



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3908568 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07C 237/06 (2006.01)
C07D 207/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2024.10.14
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2024.06.26
(86)	European Application Nr.	20703909.0
(86)	European Filing Date	2020.01.10
(87)	The European Application's Publication Date	2021.11.17
(30)	Priority	2019.01.11, US, 201962791566 P 2019.08.22, US, 201962890469 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
(73)	Proprietor	Acuitas Therapeutics, Inc., 6190 Agronomy Road Suite 402 University of British Columbia - KETR, Vancouver, British Columbia V6T 1W5, Canada
(72)	Inventor	DU, Xinyao, 9580 Snowdon Ave., Richmond, British Columbia V7A 2M1, Canada
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54)	Title	LIPIDS FOR LIPID NANOPARTICLE DELIVERY OF ACTIVE AGENTS
(56)	References Cited:	WO-A1-2018/078053 WO-A1-2017/117528

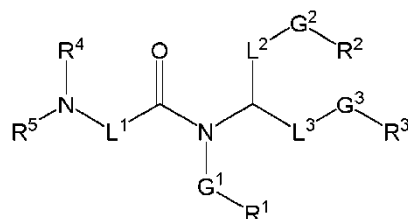
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters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

EP3908568

1

5 **Patentkrav**

1. Forbindelse med følgende struktur (I):



(I)

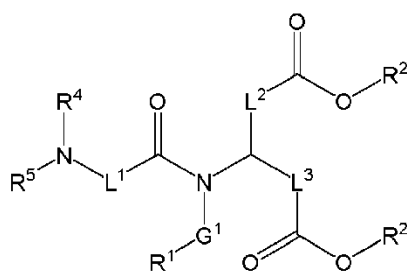
10 eller et farmasøytisk akseptabelt salt, tautomer eller stereoisomer derav, hvor:

R¹ er eventuelt substituert C₁-C₂₄-alkyl eller eventuelt substituert C₂-C₂₄-alkenyl;hver av R² og R³ uavhengig er eventuelt substituert C₁-C₃₆-alkyl;hver av R⁴ og R⁵ uavhengig er eventuelt substituert C₁-C₆-alkyl, eller R⁴ og R⁵ forener seg, sammen med det N som de er tilknyttet, for å danne et heterosyklyl eller heteroaryl;15 hver av L¹, L² og L³ uavhengig er eventuelt substituert C₁-C₁₈-alkylen;G¹ er en direkte binding, -(CH₂)_n(C=O)-, -(CH₂)_n(C=O)O- eller -(C=O)-;

hver av G² og G³ uavhengig er -(C=O)O- eller -O(C=O)-; og

n er et heltall større enn 0.

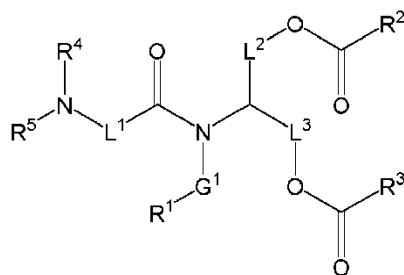
20 2. Forbindelse ifølge krav 1, med følgende struktur (IA):



(IA)

25

3. Forbindelse ifølge krav 1, med følgende struktur (IB):



(IB)

4. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-3, hvor R¹ er:

- i) eventuelt substituert C₆-C₁₈-alkyl eller C₁₄-C₁₈-alkenyl, fortrinnsvis hvor R¹ er C₈-alkyl, C₉-alkyl, C₁₀-alkyl, C₁₂-alkyl, C₁₄-alkyl, C₁₆-alkyl eller C₁₆-alkenyl;
- ii) uforgrenet;
- iii) forgrenet; eller
- iv) usubstituert.

5. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-4, hvor G¹ er en direkte binding, -(CH₂)_n(C=O)- eller -(CH₂)_n(C=O)O-, fortrinnsvis hvor G¹ er en direkte binding eller -(CH₂)_n(C=O)O- og n er større enn 1, mer foretrukket hvor G¹ er -(CH₂)_n(C=O)O- og n er 5, 6, 7, 8, 9 eller 10, mest foretrukket hvor n er 7 eller 8.

6. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-5, hvor L¹ er:

- i) C₁-C₆-alkylen, fortrinnsvis C₂-alkylen, C₃-alkylen eller C₄-alkylen;
- ii) uforgrenet; eller
- iii) usubstituert.

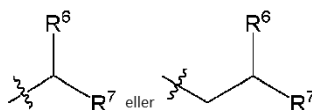
7. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-6, hvor:

- i) R² er C₈-C₂₄-alkyl;
- ii) R³ er C₈-C₂₄-alkyl;
- iii) R² og R³ begge er C₈-C₂₄-alkyl, fortrinnsvis hvor hver av R² og R³ uavhengig er C₁₁-alkyl, C₁₂-alkyl, C₁₃-alkyl, C₁₄-alkyl, C₁₅-alkyl, C₁₆-alkyl, Cis-alkyl eller C₂₀-alkyl;
- iv) R² er forgrenet;
- v) R³ er forgrenet;
- vi) hver av R² og R³ uavhengig har én av følgende strukturer:

EP3908568

3

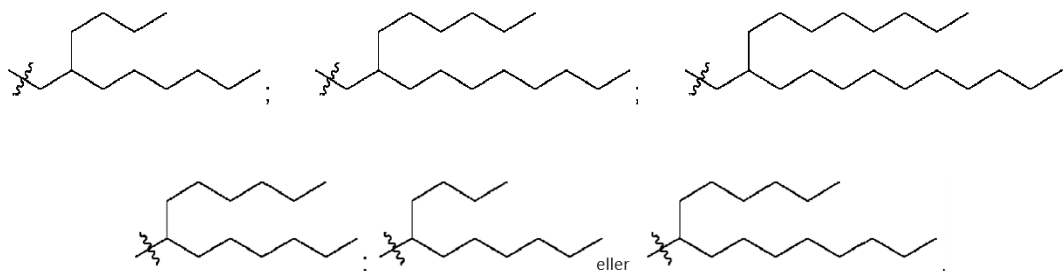
5



hvor:

hver av R^6 og R^7 uavhengig er C_2 - C_{12} -alkyl, fortrinnsvis hvor hver av R^2 og R^3 uavhengig har én av følgende strukturer:

10



8. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-7, hvor:

15

i) hver av L^2 og L^3 uavhengig er C_4 - C_{10} -alkylen, fortrinnsvis hvor L^2 og L^3 begge er C_5 -alkylen, eller begge er C_6 -alkylen eller begge er C_8 -alkylen eller begge er C_9 -alkylen;

ii) L^2 er uforgrenet;

iii) L^3 er uforgrenet;

iv) L^2 er usubstituert; eller

20

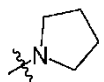
v) L^3 er usubstituert.

9. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-8, hvor:

i) hver av R^4 og R^5 uavhengig er C_1 - C_6 -alkyl, fortrinnsvis R^4 og R^5 begge er metyl eller begge er etyl eller R^4 er metyl og R^5 er n-butyl;

25

ii) R^4 og R^5 forener seg, sammen med det N som de er tilknyttet, for å danne et heterosyklyl, fortrinnsvis hvor heterosyklylet er et 5-leddet heterosyklyl, mer foretrukket hvor heterosyklylet har følgende struktur:

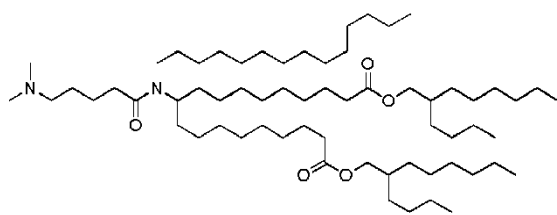


30

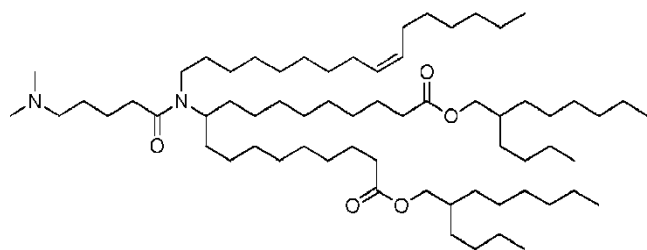
10. Forbindelse ifølge krav 1, hvor forbindelsen har én av følgende strukturer:

