



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3814331 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 401/14 (2006.01)
A61K 31/404 (2006.01)
A61P 1/16 (2006.01)
C07D 209/18 (2006.01)
C07D 403/10 (2006.01)
C07D 405/10 (2006.01)
C07D 405/14 (2006.01)
C07D 409/04 (2006.01)
C07D 409/14 (2006.01)
C07D 413/04 (2006.01)
C07D 417/14 (2006.01)
C07D 471/04 (2006.01)
C07D 487/04 (2006.01)
C07D 495/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

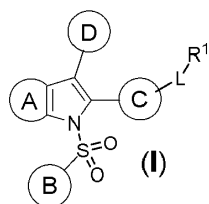
(45)	Translation Published	2023.08.07
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.06.14
(86)	European Application Nr.	19735528.2
(86)	European Filing Date	2019.06.28
(87)	The European Application's Publication Date	2021.05.05
(30)	Priority	2018.06.28, EP, 18180450
(84)	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	OrsoBio, Inc., 2671 Marshall Drive, Palo Alto, CA 94303, USA
(72)	Inventor	GEGE, Christian, Mochentalerweg 26, 89584 Ehingen, Tyskland KINZEL, Olaf, Am Hackteufel 8, 69117 Heidelberg, Tyskland HAMBRUCH, Eva, Kloppenheimer Strasse 29A, 68239 Mannheim, Tyskland BIRKEL, Manfred, Lohndorfstrasse 23, 64342 Seeheim-Jugenheim, Tyskland KREMOSER, Claus, Mühlthalstrasse 121a, 69121 Heidelberg, Tyskland DEUSCHLE, Ulrich, Maulbeerstück 11, 67346 Speyer, Tyskland
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54)	Title	NOVEL LXR MODULATORS WITH BICYCLIC CORE MOIETY
(56)	References Cited:	WO-A1-2008/119657

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. En forbindelse representert ved formel (I)



et glysinkonjugat, taurokonjugat, enantiomer, diastereomer, tautomer, *N*-oksid, solvat eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori

(A)

er en annelert 5- til 6-leddet syklus som danner en 6-leddet aryl eller en 5- til 6-leddet heteroaryl inneholdende 1 til 3 heteroatomer uavhengig valgt fra N, O og S, hvori denne syklusen er usubstituert eller substituert med 1 til 4 substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CN, SF₅, NO₂, C₁₋₆-alkyl, okso, C₀₋₆-alkylen-OR¹¹, C₀₋₆-alkylen-(3- til 6-leddet sykloalkyl), C₀₋₆-alkylen-(3- til 6-leddet heterosykloalkyl), C₀₋₆-alkylenS(O)_nR¹¹, C₀₋₆-alkylen-NR¹¹SO₂R¹¹, C₀₋₆-alkylen-S(O)₂NR¹¹R¹², C₀₋₆-alkylen-NR¹¹SO₂NR¹¹R¹², C₀₋₆-alkylen-CO₂R¹¹, O-C₁₋₆-alkylen-CO₂R¹¹, C₀₋₆-alkylen-O-COR¹¹, C₀₋₆-alkylen-CONR¹¹R¹², C₀₋₆-alkylen-NR¹¹-COR¹¹, C₀₋₆-alkylen-NR¹¹-CONR¹¹R¹², C₀₋₆-alkylen-O-CONR¹¹R¹², C₀₋₆-alkylen-NR¹¹-CO₂R¹¹ og C₀₋₆-alkylen-NR¹¹R¹²,

hvori alkyl, alkylen, sykloalkyl og heterosykloalkyl er usubstituert eller substituert med 1 til 6 substituenten uavhengig valgt fra halogen, CN, okso, hydroksy, CO₂H, CO₂-C₁₋₄-alkyl, CONHCH₂CO₂H, CONH(CH₂)₂SO₃H, C₁₋₄-alkyl, halogen-C₁₋₄-alkyl, O-C₁₋₄-alkyl og O-halogen-C₁₋₄-alkyl; og

hvori eventuelt to tilstøtende substituenten på aryl- eller heteroaryldelen danner en 5- til 8-leddet delvis umettet syklus som eventuelt inneholder 1 til 3 heteroatomer uavhengig valgt fra O, S eller N, og

hvori den nydannede syklusen er usubstituert eller substituert med 1 til 3 substituenten uavhengig valgt fra halogen, CN, C₁₋₄-alkyl, halogen-C₁₋₄-alkyl, 3- til 6-leddet sykloalkyl, halo-(3- til 6-leddet sykloalkyl), 3- til 6-leddet heterosykloalkyl, halo-(3- til 6-leddet heterosykloalkyl), OH, okso, CO₂H, CO₂-C₁₋₄-alkyl, CONHCH₂CO₂H, CONH(CH₂)₂SO₃H, O-C₁₋₄-alkyl og O-halogen-C₁₋₄-alkyl;

(B)

er valgt fra gruppen bestående av 3- til 10-leddet sykloalkyl, 3- til 10-leddet heterosykloalkyl inneholdende 1 til 3 heteroatomer uavhengig valgt fra N, O og S, 6- til 14-leddet aryl og 5- til 14-leddet heteroaryl som inneholder 1 til 4 heteroatomer uavhengig valgt fra N, O og S, hvori sykloalkyl, heterosykloalkyl, aryl og heteroaryl er usubstituert eller substituert med 1 til 6 substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CN, SF₅, NO₂, okso, C₁₋₄-alkyl, C₀₋₆-alkylen-OR²¹, C₀₋₆-alkylen-(3- til 6-leddet sykloalkyl), C₀₋₆-alkylen-(3- til 6-leddet heterosykloalkyl), C₀₋₆-alkylen-S(O)_nR²¹, C₀₋₆-alkylen-NR²¹SO₂R²¹, C₀₋₆-alkylen-S(O)₂NR²¹R²², C₀₋₆-alkylen-NR²¹SO₂NR²¹R²², C₀₋₆-alkylen-CO₂R²¹, O-C₁₋₆-alkylen-CO₂R²¹, C₀₋₆-alkylen-O-COR²¹, C₀₋₆-alkylen-CONR²¹R²², C₀₋₆-alkylen-NR²¹-COR²¹, C₀₋₆-alkylen-NR²¹ CONR²¹R²², C₀₋₆-alkylen-O-CONR²¹R²², C₀₋₆-alkylen-NR²¹-CO₂R²¹ og C₀₋₆-

