskade, smerter på grunn av post-traumatiske skader (inkludert brudd og idrettsskader), smerter på grunn av trigeminal nevralgi, smerter assosiert med småfibernevropati, smerter assosiert med diabetisk nevropati, kroniske smerter i nedre rygg, fantomsmerter i lemmene, bekkensmertesyndrom, kroniske bekkensmerter, nevromsmerter, komplekst regionalt smertesyndrom, smerter assosiert med gastrointestinal distensjon, kroniske artrittsmerter og relaterte nevralgier, og smerter assosiert med kreft, smerter assosiert med kjemoterapi, HIV og HIV-behandlingsindusert nevropati; og smerter assosiert med

35

sykdommer eller lidelser valgt fra gruppen som består av hyperalgesi, allodyni, funksjonelle tarmsykdommer (irritabel tarm-syndrom) og artritt (osteoartritt, revmatoid artritt).

- 5 17. Forbindelse til bruk ifølge krav 14, der sykdommen er en sykdom valgt fra gruppen av gynekologisk sykdom, dysmenoré, dyspareuni, endometriose, endometriose-assosierte smerter, endometriose-assosierte symptomer, dysuri eller dyschezi.