EP3908568

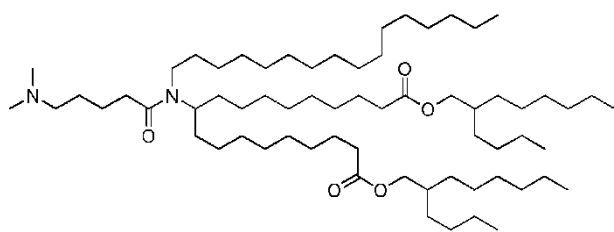
4



5

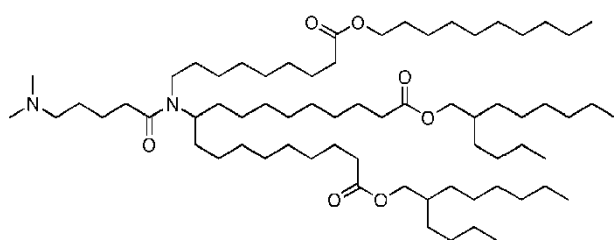


;

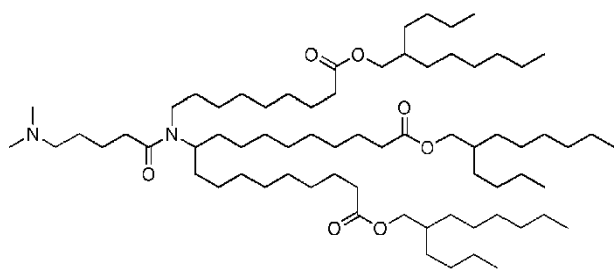


;

10

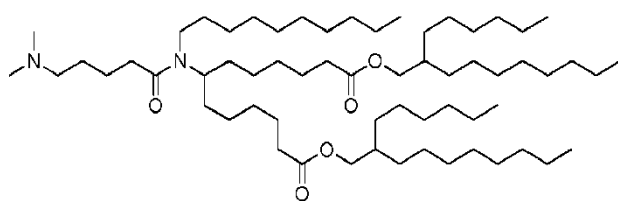


;



;

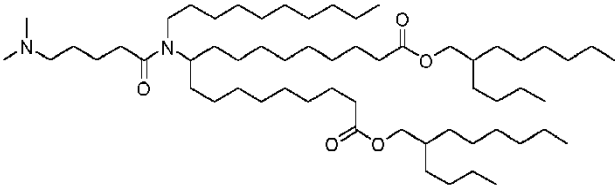
15



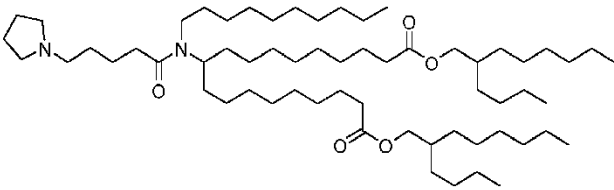
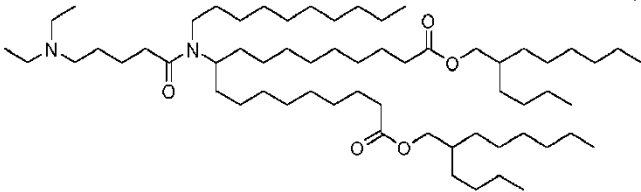
;

