



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2440545 B1

NORWAY

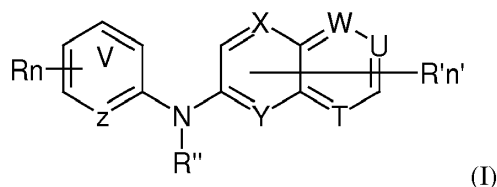
(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 401/12 (2006.01)
A61K 31/444 (2006.01)
A61P 43/00 (2006.01)
C07D 213/74 (2006.01)
C07D 215/38 (2006.01)
C07D 241/44 (2006.01)
C07D 403/12 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

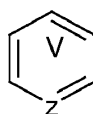
(21)	Translation Published	2019.09.30
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.04.24
(86)	European Application Nr.	10728368.1
(86)	European Filing Date	2010.06.14
(87)	The European Application's Publication Date	2012.04.18
(30)	Priority	2009.06.12, EP, 09162630 2009.06.12, EP, 09305540 2009.06.12, US, 186544 P 2009.06.12, US, 186552 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 ; SE ; SI ; SK ; SM ; TR
(73)	Proprietor	ABIVAX, 5 rue de la Baume, 75008 Paris, Frankrike Centre National de la Recherche Scientifique, 3, rue Michel Ange, 75794 Paris Cedex 16, Frankrike Institut Curie, 26, rue d'Ulm, 75248 Paris Cedex 05, Frankrike UNIVERSITE DE MONTPELLIER, 163 rue Auguste Broussonnet, 34090 Montpellier, Frankrike
(72)	Inventor	ROUX, Pierre, 700 rue des Erables, F-34980 Saint-gely-du-fesc, Frankrike MAHUTEAU, Florence, 36 avenue Hoche, F-78470 Saint Remy Les Chevreuse, Frankrike NAJMAN, Romain, 4 rue de la Corsade Bâtiment A2, F-94240 L'hay-les-roses, Frankrike TAZI, Jamal, 4 rue Condorcet, F-34380 Clapiers, Frankrike GADEA, Gilles, 61, rue de Syrah, 34270 Montpellier, Frankrike SCHERRER, Didier, 26 Avenue des Sabines,, 34170 Castelnau le lez, Frankrike BROCK, Carsten, 12 rue Francis Garnier,, 34090 Montpellier, Frankrike CAHUZAC, Nathalie, Résidence L'Albizia, Appt 13,3 rue Charles de Gaulle, 34830 Jacou, Frankrike
(74)	Agent or Attorney	TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

(54)	Title	COMPOUNDS USEFUL FOR TREATING CANCER
(56)	References Cited:	WO-A2-2008/115870 DATABASE CA [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 1 April 2011 (2011-04-01), BUCHMANN, GERHARD ET AL: "The preparation and reactivity of 4-hydroxy-7-chloroquinaldine", XP002631034, retrieved from STN Database accession no. 1963:27182 DATABASE CA [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 1 April 2011 (2011-04-01), KONDRATENKO, G. P. ET AL: "Bactericidal activity of some derivatives of N-heteroaromatic compounds", XP002631032, retrieved from STN Database accession no. 1978:500843 DATABASE CA [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 1 April 2011 (2011-04-01), GRITSENKO, A. N. ET AL: "Synthesis in phenothiazines. XXXIX. Dimethylpyridophenothiazines", XP002631033, retrieved from STN Database accession no. 1975:409942

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 med formel (I):

hvor:



betyr en aromatisk ring hvori V er C,

R uafhængig repræsenterer et hydrogenatom, et halogenatom eller en gruppe valgt blandt en -CN-gruppe; en hydroksylgruppe, en -COOR₁-gruppe; en (C₁-C₃)fluoralkylgruppe, en (C₁-C₃)fluoralkoksygruppe, en -NO₂-gruppe, en -NR₁R₂-gruppe, en (C₁-C₄)alkoksygruppe, en fenoksygruppe og en (C₁-C₃)alkylgruppe, idet alkylet eventuelt er monosubstitueret af en hydroksylgruppe,

