



(12) Translation of
european patent specification

(11) NO/EP 2331537 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 417/14 (2006.01)
A61K 31/4439 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

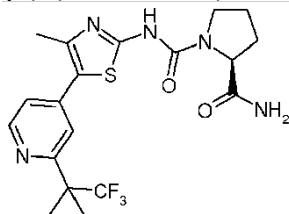
(21)	Translation Published	2016.03.07
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2015.10.28
(86)	European Application Nr.	09782777.8
(86)	European Filing Date	2009.09.08
(87)	The European Application's Publication Date	2011.06.15
(30)	Priority	2008.09.10, EP, 08164104 2008.09.12, US, 96674 P
(84)	Designated Contracting States:	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 SE SI SK SM TR
	Designated Extension States:	AL BA RS
(73)	Proprietor	Novartis AG, Lichtstrasse 35, 4056 Basel, CH-Sveits
(72)	Inventor	CARAVATTI, Giorgio, Novartis Pharma AGWerk KlybeckPostfach, CH-4002 Basel, CH-Sveits FAIRHURST, Robin Alec, Novartis Horsham Research CentreWimblehurst Road, HorshamSussex RH12 5AB, GB-Storbritannia FURET, Pascal, Novartis Pharma AGWerk KlybeckPostfach, CH-4002 Basel, CH-Sveits GUAGNANO, Vito, Novartis Pharma AGWerk KlybeckPostfach, CH-4002 Basel, CH-Sveits IMBACH, Patricia, Novartis Pharma AGWerk KlybeckPostfach, CH-4002 Basel, CH-Sveits
(74)	Agent or Attorney	Zacco Norway AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

(54)	Title	1-((5-HETEROARYLTHIAZOL-2-YL)AMINOCARBONYL)PYRROLIDINE-2-CARBOXAMIDE DERIVATIVES AS PHOSPHATIDYLINOSITOL 3-KINASE (PI3K) INHIBITORS USEFUL IN THE TREATMENT OF PROLIFERATIVE DISEASES
(56)	References Cited:	WO-A-2004/096797 WO-A-2005/021519

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. Forbindelsen (S)-pyrrolidin-1,2-dikarboksylsyre 2-amid 1-({4-metyl-5-[2-(2,2,2-trifluor-1,1-dimetyl-etyl)-pyridin-4-yl]-tiazol-2-yl}-amid), med struktur:



i fri form eller i form av et farmasøytisk akseptabelt salt.

2. Forbindelsen ifølge krav 1 i fri form eller i form av et farmasøytisk akseptabelt salt for bruk som farmasøytikum.

3. Bruk av forbindelsen ifølge krav 1 i fri form eller i form av et farmasøytisk akseptabelt salt for fremstilling av et medikament for behandling av kreft.

4. Bruk ifølge krav 3, hvori kreften er valgt fra sarkom; lunge-; bronkus-; prostata-; bryst-; bukspyttkjertel-; gastrointestinal kreft; tykktarms-; endetarmskreft; tykktarmskarsinom; kolorektalt adenom; skjoldbruskkjertel-; lever-; intrahepatisk gallegangs-; hepatocellulær; binyre-; mage-; gastrisk kreft; gliom; glioblastom; endometrial kreft; melanom; nyre-; nyrebekken-; urinblære-; livmorlegeme-; livmorhals-; vagina-; eggstokkreft; multippelt myelom; spiserørskreft; leukemi; akutt myelogen leukemi; kronisk myelogen leukemi; lymfocytisk leukemi; myeloid leukemi; hjernekreft; hjernekarzinom; kreft i munnhule og svelg; strupehode-; tynntarmskreft; non-Hodgkin lymfom; melanom; villøst tykktarmsadenom; neoplasie; neoplasie av epitelial karakter; lymfomer; brystkarzinom; basalcellekarzinom; plateepitelkarzinom; aktinisk keratose; tumorsykdom, inkludert faste tumorer; tumor i hals eller hode; polycytemi vera; essensiell trombocytemi; myelofibrose med myeloid metaplasie; og Waldenstrøms sykdom.

5. Farmasøytisk sammensetning omfattende en terapeutisk effektiv mengde av forbindelsen ifølge krav 1, i fri form eller i form av et farmasøytisk akseptabelt salt, og én eller flere farmasøytisk akseptable eksipienter.

6. Kombinert farmasøytisk sammensetning, tilpasset for samtidig eller sekvensiell administrering, omfattende en terapeutisk effektiv mengde av

forbindelsen ifølge krav 1 i fri form eller i form av et farmasøytisk akseptabelt salt og en terapeutisk effektiv mengde av én eller flere kombinasjonspartnere; og én eller flere farmasøytisk akseptable eksipienter.

5 7. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 5 eller en kombinert farmasøytisk sammensetning ifølge krav 6 for bruk i behandling av kreft.

8. Forbindelse ifølge krav 1 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for bruk i behandling av kreft.

10

9. Forbindelse ifølge krav 8 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for bruk i behandling av kreft valgt fra sarkom; lunge-; bronkus-; prostata-; bryst-; bukspyttkjertel-; gastrointestinal kreft; tykktarms-; endetarmskreft; tykktarmskarsinom; kolorektalt adenom; skjoldbruskkjertel-; lever-; intrahepatisk gallegangs-; hepatocellulær; binyre-; mage-; gastrisk kreft; gliom; glioblastom; endometrial kreft; melanom; nyre-; nyrebekken-; urinblære-; livmorlegeme-; livmorhals-; vagina-; eggstokkreft; multippelt myelom; spiserørskreft; leukemi; akutt myelogen leukemi; kronisk myelogen leukemi; lymfocytisk leukemi; myeloid leukemi; hjernekreft; hjernekarzinom; kreft i munnhule og svelg; strupehode-; tynntarmskreft; non-Hodgkin lymfom; melanom; villøst tykktarmsadenom; neoplasi; neoplasi av epitelial karakter; lymfomer; brystkarzinom; basalcellekarsinom; plateepitelkarzinom; aktinisk keratose; tumorsykdom, inkludert faste tumorer; tumor i hals og hode; polycytemi vera; essensiell trombocytemi; myelofibrose med myeloid metaplasi; og Waldenstrøms sykdom.

15

20

25