alkylen-NR²¹R²²,

hvor i alkyl, alkylen, sykloalkyl og heterosykloalkyl er usubstituert eller substituert med 1 til 6 substituent uavhengig valgt fra halogen, CN, okso, hydroksy, CO₂H, CO₂-C₁₋₄-alkyl, CONHCH₂CO₂H, CONH(CH₂)₂SO₃H, C₁₋₄-alkyl, halogen-C₁₋₄-alkyl, O-C₁₋₄-alkyl og O-halogen-C₁₋₄-alkyl,

og hvor i eventuelt to tilstøtende substituent på aryl- eller heteroaryldelen danner en 5- til 8-leddet delvis umettet syklus som eventuelt inneholder 1 til 3 heteroatomer uavhengig valgt fra O, S eller N, og

hvor i denne tilleggssyklusen er usubstituert eller substituert med 1 til 4 substituent uavhengig valgt fra halogen, CN, okso, OH, CO₂H, CO₂-C₁₋₄-alkyl, CONHCH₂CO₂H, CONH(CH₂)₂SO₃H, C₁₋₄-alkyl, halogen-C₁₋₄-alkyl, O-C₁₋₄-alkyl og O-halogen-C₁₋₄-alkyl,

og hvor i eventuelt to tilstøtende substituent på sykloalkyl- eller heterosykloalkyldelen danner en 5- til 6-leddet umettet syklus som eventuelt inneholder 1 til 3 heteroatomer uavhengig valgt fra O, S eller N,

hvor i denne tilleggssyklusen er usubstituert eller substituert med 1 til 4 substituent uavhengig valgt fra halogen, CN, okso, OH, CO₂H, CO₂-C₁₋₄-alkyl, CONHCH₂CO₂H, CONH(CH₂)₂SO₃H, C₁₋₄-alkyl, halogen-C₁₋₄-alkyl, O-C₁₋₄-alkyl og O-halogen-C₁₋₄-alkyl;

(C)

er valgt fra gruppen bestående av 6- eller 10-leddet aryl og 5- til 10-leddet heteroaryl inneholdende 1 til 3 heteroatomer uavhengig valgt fra N, O og S,

hvor i sykloalkyl, heterosykloalkyl, aryl og heteroaryl er usubstituert eller substituert med 1 til 4 substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CN, SF₅, NO₂, okso, C₁₋₄-alkyl, C₀₋₆-alkylen-OR³¹, C₀₋₆-alkylen-(3- til 6-leddet sykloalkyl), C₀₋₆-alkylen-(3- til 6-leddet heterosykloalkyl), C₀₋₆-alkylen-(6-leddet aryl), C₀₋₆-alkylen-(5- til 6-leddet heteroaryl), C₀₋₆-alkylen-S(O)_nR³¹, C₀₋₆-alkylen-NR³¹SO)₂R³¹, C₀₋₆-alkylen-S(O)₂NR³¹R³², C₀₋₆-alkylen-NR³¹SO)₂NR³¹R³², C₀₋₆-alkylen-CO₂R³¹, O-C₁₋₆-alkylen-CO₂R³¹, C₀₋₆-alkylen-O-COR³¹, C₀₋₆-alkylen-CONR³¹R³², C₀₋₆-alkylen-NR³¹-COR³¹, C₀₋₆-alkylen-NR³¹-CONR³¹R³², C₀₋₆-alkylen-O-CONR³¹R³², C₀₋₆-alkylen-NR³¹-CO₂R³¹ og C₀₋₆-alkylen-NR³¹R³², hvor i alkyl, alkylen, sykloalkyl, heterosykloalkyl, aryl og heteroaryl er usubstituert eller substituert med 1 til 6 substituent uavhengig valgt fra halogen, CN, okso, hydroksy, CO₂H, CO₂-C₁₋₄-alkyl, CONHCH₂CO₂H, CONH(CH₂)₂SO₃H, C₁₋₄-alkyl, halogen-C₁₋₄-alkyl, O-C₁₋₄-alkyl og O-halogen-C₁₋₄-alkyl;

og hvor i eventuelt to tilstøtende substituent på aryl- eller heteroaryldelen danner en 5- til 8-leddet delvis umettet syklus som eventuelt inneholder 1 til 3 heteroatomer uavhengig valgt fra O, S eller N, og

hvor i denne tilleggssyklusen er usubstituert eller substituert med 1 til 4 substituent uavhengig valgt fra halogen, CN, okso, OH, CO₂H, CO₂-C₁₋₄-alkyl, CONHCH₂CO₂H, CONH(CH₂)₂SO₃H, C₁₋₄-alkyl, halogen-C₁₋₄-alkyl, O-C₁₋₄-alkyl og O-halogen-C₁₋₄-alkyl;

(D)

er valgt fra gruppen bestående av 3- til 10-leddet sykloalkyl, 3- til 10-leddet heterosykloalkyl inneholdende 1 til 3 heteroatomer uavhengig valgt fra N, O og S, 6- til 14-leddet aryl og 5- til 14-leddet heteroaryl som inneholder 1 til 4 heteroatomer uavhengig valgt fra N, O og S,

hvor i sykloalkyl, heterosykloalkyl, aryl og heteroaryl er usubstituert eller substituert med 1 til 6 substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CN, SF₅, NO₂, okso, C₁₋₄-alkyl, C₀₋₆-alkylen-OR²¹, C₀₋₆-alkylen-(3- til 6-

leddet sykloalkyl), C₀₋₆-alkylen-(3- til 6-leddet heterosykloalkyl), C₀₋₆-alkylen-S(O)_nR²¹, C₀₋₆-alkylen-NR²¹SO)₂R²¹, C₀₋₆-alkylen-S(O)₂NR²¹R²², C₀₋₆-alkylen-NR²¹SO)₂NR²¹R²², C₀₋₆-alkylen-CR⁴¹(=N-OR⁴¹), C₀₋₆-alkylen-CO₂R²¹, O-C₁₋₆-alkylen-CO₂R²¹, C₀₋₆-alkylen-O-COR²¹, C₀₋₆-alkylen-CONR²¹R²², C₀₋₆-alkylen-NR²¹-COR²¹, C₀₋₆-alkylen-NR²¹-CONR²¹R²², C₀₋₆-alkylen-O-CONR²¹R²², C₀₋₆-alkylen-NR²¹-CO₂R²¹ og C₀₋₆-alkylen-NR²¹R²²,