EP3908568

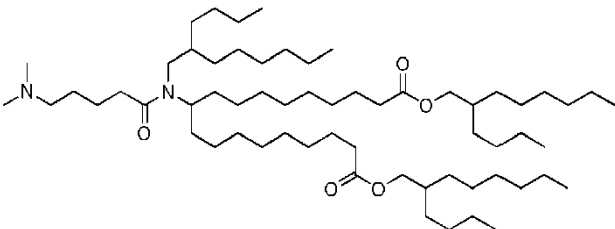
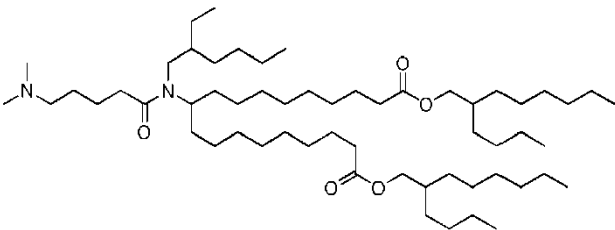
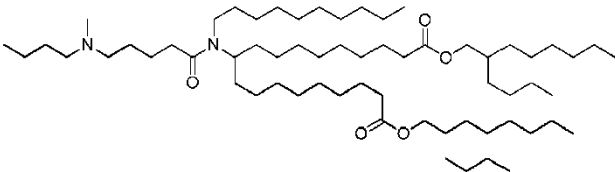
5



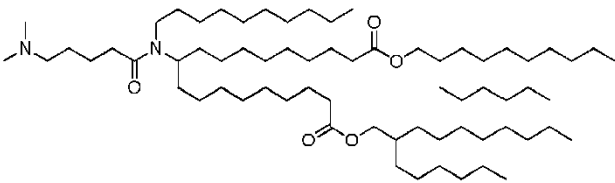
5



10



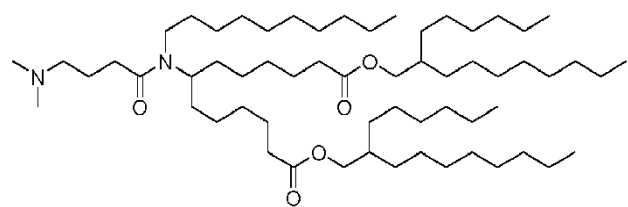
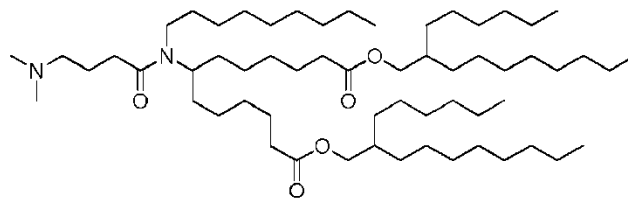
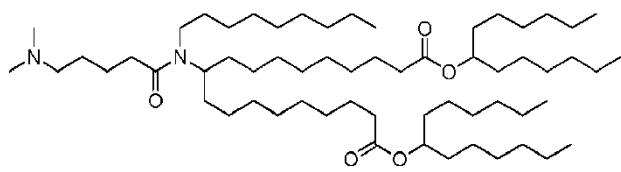
15



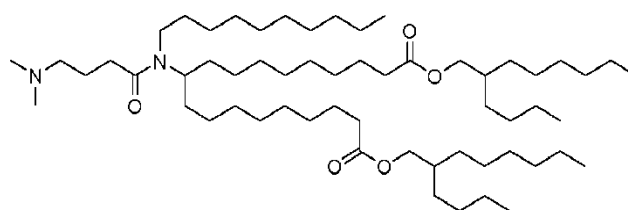
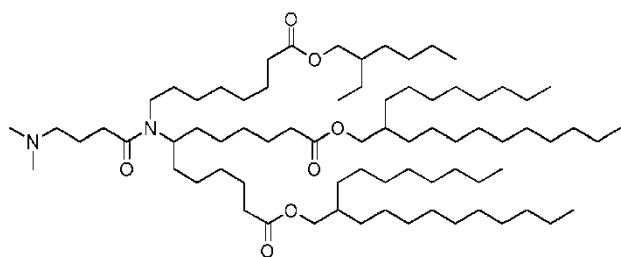
EP3908568

