



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3820856 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

C07D 309/10 (2006.01)

A61K 31/7034 (2006.01)

A61P 31/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2022.12.12
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2022.08.31
(86)	European Application Nr.	19769220.5
(86)	European Filing Date	2019.07.08
(87)	The European Application's Publication Date	2021.05.19
(30)	Priority	2018.07.10, US, 201862695993 P 2018.11.05, US, 201862755588 P
(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
(73)	Proprietor	GlaxoSmithKline Intellectual Property Development Limited, 980 Great West Road, Brentford, Middlesex TW8 9GS, Storbritannia Fimbrion Therapeutics, Inc., 20 South Sarah Street, Saint Louis MO 63108, USA
(72)	Inventor	BISHOP, Michael Joseph, Five Moore Drive, Research Triangle Park, NC 27709, USA COLANDREA, Vincent J., 1250 South Collegeville Road, Collegeville, PA 19426, USA LI, Yuehu, 1250 South Collegeville Road, Collegeville, PA 19426, USA STEWART, Eugene L., 1250 South Collegeville Road, Collegeville, PA 19426-0989, USA STRAMBEANU, Iulia, 1250 South Collegeville Road, Collegeville, PA 19426, USA WIDDOWSON, Katherine Louisa, 3366 North Torrey Pines Court, San Diego, CA 92106, USA JANETKA, James Walter, 20 South Sarah Street, Saint Louis, MO 63108, USA MCGRANE, Laurel Kathryn, 20 South Sarah Street, Saint Louis, MO 63108, USA
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54)	Title	C-MANNOSIDE COMPOUNDS USEFUL FOR THE TREATMENT OF URINARY TRACT INFECTIONS
------	-------	---

(56)	References Cited:	WO-A1-2017/156508, WO-A1-2014/194270, LAUREL MYDOCK-MCGRANE ET AL: "Antivirulence C -Mannosides as Antibiotic-Sparing, Oral Therapeutics for Urinary Tract Infections", JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, vol. 59, no. 20, 14 October 2016 (2016-10-14), pages 9390-9408, XP055550436, US ISSN: 0022-2623, DOI: 10.1021/acs.jmedchem.6b00948
------	----------------------	--

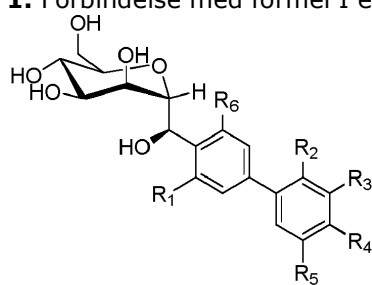
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters 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/>

EP3820856

1

Patentkrav

1. Forbindelse med formel I eller a farmasøytisk akseptabelt salt derav,



(I)

5 i hvilken

R₁ er CH₃, CF₃ eller Cl;

R₂ er F, Cl, OR' eller H;

10 R₃, R₄ og R₅ uavhengig er H, F, Cl, Br, C₃₋₆-sykloalkyl, OR', -N(C₁₋₆-alkyl)₂, C₂₋₆-alkenyl, C₂₋₆-alkynyl eller C₁₋₆-alkyl eventuelt substituert med opptil sju fluoratomer, opptil ett hydroksy, opptil ett -N(C₁₋₆-alkyl)₂ og opptil ett -OC₁₋₆-alkyl; forutsatt at ikke alle R₃, R₄ og R₅ samtidig er hydrogen.

R₅ er H eller F;

R' uavhengig er H eller C₁₋₆-alkyl eventuelt substituert med opptil sju fluoratomer.

15 **2.** Forbindelse eller farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge krav 1, hvori R₁ er CH₃ eller CF₃.

3. Forbindelse eller farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge krav 1 eller 2, hvori R₁ er CH₃.

20

4. Forbindelse eller farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge krav 1 i hvilken

R₁ er CH₃ eller CF₃;

R₂ er H;

R₃ er F;

25 R₄ er CH₃, Cl, Br, vinyl, CF₃, F eller H;

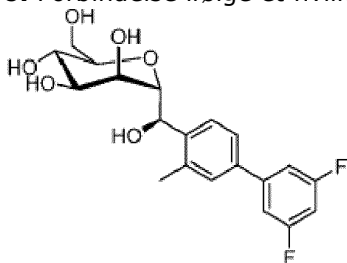
R₅ er F eller H; og

EP3820856

2

R₆ er H.**5.** Forbindelse ifølge krav 4 som er valgt fra:

- 5 (2R,3S,4S,5S,6R)-2-((R)-(3',5'-difluor-3,4'-dimetyl-[1,1'-bifenyl]-4-yl)(hydroksy)metyl)-6-(hydroksymetyl)tetrahydro-2H-pyran-3,4,5-triol;
 (2R,3S,4S,5S,6R)-2-((R)-(4'-klor-3',5'-difluor-3-metyl-[1,1'-bifenyl]-4-yl)(hydroksy)metyl)-6-(hydroksymetyl)tetrahydro-2H-pyran-3,4,5-triol;
 (2R,3S,4S,5S,6R)-2-((R)-(4'-brom-3',5'-difluor-3-metyl-[1,1'-bifenyl]-4-yl)(hydroksy)metyl)-6-(hydroksymetyl)tetrahydro-2H-pyran-3,4,5-triol;
 10 (2R,3S,4S,5S,6R)-2-((R)-(3',5'-difluor-3-metyl-4'-vinyl-[1,1'-bifenyl]-4-yl)(hydroksy)metyl)-6-(hydroksymetyl)tetrahydro-2H-pyran-3,4,5-triol;
 (2R,3S,4S,5S,6R)-2-((R)-(3'-fluor-3-metyl-4'-(trifluormetyl)-[1,1'-bifenyl]-4-yl)(hydroksy)metyl)-6-(hydroksymetyl)tetrahydro-2H-pyran-3,4,5-triol;
 (2R,3S,4S,5S,6R)-2-((R)-(3'-fluor-3-metyl-5'-(trifluormetyl)-[1,1'-bifenyl]-4-yl)(hydroksy)metyl)-6-(hydroksymetyl)tetrahydro-2H-pyran-3,4,5-triol;
 15 (2R,3S,4S,5S,6R)-2-((R)-hydroksy(3',4',5'-trifluor-3-metyl-[1,1'-bifenyl]-4-yl)metyl)-6-(hydroksymetyl)tetrahydro-2H-pyran-3,4,5-triol;
 (2R,3S,4S,5S,6R)-2-((R)-(3',5'-difluor-3-(trifluormetyl)-[1,1'-bifenyl]-4-yl)(hydroksy)metyl)-6-(hydroksymetyl)tetrahydro-2H-pyran-3,4,5-triol; og
 20 (2R,3S,4S,5S,6R)-2-((R)-(3',5'-difluor-3-metyl-[1,1'-bifenyl]-4-yl)(hydroksy)metyl)-6-(hydroksymetyl)tetrahydro-2H-pyran-3,4,5-triol.

6. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5, hvori forbindelsen er

25

7. Forbindelse eller farmasøytisk akseptabelt salt derav angitt i et hvilket som helst av kravene 1-6 for anvendelse som medikament.

EP3820856

3

- 5 **8.** Forbindelse eller farmasøytisk akseptabelt salt derav som angitt i et hvilket som helst av kravene 1-6 for anvendelse i forebygging eller behandling av en sykdom eller tilstand som forbedres ved inhibering av FimH-funksjon eller -aktivitet.
- 10 **9.** Forbindelse eller farmasøytisk akseptabelt salt derav som angitt i et hvilket som helst av kravene 1-6 for anvendelse i forebygging eller behandling av en bakteriell infeksjon, Crohns sykdom (CD) og inflammatorisk tarmsykdom (IBD).
- 15 **10.** Forbindelse eller farmasøytisk akseptabelt salt derav som angitt i et hvilket som helst av kravene 1-6 for anvendelse i forebygging eller behandling av urinveisinfeksjon (UTI).
- 15 **11.** Forbindelse eller farmasøytisk akseptabelt salt derav som angitt i krav 10, hvori urinveisinfeksjonen er rekurrent eller kronisk.
- 20 **12.** Forbindelse eller farmasøytisk akseptabelt salt derav som angitt i krav 9, hvori den bakterielle infeksjonen er en antibiotikaresistent bakteriell infeksjon.
- 25 **13.** Farmasøytisk sammensetning omfattende en forbindelse eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav som angitt i et hvilket som helst av kravene 1-6 sammen med en farmasøytisk akseptabel bærer.
- 25 **14.** Farmasøytisk sammensetning omfattende en forbindelse eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav som angitt i et hvilket som helst av kravene 1-6 formulert for oral (PO) administrering, spesielt hvori sammensetningen er en tablett eller en kapsel.
- 30 **15.** Forbindelse eller farmasøytisk akseptabelt salt derav som angitt i et hvilket som helst av kravene 1-6; og et annet terapeutisk middel.