hvor alkyl, alkylen, sykloalkyl og heterosykloalkyl er usubstituert eller substituert med 1 til 6 substituent uavhengig valgt fra halogen, CN, okso, hydroksy, CO₂H, CO₂-C₁₋₄-alkyl, CONHCH₂CO₂H, CONH(CH₂)₂SO₃H, CO-OC₁₋₄-alkyl, C₁₋₄-alkyl, halogen-C₁₋₄-alkyl, O-C₁₋₄-alkyl og O-halogen-C₁₋₄-alkyl;

og hvori eventuelt to tilstøtende substituent på aryl- eller heteroaryldelen danner en 5- til 8-leddet delvis umettet syklus som eventuelt inneholder 1 til 3 heteroatomer uavhengig valgt fra O, S eller N, og

hvor denne tilleggssyklusen er usubstituert eller substituert med 1 til 4 substituent uavhengig valgt fra halogen, CN, okso, OH, CO₂H, CO₂-C₁₋₄-alkyl, CONHCH₂CO₂H, CONH(CH₂)₂SO₃H, C₁₋₄-alkyl, halogen-C₁₋₄-alkyl, O-C₁₋₄-alkyl og O-halogen-C₁₋₄-alkyl;

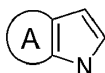
og hvori eventuelt to tilstøtende substituent på sykloalkyl- eller heterosykloalkyldelen danner en 5- til 6-leddet umettet syklus som eventuelt inneholder 1 til 3 heteroatomer uavhengig valgt fra O, S eller N,

hvor denne tilleggssyklusen er usubstituert eller substituert med 1 til 4 substituent uavhengig valgt fra halogen, CN, okso, OH, CO₂H, CO₂-C₁₋₄-alkyl, CONHCH₂CO₂H, CONH(CH₂)₂SO₃H, C₁₋₄-alkyl, halogen-C₁₋₄-alkyl, O-C₁₋₄-alkyl og O-halogen-C₁₋₄-alkyl;

hvor



har en substituent ovenfra i 1,2-orientering med hensyn til forbindelsen mot



eller har en annelert tilleggssyklus i 1,2-orientering;

L er valgt fra gruppen som består av en binding, C₁₋₆-alkylen, C₂₋₆-alkenylen, C₂₋₆-alkinylen, 3- til 10-leddet sykloalkylen, 3- til 10-leddet heterosykloalkylen inneholdende 1 til 4 heteroatomer uavhengig valgt fra N, O og S, 6- eller 10-leddet arylen og 5- til 10-leddet heteroarylen inneholdende 1 til 4 heteroatomer uavhengig valgt fra N, O og S,

hvor alkyl, alkenylen, alkinylen, sykloalkylen, heterosykloalkylen, arylen og heteroarylen er usubstituert eller substituert med 1 til 6 substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av halogen, CN, SF₅, NO₂, okso, C₁₋₄-alkyl, C₀₋₆-alkylen-OR⁴¹, C₀₋₆-alkylen-(3- til 6-leddet sykloalkyl), C₀₋₆-alkylen-(3- til 6-leddet heterosykloalkyl), C₀₋₆-alkylen-S(O)_nR⁴¹, C₀₋₆-alkylen-NR⁴¹SO)₂R⁴¹, C₀₋₆-alkylen-S(O)₂NR⁴¹R⁴², C₀₋₆-alkylen-NR⁴¹SO)₂NR⁴¹R⁴², C₀₋₆-alkylen-CO₂R⁴¹, O-C₁₋₆-alkylen-CO₂R⁴¹, C₀₋₆-alkylen-O-COR⁴¹, C₀₋₆-alkylen-CONR⁴¹R⁴², C₀₋₆-alkylen-NR⁴¹-COR⁴¹, C₀₋₆-alkylen-NR⁴¹-CONR⁴¹R⁴², C₀₋₆-alkylen-O-CONR⁴¹R⁴², C₀₋₆-alkylen-NR⁴¹-CO₂R⁴¹ og C₀₋₆-alkylen-NR⁴¹R⁴²,

hvor alkyl, alkylen, sykloalkyl og heterosykloalkyl er usubstituert eller substituert med 1 til 6 substituent uavhengig valgt fra halogen, CN, okso, hydroksy, CO₂H, CO₂-C₁₋₄-alkyl, CONHCH₂CO₂H, CONH(CH₂)₂SO₃H, C₁₋₄-alkyl, halogen-C₁₋₄-alkyl, O-C₁₋₄-alkyl og O-halogen-C₁₋₄-alkyl;

og hvori eventuelt to tilstøtende substituent på arylen- og heteroarylendelen danner en 5- til 8-leddet delvis umettet syklus som eventuelt inneholder 1 til 3

heteroatomer uavhengig valgt fra O, S eller N, og
 hvori denne tilleggssyklusen er usubstituert eller substituert med 1 til 4
 substituenten uavhengig valgt fra halogen, CN, okso, OH, CO₂H, CO₂-C₁₋₄-alkyl, C₁₋₄-alkyl, halogen-C₁₋₄-alkyl, O-C₁₋₄-alkyl og O-halogen-C₁₋₄-alkyl;