6

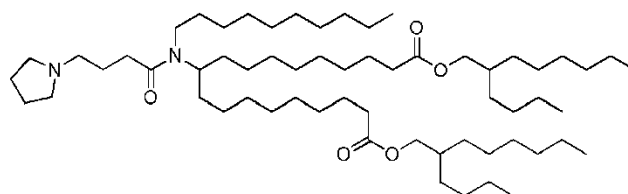
5



10

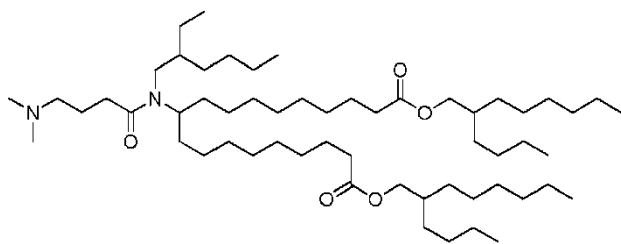


15

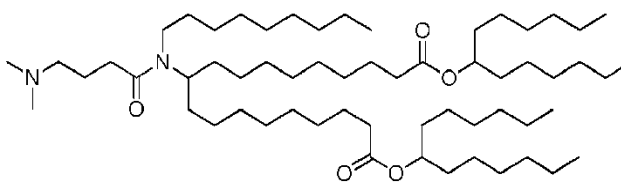
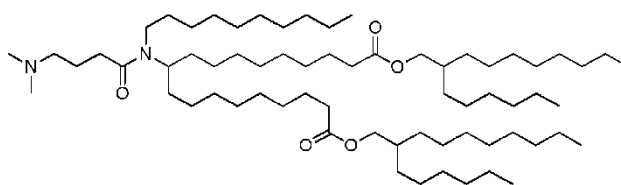


EP3908568

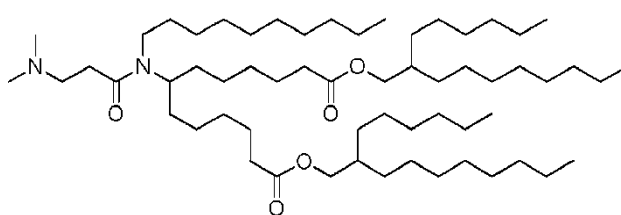
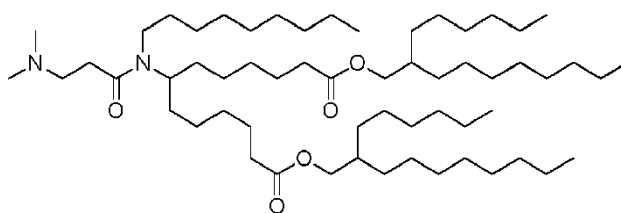
7