R₁ og R₂ uafhængig er et hydrogenatom eller en (C₁-C₃)alkylgruppe,

n er 1, 2 eller 3,

n' er 1 eller 2,

R' er et hydrogenatom, et halogenatom eller en gruppe valgt blandt en

(C₁-C₃)alkylgruppe, en -COOR₁-gruppe, en -NO₂-gruppe, en -NR₁R₂-gruppe, en

morfolinyl- eller en morfolinogruppe, en N-metylpiperazinylgruppe, en

(C₁-C₃)fluoralkylgruppe, en (C₁-C₄)alkoksygruppe og en -CN-gruppe,

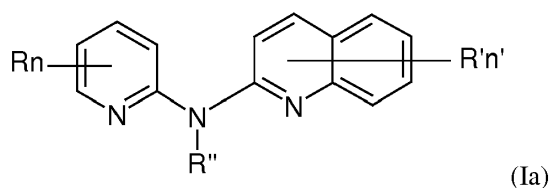
R'' er et hydrogenatom eller en (C₁-C₄)alkylgruppe,

Z er N, V er C, Y er N, X er C, T er C, U er C og W er C,

eller et hvilket som helst af dets farmasøytisk akseptable salt,

for anvendelse som et middel for at forebygge, inhibere eller behandle kræft.

2. Forbindelse med formel (I) ifølge krav 1, for anvendelse som et middel for at forebygge, inhibere eller behandle kræft, som har formel (Ia)



hvor:

R uavhengig representerer et hydrogenatom, et halogenatom eller en gruppe valgt blant en (C₁-C₃)alkylgruppe, en -CN-gruppe, en hydroksylgruppe, en -COOR₁-gruppe, en (C₁-C₃)fluoralkylgruppe, en -NO₂-gruppe, en -NR₁R₂-gruppe og en (C₁-C₃)alkoksygruppe, R'' er som definert i krav 1 og er fortrinnsvis et hydrogenatom,

5 n er som definert i krav 1 og er fortrinnsvis 1,

n' er som definert i krav 1 og er fortrinnsvis 1,

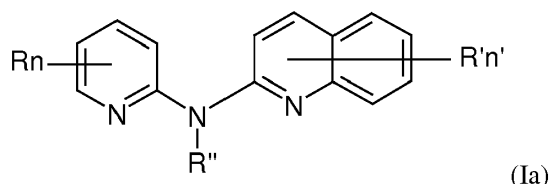
R' er et hydrogenatom, et halogenatom eller en gruppe valgt blant en

(C₁-C₃)alkylgruppe, en -NO₂-gruppe, en (C₁-C₃)alkoksygruppe og en -NR₁R₂-gruppe,

R₁ og R₂ er et hydrogenatom eller en (C₁-C₃)alkylgruppe,

10 eller ett av dets farmasøytisk akseptable salt.

3. Forbindelse med formel (I) ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, for anvendelse som et middel for å forebygge, inhibere eller behandle kreft, som har formel (Ia)



15

hvor:

R uavhengig representerer et hydrogenatom, et halogenatom eller en gruppe valgt blant en (C₁-C₃)alkylgruppe, en -CN-gruppe, en -COOR₁-gruppe og en (C₁-C₃)fluoralkylgruppe, R₁ er et hydrogenatom eller en (C₁-C₃)alkylgruppe,

20 R'' er som definert i krav 1 og er mer foretrukket et hydrogenatom,

n er som definert i krav 1 og er mer foretrukket 1,

n' er som definert i krav 1,

R' er et hydrogenatom, et halogenatom eller en (C₁-C₃)alkylgruppe,

eller ett av dets farmasøytisk akseptable salt.