R¹ er valgt fra gruppen bestående av H, halogen, CN, SFs, NO₂, okso, C₁₋₄-alkyl, C₀₋₆-alkylen-OR⁴¹, Y-C₀₋₆-alkylen-(3- til 6-leddet sykloalkyl), Y-C₀₋₆-alkylen-(3- til 6-leddet heterosykloalkyl), Y-C₀₋₆-alkylen-(6-leddet aryl), Y-C₀₋₆-alkylen-(5- til 6-leddet heteroaryl), C₀₋₆-alkylen-S(=O)(-R⁴¹)=N-R⁷⁵, X-C₁₋₆-alkylen-S(=O)(-R⁴¹)=N-R⁷⁵, Co-s-alkylenS(O)_nR⁴¹, X-C₁₋₆-alkylen-S(O)_nR⁴¹, C₀₋₆-alkylen-S(=NR⁷¹)R⁴¹, X-C₁₋₆-alkylen-S(=NR⁷¹)R⁴¹, C₀₋₆-alkylen-S(O)(=NR⁷¹)R⁴¹, X-C₁₋₆-alkylen-S(O)(=NR⁷¹)R⁴¹, C₀₋₆-alkylen-S(=NR⁷¹)₂R⁴¹, X-C₁₋₆-alkylen-S(=NR⁷¹)₂R⁴¹, C₀₋₆-alkylen-NR⁴¹SO₂R⁴¹, X-C₁₋₆-alkylen-NR⁴¹SO₂R⁴¹, Co-s-alkylen-S(O)₂NR⁴¹R⁴², X-C₁₋₆-alkylen-S(O)₂NR⁴¹R⁴², C₀₋₆-alkylen-NR⁴¹SO₂NR⁴¹R⁴², X-C₁₋₆-alkylen-NR⁴¹SO₂NR⁴¹R⁴², C₀₋₆-alkylen-SO₃R⁴¹, X-C₁₋₆-alkylen-SO₃R⁴¹, C₀₋₆-alkylen-CO₂R⁴¹, X-C₁₋₆-alkylen-CO₂R⁴¹, C₀₋₆-alkylen-O-COR⁴¹, X-C₁₋₆-alkylen-O-COR⁴¹, C₀₋₆-alkylen-CONR⁴¹R⁴², X-C₁₋₆-alkylen-CONR⁴¹R⁴², C₀₋₆-alkylen-CONR⁴¹OR⁴¹, X-C₁₋₆-alkylen-CONR⁴¹OR⁴¹, C₀₋₆-alkylen-CONR⁴¹SO₂R⁴¹, X-C₁₋₆-alkylen-CONR⁴¹SO₂R⁴¹, C₀₋₆-alkylen-NR⁴¹-COR⁴¹, X-C₁₋₆-C₀₋₆-alkylen-NR⁴¹-COR⁴¹, C₀₋₆-alkylen-NR⁴¹-CONR⁴¹R⁴², X-C₁₋₆-alkylen-NR⁴¹-CONR⁴¹R⁴², C₀₋₆-alkylen-O-CONR⁴¹R⁴², X-C₁₋₆-alkylen-O-CONR⁴¹R⁴², C₀₋₆-alkylen-NR⁴¹-CO₂R⁴¹, X-C₁₋₆-alkylen-NR⁴¹-CO₂R⁴¹, C₀₋₆-alkylen-NR⁴¹R⁴², X-C₁₋₆-alkylen-NR⁴¹R⁴²,

hvor alkyl, alkylen, sykloalkyl, heterosykloalkyl, aryl og heteroaryl er usubstituert eller substituert med 1 til 6 substituenten uavhengig valgt fra halogen, CN, okso, hydroksy, CO₂H, CO₂-C₁₋₄-alkyl, CONHCH₂CO₂H, CONH(CH₂)₂SO₃H, C₁₋₄-alkyl, halogen-C₁₋₄-alkyl, O-C₁₋₄-alkyl og O-halogen-C₁₋₄-alkyl;

og hvori eventuelt to tilstøtende substituenten på aryl- og heteroaryldelen danner en 5- til 8-leddet delvis umettet syklus som eventuelt inneholder 1 til 3 heteroatomer uavhengig valgt fra O, S eller N, og
 hvori denne tilleggssyklusen er usubstituert eller substituert med 1 til 4 substituenten uavhengig valgt fra halogen, CN, okso, OH, CO₂H, CO₂-C₁₋₄-alkyl, CONHCH₂CO₂H, CONH(CH₂)₂SO₃H, C₁₋₄-alkyl, halogen-C₁₋₄-alkyl, O-C₁₋₄-alkyl og O-halogen-C₁₋₄-alkyl;

R¹¹, R¹², R²¹, R²², R³¹, R³², R⁴¹, R⁴², R⁵¹ er uavhengig valgt fra H og C₁₋₄-alkyl, hvori alkyl er usubstituert eller substituert med 1 til 3 substituenten uavhengig valgt fra halogen, CN, C₁₋₄-alkyl, halogen-C₁₋₄-alkyl, 3- til 6-leddet sykloalkyl, halo-(3- til 6-leddet sykloalkyl), 3- til 6-leddet heterosykloalkyl, halo-(3- til 6-leddet heterosykloalkyl), OH, okso, CO₂H, CO₂-C₁₋₄-alkyl, CONHCH₂CO₂H, CONH(CH₂)₂SO₃H, SO₃H, O-C₁₋₄-alkyl og O-halogen-C₁₋₄-alkyl;
 eller R¹¹ og R¹², R²¹ og R²², R³¹ og R³², R⁴¹ og R⁴² når de tas sammen med nitrogenet som de er bundet til, fullfører henholdsvis en 3- til 6-leddet ring inneholdende karbonatomer og eventuelt inneholdende 1 eller 2 heteroatomer uavhengig valgt fra O, S eller N; og
 hvori den nydannede syklusen er usubstituert eller substituert med 1 til 3 substituenten uavhengig valgt fra halogen, CN, C₁₋₄-alkyl, halogen-C₁₋₄-alkyl, 3- til 6-leddet sykloalkyl, halo-(3- til 6-leddet sykloalkyl), 3- til 6-leddet heterosykloalkyl, halo-(3- til 6-leddet heterosykloalkyl), OH, okso, CO₂H, CO₂-C₁₋₄-alkyl, CONHCH₂CO₂H, CONH(CH₂)₂SO₃H, SO₃H, O-C₁₋₄-alkyl og O-halogen-C₁₋₄-alkyl;

R⁷¹ er uavhengig valgt fra H, CN; NO₂, C₁₋₄-alkyl og C(O)-OC₁₋₄-alkyl, hvori alkyl er usubstituert eller substituert med 1 til 3 substituenten uavhengig valgt fra halogen, CN, C₁₋₄-alkyl, halogen-C₁₋₄-alkyl, 3- til 6-leddet sykloalkyl, halo-(3- til 6-leddet sykloalkyl), 3- til 6-leddet heterosykloalkyl, halo-(3- til 6-leddet heterosykloalkyl), OH, okso, CO₂H, CO₂-C₁₋₄-alkyl, CONHCH₂CO₂H, CONH(CH₂)₂SO₃H, SO₃H, O-C₁₋₄-alkyl og O-halogen-C₁₋₄-alkyl;