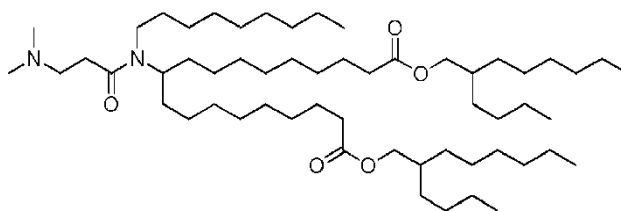
5



10

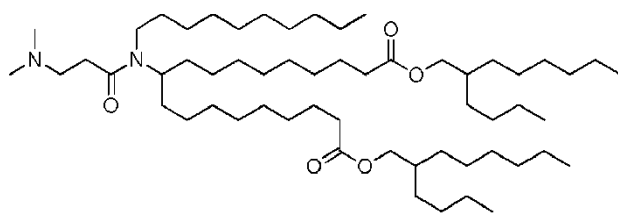


15

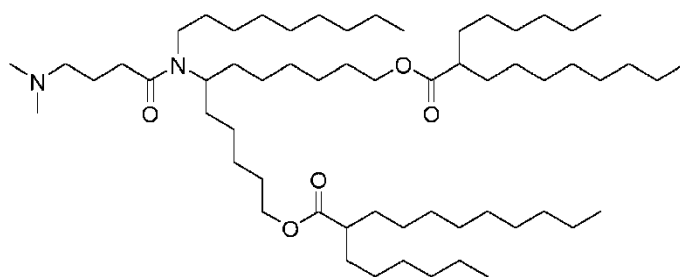
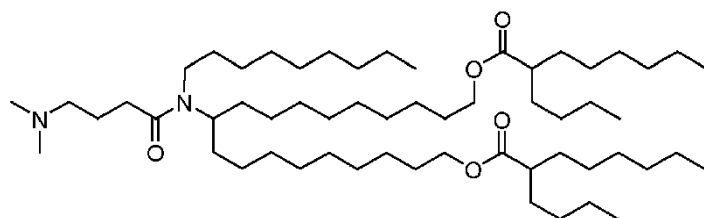


EP3908568

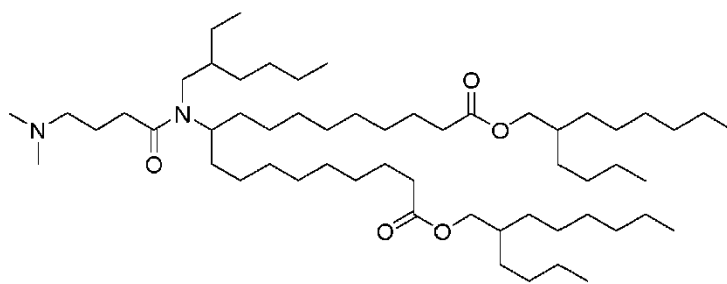
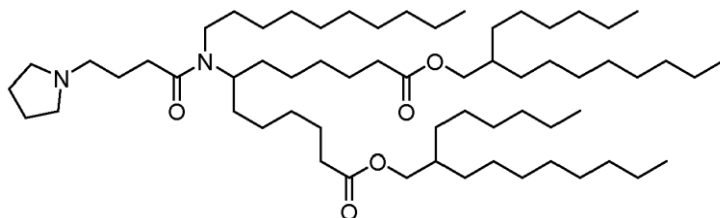
8



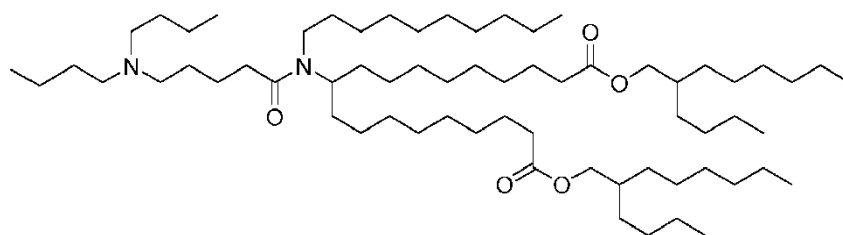
5



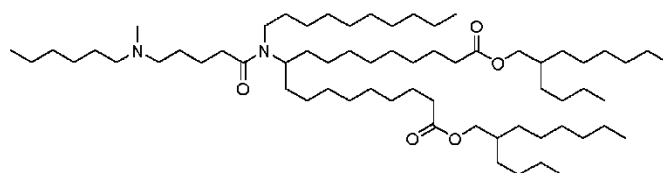
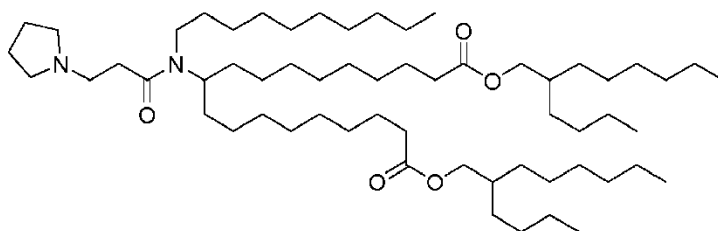
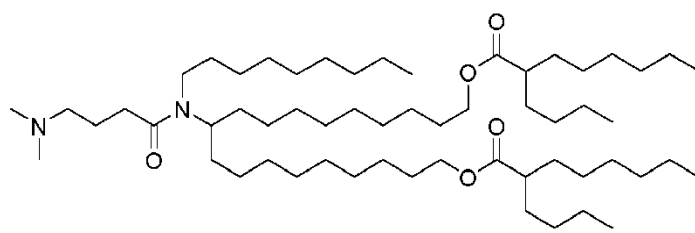
10



