



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3700913 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07F 9/09 (2006.01)
A61P 9/00 (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2022.02.07
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.11.10
(86)	European Application Nr.	18785394.0
(86)	European Filing Date	2018.10.17
(87)	The European Application's Publication Date	2020.09.02
(30)	Priority	2017.10.24, EP, 17197935
(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 ; TN
(73)	Proprietor	Bayer Aktiengesellschaft, Kaiser-Wilhelm-Allee 1, 51373 Leverkusen, Tyskland Bayer Pharma Aktiengesellschaft, Müllerstrasse 178, 13353 Berlin, Tyskland
(72)	Inventor	COLLIN-KROEPELIN, Marie-Pierre, 42113 Wuppertal, Tyskland KOLKHOF, Peter, 42113 Wuppertal, Tyskland NEUBAUER, Thomas, 42111 Wuppertal, Tyskland FUERSTNER, Chantal, 45478 Mülheim/Ruhr, Tyskland POOK, Elisabeth, 42109 Wuppertal, Tyskland WITWER, Matthias, Beat, 4125 Riechen, Sveits SCHMECK, Carsten, 45472 Mülheim, Tyskland WASNAIRE, Pierre, 40225 Düsseldorf, Tyskland SCHIRMER, Heiko, 42655 Solingen, Tyskland CERNECKA, Hana, 42119 Wuppertal, Tyskland DROEBNER, Karoline, 42553 Velbert, Tyskland TINEL, Hanna, 42113 Wuppertal, Tyskland BUCHMUELLER, Anja, 45259 Essen, Tyskland MONDRITZKI, Thomas, 45130 Essen, Tyskland KRETSCHMER, Axel, 42113 Wuppertal, Tyskland LUSTIG, Klemens, 42113 Wuppertal, Tyskland FRICKE, Robert, 50735 Köln, Tyskland LEVILAIN, Guillaume, 42117 Wuppertal, Tyskland KRENZ, Ursula, 42799 Leichlingen, Tyskland WITOWSKI, Norbert, 38302 Wolfenbüttel, Tyskland
(74)	Agent or Attorney	RWS, Europa House, Chiltern Park, Chiltern Hill, SL99FG CHALFONT ST PETER, Storbritannia

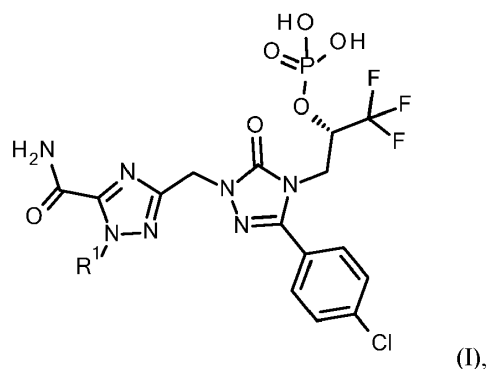
(56) References

Cited: WO-A1-2016/071212
WO-A1-2017/191107
WO-A1-2017/191102

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/>

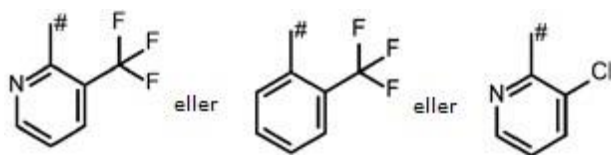
Patentkrav

1. Forbindelse på den generelle formelen (I)



5 der

R¹ står for en gruppe på formelen

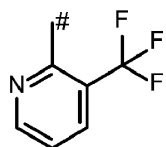


der

står for festepunktet til 1,2,4-triazolyl-ringen,

10 eller én av de farmasøytisk akseptable saltene av denne, solvatene av denne eller solvatene av saltene av denne.

2. Forbindelse på den generelle formelen (I) ifølge krav 1, karakterisert ved at R¹ står for en gruppe på formelen



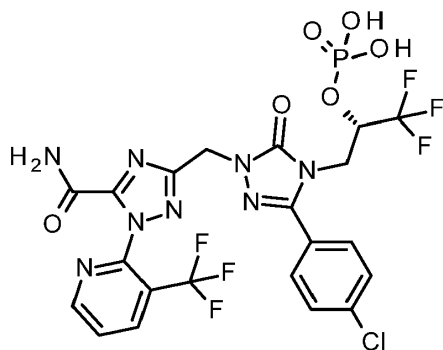
15

der

står for festepunktet til 1,2,4-triazolyl-ringen.

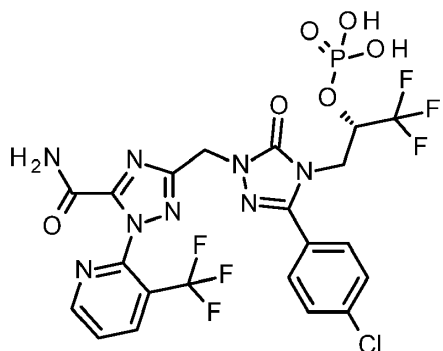
3. (2S)-3-[1-(5-karbamoyl-1-[3-(trifluormetyl)pyridin-2-yl]-1H-1,2,4-triazol-3-yl)metyl]-3-(4-klorfenyl)-5-okso-1,5-dihydro-4H-1,2,4-triazol-4-yl]-1,1,1-trifluorpropan-2-yl-dihydrogenfosfat ifølge krav 1 på formelen nedenfor

20

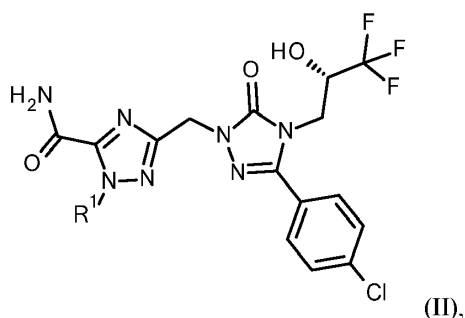


eller én av de farmasøytisk akseptable saltene av denne, solvatene av denne eller solvatene av saltene av denne.