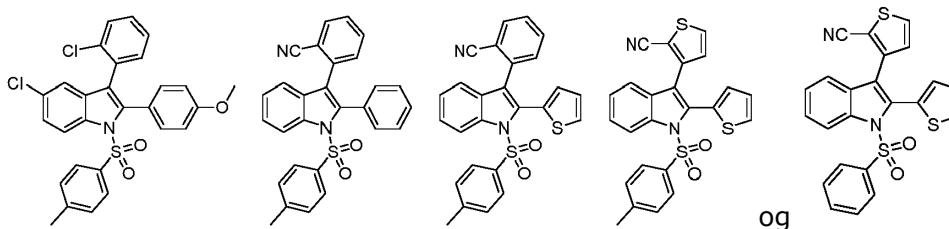
R^{75} er uavhengig valgt fra C_{1-4} -alkyl, 3- til 6-leddet sykloalkyl, 3- til 6-leddet heterosykloalkyl, 6-leddet aryl og 5- til 6-leddet heteroaryl, hvori alkyl, sykloalkyl, heterosykloalkyl, aryl og heteroaryl er usubstituert eller substituert med 1 til 3 substituent uavhengig valgt fra halogen, CN, Me, Et, CHF_2CF_3 , OH, okso, CO_2H , $CONHCH_2CO_2H$, $CONH(CH_2)_2SO_3H$, SO_3H , OMe, OEt, $OCHF_2$ og OCF_3 ;

X er uavhengig valgt fra O, NR^{51} , $S(O)_n$, $S(=NR^{71})$, $S(O)(=NR^{71})$ og $S(=NR^{71})_2$;

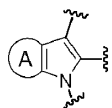
Y er uavhengig valgt fra en binding, O, NR^{51} , $S(O)_n$, $S(=NR^{71})$, $S(O)(=NR^{71})$ og $S(=NR^{71})_2$;

n er uavhengig valgt fra 0 til 2;

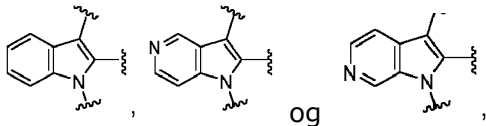
og med det forbehold at følgende strukturer er ekskludert:



2. Forbindelsen ifølge krav 1, eller et glysinkonjugat, taurokonjugat, enantiomer, diastereomer, tautomer, *N*-oksid, solvat eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori



er valgt fra



hvori



er usubstituert eller substituert med 1 til 3 substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av F, Cl, Br, CN, OH, okso, C_{1-4} -alkyl, halogen- C_{1-4} -alkyl, O- C_{1-4} -alkyl, O-halogen- C_{1-4} -alkyl, NH_2 , NHC_{1-4} -alkyl, $N(C_{1-4}\text{-alkyl})_2$, SO_2 - C_{1-4} -alkyl og SO_2 -halo- C_{1-4} -alkyl.

3. Forbindelsen ifølge krav 1 eller 2, eller et glysinkonjugat, taurokonjugat, enantiomer, diastereomer, tautomer, *N*-oksid, solvat eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori

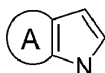


er valgt fra gruppen bestående av fenyl, naftyl, pyridyl, pyrimidinyl, tiofenyl, tiazolyl, syklopentyl, sykloheksyl, bisyklo[1.1.1]pentyl, bisyklo[2.2.2]oktyl, bisyklo[2.2.1]heptyl, pentasyklo[4.2.0.0^{2,5}.0^{3,8}.0^{4,7}]oktyl og piperidinyl, hvori syklusen er usubstituert eller substituert med 1 til 3 substituent uavhengig valgt fra gruppen bestående av F, Cl, Br, CN, OH, okso, C_{1-4} -alkyl, halogen- C_{1-4} -alkyl, O- C_{1-4} -alkyl, O-halogen- C_{1-4} -alkyl, C_{1-4} -alkyl-OH og halogen- C_{1-4} -alkyl-OH; og hvori eventuelt to tilstøtende substituent på fenylingen danner sammen en $-(CH_2)_3-$, $-(CH_2)_4-$, $-OCF_2O-$

og -OCH₂O- gruppe.

4. Forbindelsen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 3, eller et glysinkonjugat, taurokonjugat, enantiomer, diastereomer, tautomer, *N*-oksid, solvat eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori

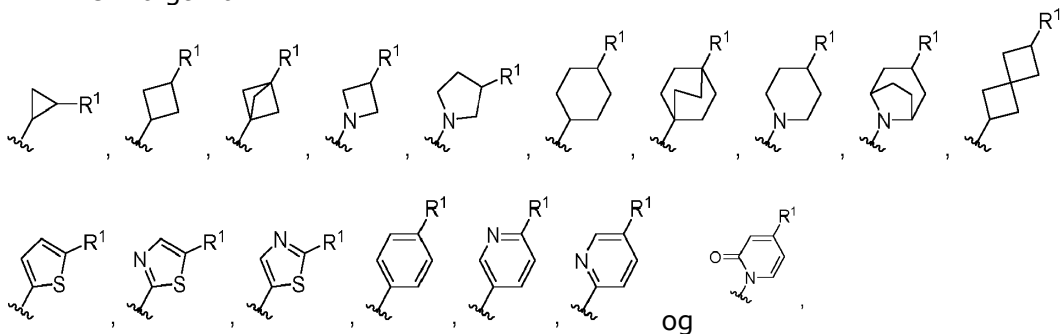
© er valgt fra fenyl, pyridyl og tiofenyl; hvori fenyl, pyridyl og tiofenyl er usubstituert eller substituert med 1 til 3 substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av F, Cl, CN, OH, okso, C₁₋₄-alkyl, halogen-C₁₋₄-alkyl, O-C₁₋₄-alkyl og O-halogen-C₁₋₄-alkyl; og hvori rest -L-R¹ er knyttet i 1,3-orientering angående forbindelsen mot



og L er ikke en binding.