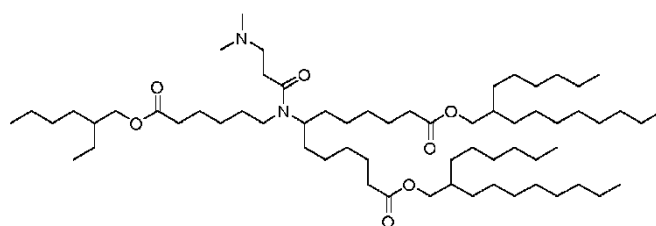
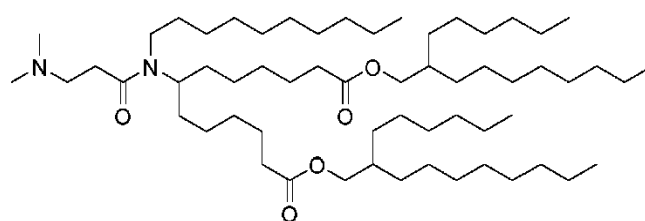
15



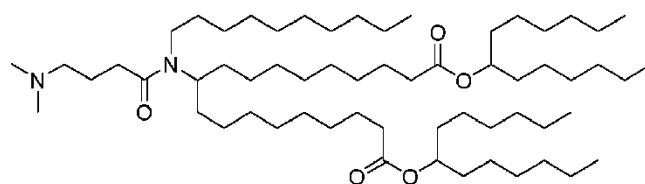
5



10

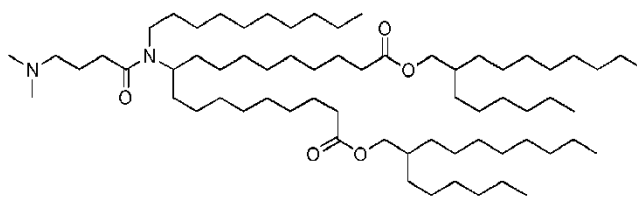


15

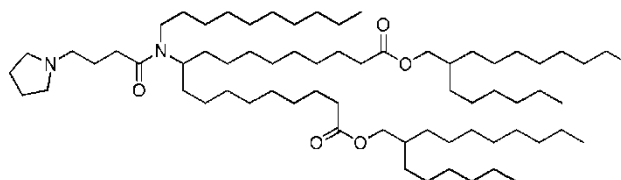


EP3908568

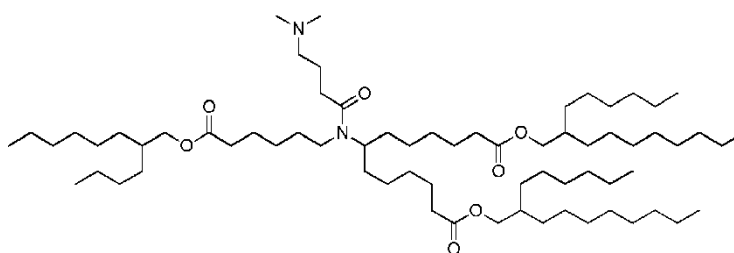
10



5



eller



10

11. Sammensetning omfattende forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-10 og et terapeutisk middel.

12. Sammensetning ifølge krav 11, hvor sammensetningen omfatter en lipidnanopartikkel.

13. Sammensetning ifølge krav 11 eller 12 for bruk som et medikament.

14. Lipidnanopartikkel omfattende forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-10.

20

15. Lipidnanopartikkel ifølge krav 14, videre omfattende:

- i) et terapeutisk middel; eller
- ii) en nukleinsyre, fortrinnsvis hvor nukleinsyren er valgt fra antisense- og messenger-RNA.