



(12) Translation of
european patent specification

(11) NO/EP 2646446 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 498/04 (2006.01)
A61K 31/424 (2006.01)
A61K 31/55 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)
C07D 498/14 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

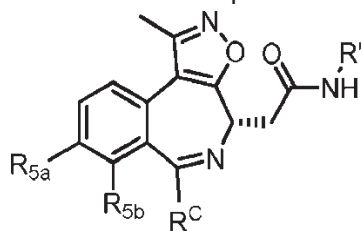
(21)	Translation Published	2015.10.05
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2015.05.13
(86)	European Application Nr.	11844513.9
(86)	European Filing Date	2011.12.02
(87)	The European Application's Publication Date	2013.10.09
(30)	Priority	2010.12.02, US, 419119 P 2011.03.10, US, 201161451332 P 2011.05.04, US, 201161482473 P 2011.09.29, US, 201161540725 P 2011.09.29, US, 201161540788 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
(73)	Proprietor	Constellation Pharmaceuticals, Inc., 215 First Street, Suite 200, Cambridge, MA 02142, US-USA
(72)	Inventor	ALBRECHT, Brian K., 179 Chestnut Street2, CambridgeMA 02139, US-USA AUDIA, James Edmund, 1 Stone Wall Lane, ZionsvilleIN 46077, US-USA CÔTÉ, Alexandre, 12 Florence Street, CambridgeMA 02139, US-USA GEHLING, Victor S., 35 Jay Street3, SomervilleMA 02144, US-USA HARMANGE, Jean-christophe, 57 William Street, AndoverMA 01810, US-USA HEWITT, Michael C., 186 Holland StreetUnit 2, SomervilleMA 02144, US-USA LEBLANC, Yves, 8 Lafford, KirklandQuebec H9J 3Y3, CA-Canada NASVESCHUK, Christopher G., 15 Phillips Road, StonehamMA 02180-4425, US- USA TAYLOR, Alexander M., 33 Parker Street2, CambridgeMA 02138, US-USA VASWANI, Rishi G., 45 Butts Street, NewtonMA 02464, US-USA
(74)	Agent or Attorney	Zacco Norway AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

(54)	Title	BROMODOMAIN INHIBITORS AND USES THEREOF
(56)	References Cited:	WO-A1-98/11111 WO-A1-2006/129623 US-A- 5 712 274 US-A1- 2010 286 127

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 representert ved følgende strukturelle formel:



5 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori:

R_{5a} er valgt fra hydrogen, halo og alkoksy;

R_{5b} er valgt fra hydrogen, halo og alkyl;

R^C er valgt fra fenyl, heteroaryl og mettet heterosyklyl, hvori gruppen representert ved R^C eventuelt er substituert med 1 til 2 substituenten uavhengig

10 valgt fra halo, -CN, alkyl, alkoksy, haloalkoksy, haloalkyl og karbamyl; og

R' er valgt fra hydrogen, alkyl og alkoksyalkyl.

2. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori R_{5a} er valgt fra hydrogen, klor og metoksy.

15 3. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori R_{5b} er valgt fra hydrogen, klor og metyl.

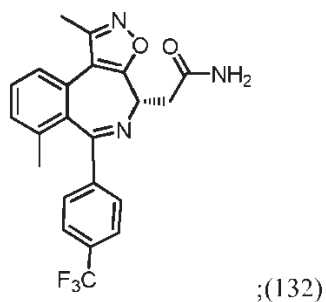
4. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori R_{5a} og R_{5b} samtidig er hydrogen.

20 5. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori R^C er valgt fra 4-klorfenyl, 4-cyanofenyl, 4-fluorfenyl, pyridin-4-yl, 4-trifluormetylphenyl, 5-klorpyridin-2-yl, 4-karbamylphenyl, 3-metoksyfenyl, 4-metoksyfenyl, 4-trifluormetoksyfenyl, 2-metyl-4-klorfenyl og morfolin-4-yl.

25 6. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori R' er valgt fra hydrogen, etyl, og 2-metoksyetyl.

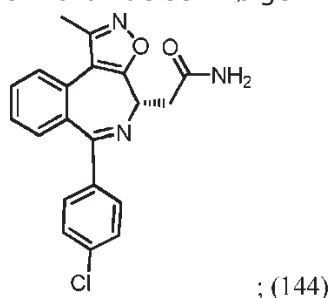
7. Forbindelsen ifølge krav 1 representert ved følgende strukturelle formel:

2



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

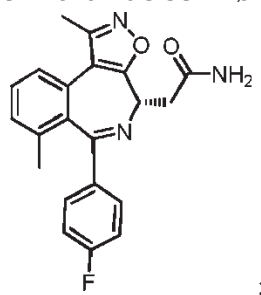
8. Forbindelsen ifølge krav 1 representert ved følgende strukturelle formel:



5

eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav

9. Forbindelsen ifølge krav 1 representert ved følgende strukturelle formel:



10

eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav

10. Farmasøytisk sammensetning omfattende: i) forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-9 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav; og ii) en farmasøytisk akseptabel adjuvant, bærer eller vehikkel.

15

11. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-9 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, eller en farmasøytisk sammensetning ifølge krav 10, for bruk i behandling av en sykdom eller tilstand valgt fra kreft og andre proliferative lidelser, inflammatoriske sykdommer, sepsis, autoimmun sykdom og virusinfeksjoner.

20

12. Forbindelsen eller sammensetning for bruk ifølge krav 11, hvori lidelsen er kreft.

5 13. Forbindelsen eller sammensetningen for bruk ifølge krav 12, hvori kreften er adenokarsinom, T-celle-leukemi/-lymfom hos voksne, blærekreft, blastom, benkreft, brystkreft, hjernekreft, karsinom, myeloid sarkom, livmorhalskreft, kolorektal kreft, spiserørskreft, gastrointestinal kreft, glioblastoma multiforme, gliom, galleblærekreft, magekreft, hode- og nakkekreft, Hodgkins lymfom, ikke-Hodgkins lymfom, intestinal kreft, nyrekreft, laryngeal kreft, leukemi, lungekreft, 10 lymfom, leverkreft, småcellet lungkreft, ikke-småcellet lungkreft, mesoteliom, multippelt myelom, øyekreft, tumor på synsnerven, munnkreft, eggstokkreft, hypofysetumor, lymfom i det primære sentrale nervesystemet, prostatakreft, pankreaskreft, faryngal kreft, nyrecellekarsinom, endetarmskreft, sarkom, hudkreft, spinaltumor, tynntarmskreft, magekreft, T-celle-lymfom, testikkelkreft, 15 skjoldbruskkjertelkreft, halskreft, urogenital kreft, urotelialt karsinom, livmorkreft, vaginalkreft, Wilms tumor, akutt myelogen leukemi eller Burkitts lymfom.

20 14. Forbindelsen eller sammensetningen for bruk ifølge krav 11, hvori lidelsen er sepsis, revmatoid artritt, irritabel tarm-syndrom eller psoriasis.