5. Forbindelsen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 4, eller et glysinkonjugat, taurokonjugat, enantiomer, diastereomer, tautomer, *N*-oksid, solvat eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori

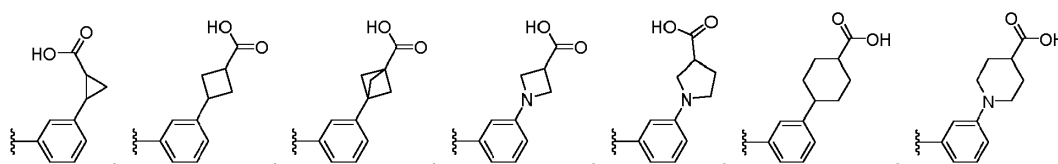
- L-R¹ er valgt fra

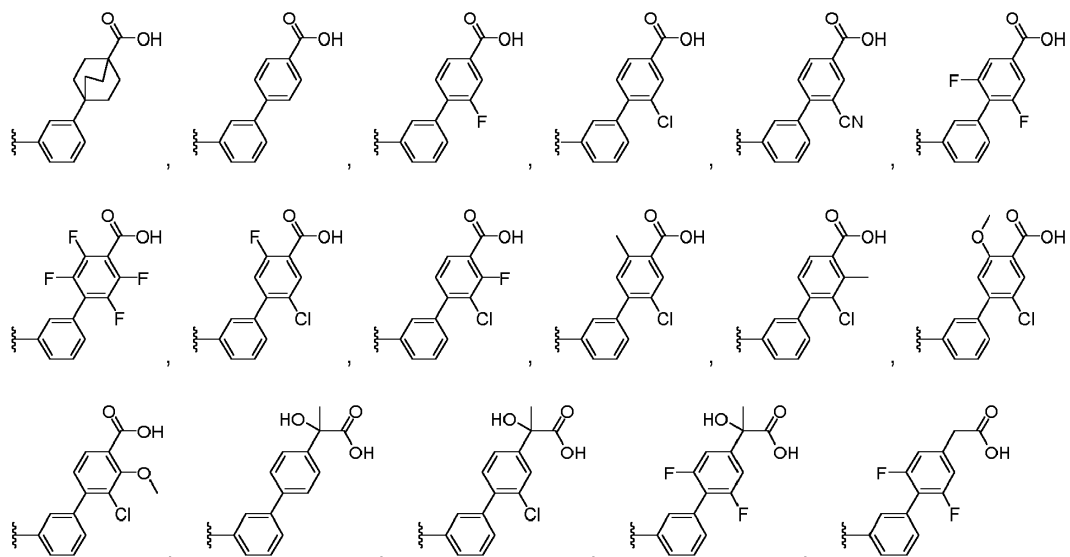


hvor syklusen er usubstituert eller ytterligere substituert med 1 til 4 substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av F, Cl, Br, CN, OH, okso, C₁₋₄-alkyl, halogen-C₁₋₄-alkyl, O-C₁₋₄-alkyl, O-halogen-C₁₋₄-alkyl, C₁₋₄-alkyl-OH, halogen-C₁₋₄-alkyl-OH, SO₂-C₁₋₄-alkyl og SO₂-halo-C₁₋₄-alkyl; og hvori eventuelt to tilstøtende substituenten på fenylringen danner sammen en -(CH₂)₃-, -(CH₂)₄-, -OCF₂O- og -OCH₂O- gruppe.

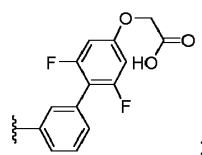
6. Forbindelsen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 5, hvori R¹ er valgt fra CO₂H, tetrazol, CH₂CO₂H, OCH₂CO₂H, SO₂CH₂CO₂H, CHMeCO₂H, CMe₂CO₂H, C(OH)MeCO₂H, CONHSO₂Me og CONH(OH); og eventuelt glycin og taurokonjugatet derav, eller enantiomer, diastereomer, tautomer, *N*-oksid, solvat eller farmasøytisk akseptabelt salt derav.

7. Forbindelsen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 6, hvori -L-R¹ er valgt fra





og

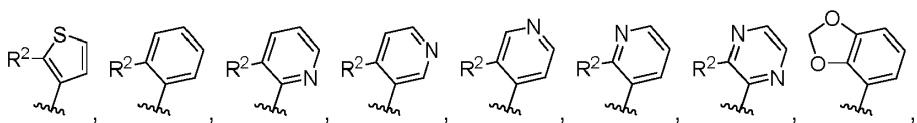


og eventuelt glycin og tauro-konjugatet derav, eller enantiomer, diastereomer, tautomer, *N*-oksid, solvat eller farmasøytisk akseptabelt salt derav.

8. Forbindelsen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 7, eller et glysinkonjugat, taurokonjugat, enantiomer, diastereomer, tautomer, *N*-oksid, solvat eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori

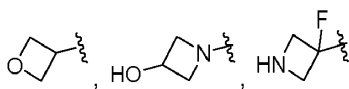
(D)

er valgt fra gruppen som består av

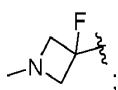


hvori

R^2 er valgt fra Me, F, Cl, CN, Me, CHO, CHF_2CF_3 , SO_2Me ,



og



og

hvori

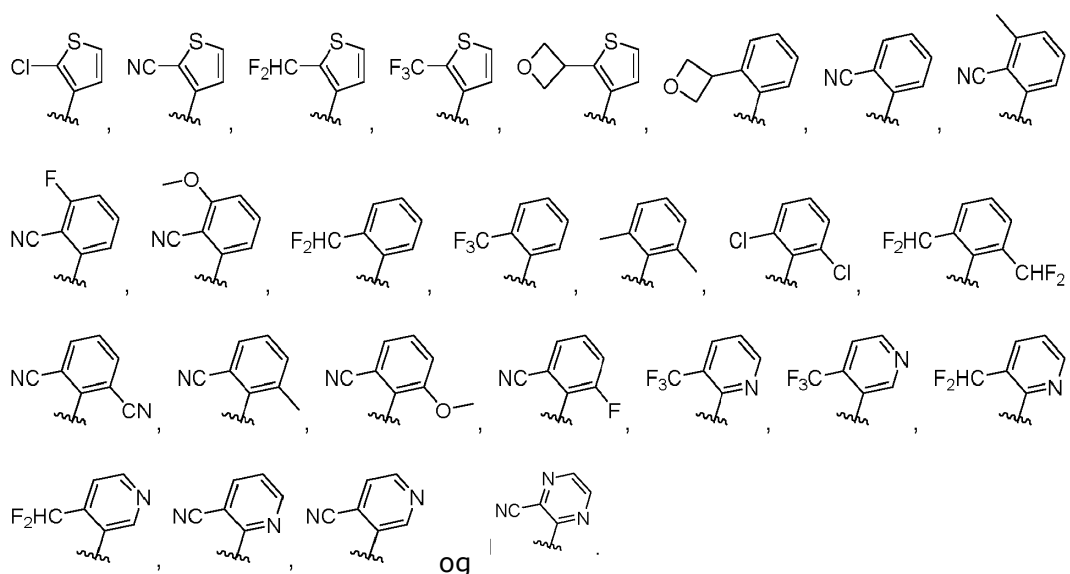
D

er eventuelt ytterligere substituert med 1 til 2 substituenten valgt fra gruppen bestående av F, Cl, CN, Me, OMe, CHO, CHF₂ og CF₃.