25

4. Forbindelse valgt blant:

- (1) (8-klor-kinolin-2-yl)-pyridin-2-yl-amin

- (2) 2-(kinolin-2-ylamino)-isonikotinsyre

- (3) (4-metyl-pyridin-2-yl)-kinolin-2-yl-amin

30 - (4) pyridin-2-yl-kinolin-2-yl-amin

- (5) 2-(8-klor-kinolin-2-ylamino)-isonikotinsyre

- (6) (8-klor-kinolin-2-yl)-(4-metyl-pyridin-2-yl)-amin

- (7) 6-(kinolin-2-ylamino)-nikotinonitril

- (17) N-(6-metylpyridin-2-yl)kinolin-2-amin

35 - (18) 8-klor-N-(6-metylpyridin-2-yl)kinolin-2-amin

- (19) 4-metyl-N-(pyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- (20) 4-metyl-N-(4-metylpyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- (21) 3-metyl-N-(4-metylpyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- (22) 3-metyl-N-(pyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- 5 - (23) 6-((4-metylkinolin-2-yl)amino)nikotinonitril
- (24) 6-((3-metylkinolin-2-yl)amino)nikotinonitril
- (25) 6-klor-N-(4-metylpyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- (26) 6-klor-N-(6-metylpyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- (27) 4-metyl-N-(5-nitropyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- 10 - (28) N-(3-nitropyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- (29) 8-klor-N-(3-nitropyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- (30) 2-((4-metylkinolin-2-yl)amino)nikotinonitril
- (31) N-(3-metylpyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- (32) N-(5-metylpyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- 15 - (33) 2-(kinolin-2-ylamino)isonikotinonitril
- (34) N-(5-(trifluormetyl)pyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- (35) 8-klor-N-(3-metylpyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- (36) 8-klor-N-(5-metylpyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- (37) 8-klor-N-(5-(trifluormetyl)pyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- 20 - (38) N-(3-metoksy-pyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- (39) N-(5-nitropyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- (40) 6-((8-klorkinolin-2-yl)amino)nikotinonitril
- (41) N-(5-fluorpyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- (42) N-(6-(trifluormetyl)pyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- 25 - (43) 8-klor-N-(5-fluorpyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- (44) 2-((8-klorkinolin-2-yl)amino)nikotinsyre
- (45) 4-metyl-N-(6-metylpyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- (46) 3-metyl-N-(6-metylpyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- (47) 5-cyano-2-(kinolin-2-ylamino)pyridin-1-iumklorid
- 30 - (48) 2-((8-klorkinolin-2-yl)amino)-4-metylpyridin-1-iumklorid
- (49) 8-klor-N-(4-etylpyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- (50) 8-klor-N-(6-etylpyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- (51) 8-klor-N-(4,6-dimetylpyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- (52) 6-((8-klorkinolin-2-yl)amino)-2-metyl nikotinonitril
- 35 - (53) 8-klor-N-(4-klorpyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- (54) 8-metyl-N-(4-metylpyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- (55) N-(5-brom-4-metylpyridin-2-yl)-8-klorkinolin-2-amin
- (56) 8-klor-N-(3-etyl-6-metylpyridin-2-yl)kinolin-2-amin

- (57) 8-fluor-N-(4-metylpyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- (58) 8-brom-N-(4-metylpyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- (59) metyl-6-(kinolin-2-ylamino)nikotinat
- (60) metyl-6-[(8-klorkinolin-2-yl)amino]pyridin-3-karboksylat
- 5 - (61) metyl-6-[(3-metylkinolin-2-yl)amino]pyridin-3-karboksylat
- (62) metyl-2-[(8-klorkinolin-2-yl)amino]pyridin-3-karboksylat
- (63) 8-metoksy-N-(4-metylpyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- (64) N-(4-metylpyridin-2-yl)-5-nitrokinolin-2-amin
- (65) 2-N-(4-metylpyridin-2-yl)kinolin-2,8-diamin
- 10 - (66) N-(4-metylpyridin-2-yl)-5-aminokinolin-2-amin
- (67) metyl-6-[(4-metylkinolin-2-yl)amino]pyridin-3-karboksylat
- (68) 8-klor-N-[4-(trifluormetyl)pyridin-2-yl]kinolin-2-amin
- (69) 2-[(8-klorkinolin-2-yl)amino]pyridin-3-ol
- (70) 8-klor-N-[6-(trifluormetyl)pyridin-2-yl]kinolin-2-amin
- 15 - (71) 6-klor-N-(5-fluorpyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- (72) N-(6-etylpyridin-2-yl)-3-metylkinolin-2-amin
- (73) N-(5-fluorpyridin-2-yl)-3-metylkinolin-2-amin
- (74) 3-metyl-N-[5-(trifluormetyl)pyridin-2-yl]kinolin-2-amin
- (150) N-(4-metylpyridin-2-yl)-8-nitrokinolin-2-amin
- 20 - (151) 6-klor-N-(6-etylpyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- (152) 6-klor-N-(5-metylpyridin-2-yl)kinolin-2-amin
- (153) 6-klor-N-[5-(trifluormetyl)pyridin-2-yl]kinolin-2-amin
- (154) N2-(8-klorkinolin-2-yl)-4-metylpyridin-2,3-diamin
- og deres farmasøytisk akseptable salter.
- 25 for anvendelse som et middel for å forebygge, inhibere eller behandle kreft.