- 5 4. (2S)-3-[1-(5-karbamoyl-1-[3-(trifluormetyl)pyridin-2-yl]-1H-1,2,4-triazol-3-yl)metyl]-3-(4-klorfenyl)-5-okso-1,5-dihydro-4H-1,2,4-triazol-4-yl]-1,1,1-trifluorpropan-2-yl-dihydrogenfosfat ifølge krav 1 på formelen nedenfor



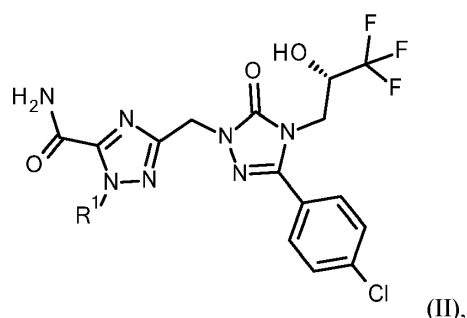
- 10 5. Framgangsmåte for å framstille forbindelse på den generelle formelen (I) eller én av de farmasøytisk akseptable saltene av denne, solvatene av denne eller solvatene av saltene av denne ifølge krav 1, karakterisert ved at
[A] en forbindelse på formelen



- 15 der

R^1 har betydningen som er definert for forbindelsene på den generelle formelen (I) som er gitt i krav 1, blir reagert i det første trinnet med fosforoksyklorid og i det andre trinnet blir hydrolysert slik at det gis en forbindelse på den generelle formelen (I),
eller

[B] en forbindelse på formelen



der

R¹ har betydningen som er definert for forbindelsene på den generelle formelen (I) som er gitt i krav 1, blir reagert i det første trinnet med tetrabenzylidifosfat og i det andre trinnet blir benzylgruppene fjernet under reduserende forhold slik at det gis en forbindelse på den generelle formelen (I), eventuelt etterfulgt, der det passer, av å konvertere forbindelsen på den generelle formelen (I) til de respektive farmasøytisk akseptable saltene av denne, solvatene av denne eller solvatene av saltene av denne ved å behandle den med de korresponderende løsemidlene og/eller basene.

6. Forbindelse ifølge et av kravene 1 til 4 til bruk i behandling og/eller forebygging av sykdommer.

7. Forbindelse ifølge et av kravene 1 til 4 til bruk for å behandle og/eller forebygge akutte og kroniske nyresykdommer, inkludert diabetisk nefropati, akutt og kronisk hjertefeil, preeklampsi, perifer arteriesykdom, koronar mikrovaskulær dysfunksjon, Raynauds syndrom, dysmenoré, kardiorenalt syndrom, hypervolemisk og euvolemisk hyponatremi, levercirrhose, ascites, ødem og syndrom med upassende utskillelse av antidiuretisk hormon (SIADH).

8. Bruk av forbindelse ifølge et av kravene 1 til 4 for å framstille en farmasøytisk sammensetning for å behandle og/eller forebygge akutte og kroniske nyresykdommer, inkludert diabetisk nefropati, akutt og kronisk hjertefeil, preeklampsi, perifer arteriesykdom, koronar mikrovaskulær dysfunksjon, Raynauds syndrom, dysmenoré, kardiorenalt syndrom, hypervolemisk og euvolemisk hyponatremi, levercirrhose, ascites, ødem og syndrom med upassende utskillelse av antidiuretisk hormon (SIADH).

9. Farmasøytisk sammensetning som omfatter forbindelse ifølge et av kravene 1 til 4 og ett eller flere farmasøytisk akseptable hjelpestoffer.

10. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 9 som omfatter ett eller flere første virkestoffer, spesielt forbindelser på den generelle formelen (I) ifølge et av kravene 1 til 4, og ett eller flere ytterligere virkestoffer, spesielt ett eller flere ytterligere terapeutiske midler valgt fra gruppen som består av diuretika, angiotensin II-antagonister, ACE-hemmere, beta-reseptorblokkere, mineralkortikoid-reseptorantagonister, organiske nitrater, NO-donorer, aktivatorer og stimulatorer for den løselige guanylatsyklasen, og positiv-inotrope midler, betennelseshemmende midler, immundempende midler, fosfatbindere og/eller forbindelser som modulerer vitamin D-metabolismen.
- 10 11. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 9 eller 10 til bruk for å behandle og/eller forebygge akutte og kroniske nyresykdommer, inkludert diabetisk nefropati, akutt og kronisk hjertefeil, preeklampsi, perifer arteriesykdom, koronar mikrovaskulær dysfunksjon, Raynauds syndrom, dysmenoré, kardiorenalt syndrom, hypervolemisk og euolemisk hyponatremi, levercirrhose, ascites, ødem og syndrom med upassende utskillelse av antidiuretisk hormon (SIADH).
- 15