9. Forbindelsen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 8, eller et glysinkonjugat, taurokonjugat, enantiomer, diastereomer, tautomer, *N*-oksid, solvat eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori

D

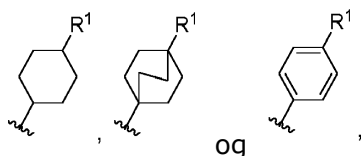
er valgt fra gruppen som består av



10. Forbindelsen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 9, hvori formel (I) inneholder en substituent valgt fra gruppen bestående av CO₂H, tetrazol, CONHSO₂Me og CONH(OH); og eventuelt glycin og tauro-konjugatet derav, eller enantiomer, diastereomer, tautomer, *N*-oksid, solvat eller farmasøytisk akseptabelt salt derav.

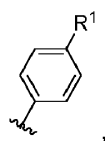
11. Forbindelsen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 10, hvori

-L-R¹ er valgt fra



hvor i fenyl er usubstituert eller substituert med 1 til 4 substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av F, Cl, CN, OH, Me og OMe; og R¹ er valgt fra CO₂H og C(OH)MeCO₂H; og eventuelt glycin og tauro-konjugatet derav, eller enantiomer, diastereomer, tautomer, *N*-oksid, solvat eller farmasøytisk akseptabelt salt derav.

12. Forbindelsen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 10, eller et glysinkonjugat, taurokonjugat, enantiomer, diastereomer, tautomer, *N*-oksid, solvat eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori $L-R^1$ er



hvori syklusen er usubstituert eller ytterligere substituert med 1 til 4 substituenten uavhengig valgt fra gruppen bestående av F, Cl, Br, CN, OH, okso, C_{1-4} -alkyl, halogen- C_{1-4} -alkyl, O- C_{1-4} -alkyl, O-halogen- C_{1-4} -alkyl, C_{1-4} -alkyl-OH, halogen- C_{1-4} -alkyl-OH, SO_2 - C_{1-4} -alkyl og SO_2 -halo- C_{1-4} -alkyl; og hvori eventuelt to tilstøtende substituenten på fenylingen danner sammen en $-(CH_2)_3-$, $-(CH_2)_4-$, $-OCF_2O-$ og $-OCH_2O-$ gruppe.

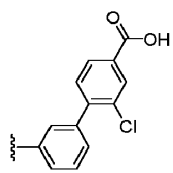
13. Forbindelsen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 12, hvori R^1 er C_{0-6} -alkylen- CO_2R^{41} eller C_{0-6} -alkylen- $CONR^{41}R^{42}$ eller et glysinkonjugat eller taurokonjugat derav, eller enantiomer, diastereomer, tautomer, *N*-oksid, solvat eller farmasøytisk akseptabelt salt derav.

14. Forbindelsen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 13, hvori R^1 er $COOH$, eller et glysinkonjugat eller taurokonjugat derav, eller enantiomer, diastereomer, tautomer, *N*-oksid, solvat eller farmasøytisk akseptabelt salt derav.

15. Forbindelsen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 13, eller et glysinkonjugat, taurokonjugat, enantiomer, diastereomer, tautomer, *N*-oksid, solvat eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori R^1 er C_{0-6} -alkylen- $CONR^{41}R^{42}$.

16. Forbindelsen ifølge krav 15, eller et glysinkonjugat, taurokonjugat, enantiomer, diastereomer, tautomer, *N*-oksid, solvat eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori R^{41} og R^{42} er uavhengig valgt fra H og C_{1-4} -alkyl, hvori C_{1-4} -alkyl er usubstituert eller substituert med CO_2H .

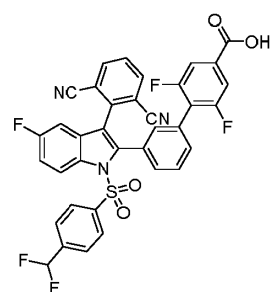
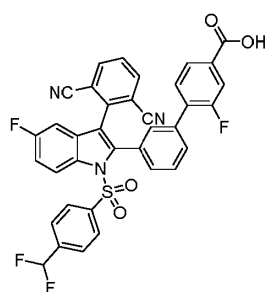
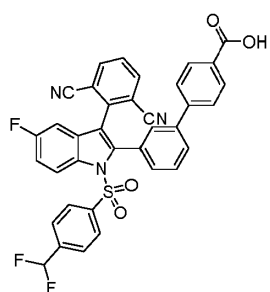
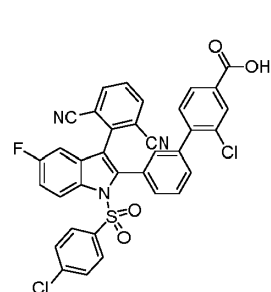
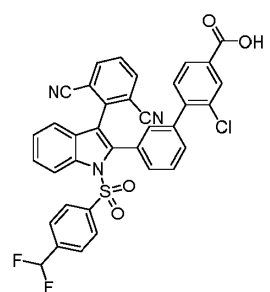
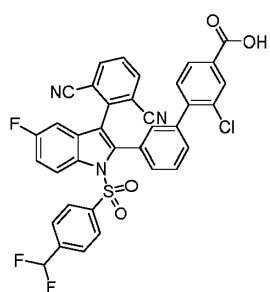
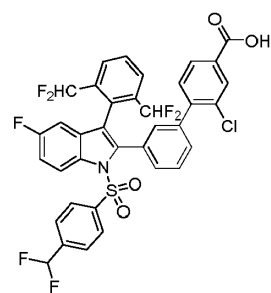
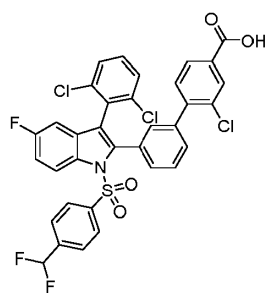
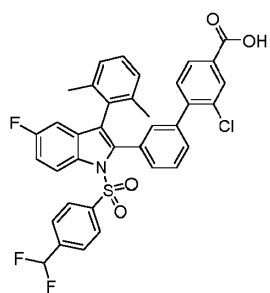
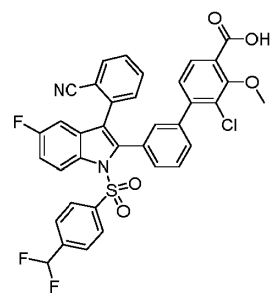
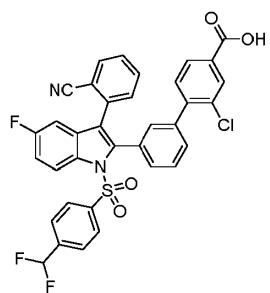
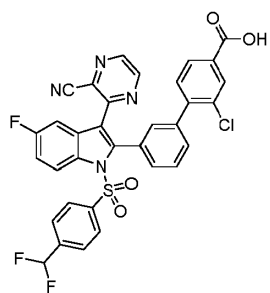
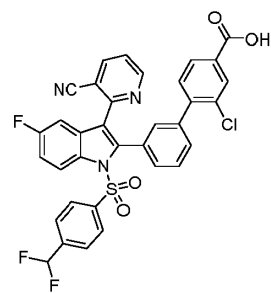
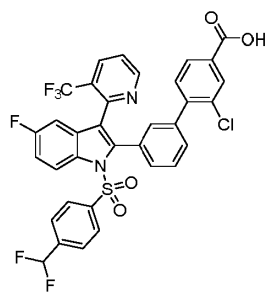
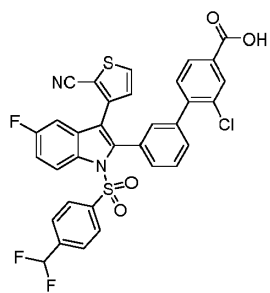
17. Forbindelsen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 12, hvori $L-R^1$ er

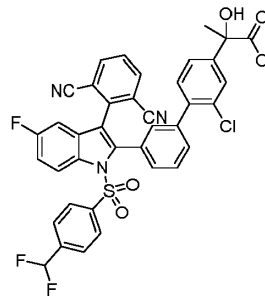
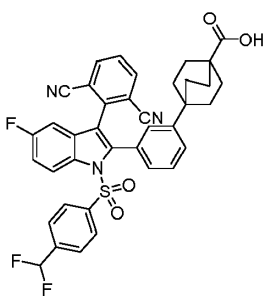
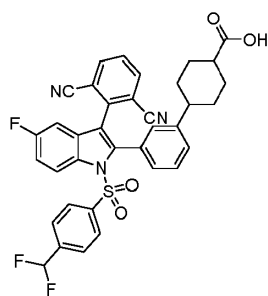
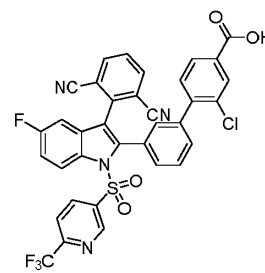
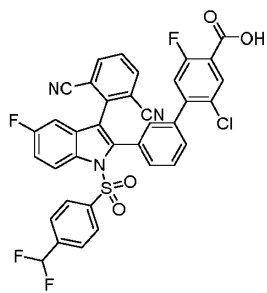
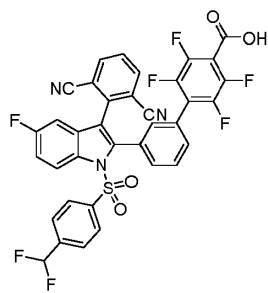


eller et glysinkonjugat eller taurokonjugat derav, eller enantiomer, diastereomer, tautomer, *N*-oksid, solvat eller farmasøytisk akseptabelt salt derav.

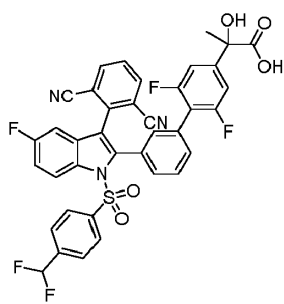
18. Forbindelsen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 17, hvor forbindelsen er et glysinkonjugat, eller enantiomer, diastereomer, tautomer, *N*-oksid, solvat eller farmasøytisk akseptabelt salt derav.

19. Forbindelsen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 18 valgt fra



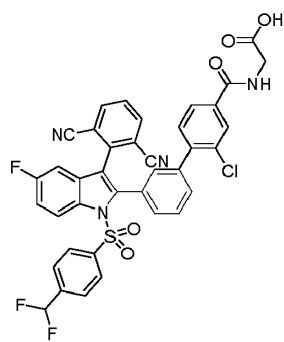


og



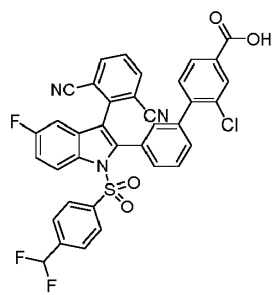
eller et glycinkonjugat eller taurokonjugat derav; og
en enantiomer, diastereomer, tautomer, *N*-oksid, solvat eller farmasøytisk
akseptabelt salt derav.

20. Forbindelsen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 19, som er



en enantiomer, diastereomer, tautomer, *N*-oksid, solvat eller farmasøytisk akseptabelt
salt derav.

21. Forbindelsen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 19, som er



eller et glycinkonjugat derav, en enantiomer, diastereomer, tautomer, /N-oksider, solvat eller farmasøytisk akseptabelt salt derav.

22. Forbindelsen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 21, eller et glysinkonjugat, taurokonjugat, enantiomer, diastereomer, tautomer, /N-oksider, solvat eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, for bruk som et medikament.

23. Forbindelsen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 21, eller et glysinkonjugat, taurokonjugat, enantiomer, diastereomer, tautomer, /N-oksider, solvat eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, for bruk i profylakse og/eller behandling av sykdommer som kan behandles med LXR-modulatorer, hvori sykdommen er valgt fra alkoholfri fettlever sykdom, ikke-alkoholisk steatohepatitt, leverbetennelse, lever fibrose, fedme, insulinresistens, type II diabetes, familiær hyperkolesterolemi, hyperkolesterolemi ved nefrotisk syndrom, metabolsk syndrom, hjertesteatose, kreft, viral myokarditt, hepatitt C-virusinfeksjon eller dens komplikasjoner og uønskede bivirkninger av langtidsbehandling med glukokortikoid i sykdommer som revmatoid artritt, inflammatorisk tarmsykdom og astma.

24. Farmasøytisk sammensetning omfattende en forbindelse ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 21, eller et glysinkonjugat, taurokonjugat, enantiomer, diastereomer, tautomer, /N-oksider, solvat eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, og en farmasøytisk akseptabel bærer eller hjelpestoff.