



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2858499 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 401/14 (2006.01)
A61K 31/435 (2006.01)
A61K 31/445 (2006.01)
A61P 37/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2018.10.15
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.05.16
(86)	European Application Nr.	13800042.7
(86)	European Filing Date	2013.06.07
(87)	The European Application's Publication Date	2015.04.15
(30)	Priority	2012.06.08, US, 201261657360 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	Sunesis Pharmaceuticals, Inc., 395 Oyster Point Blvd., Suite 400, South San Francisco, CA 94080, USA Biogen MA Inc., 225 Binney Street, Cambridge, MA 02142, USA
(72)	Inventor	HOPKINS, Brian T., 169 Washington Street Apt. 13, Newton, Massachusetts 02458, USA CONLON, Patrick, 20 Eaton Street, Wakefield, Massachusetts 01880, USA CHAN, Timothy R., 53 Bennington Street, Newton, Massachusetts 02458, USA JENKINS, Tracy J., 44 Vincent Avenue, Belmont, Massachusetts 02478, USA CAI, Xiongwei, c/o BIOGEN IDEC MA INC.133 Boston Post Road, Weston, Massachusetts 02493, USA HUMORA, Michael, c/o BIOGEN IDEC MA INC.133 Boston Post Road, Weston, Massachusetts 02493, USA SHI, Xianglin, c/o BIOGEN IDEC MA INC.133 Boston Post Road, Weston, Massachusetts 02493, USA MILLER, Ross A., 3001 Hadley RoadSuite 1-4, SouthPlainfield, New Jersey 07080, USA THOMPSON, Andrew, 3001 Hadley RoadSuite 1-4, South Plainfield, New Jersey 07080, USA
(74)	Agent or Attorney	PLOUGMANN VINGTOFT, Postboks 1003 Sentrum, 0104 OSLO, Norge

(54) Title **PYRIMIDINYL TYROSINE KINASE INHIBITORS**

(56) References

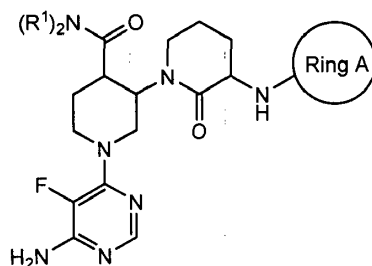
Cited: WO-A1-2011/029046, US-A1- 2005 143 372, US-A1- 2012 058 996, US-A1- 2012 040 961, US-A1- 2006 189 638

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:

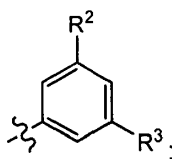
5



I

eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav,
hvor:

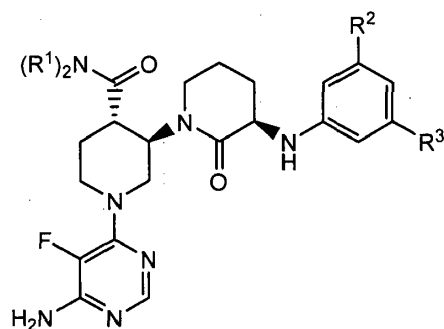
- 10 hver R^1 er uavhengig hydrogen, en eventuelt substituert C_{1-6} -alifatisk gruppe, en eventuelt substituert 3-7-leddet monosyklisk heterosyklisk gruppe eller en eventuelt substituert heterosyklalkylgruppe som har 3-7 karbonatomer og 1-3 heteroatomer uavhengig valgt fra nitrogen, oksygen eller svovel;
- 15 eller to R^1 -grupper tas sammen med deres mellomliggende atomer for å danne en eventuelt substituert 3-7-leddet mettet eller delvis umettet monosyklisk heterosyklisk ring som har 1-2 heteroatomer uavhengig valgt fra nitrogen, oksygen eller svovel;
- hvor eventuelt substituerte grupper kan substitueres med halogen, $-NO_2$, $-CN$, $-OR$, $-SR$, $-N(R)_2$, $-C(O)R$, $-CO_2R$, $-N(R)C(O)OR$, $-C(O)N(R)_2$, $-OC(O)R$, $-N(R)C(O)R$, $-S(O)R$, $-S(O)_2R$ eller $-S(O)_2N(R)_2$;
- 20 hver R er uavhengig hydrogen eller C_{1-6} -alifatisk;
- eller to R -grupper festet til det samme nitrogenet tas sammen med deres mellomliggende atomer for å danne en eventuelt substituert 3-7-leddet mettet eller delvis umettet monosyklisk heterosyklisk ring som har 1-2 heteroatomer, der
- 25 annethvert heteroatom er uavhengig valgt fra nitrogen, oksygen eller svovel;
- ring A er



R^2 er -Cl eller -F; og

R^3 er -CF₃, -OCF₃, eller -F.

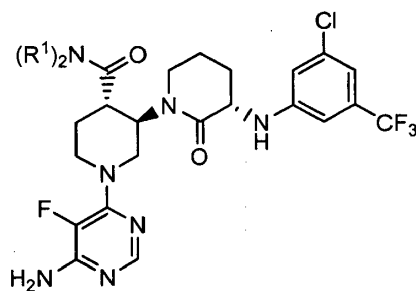
2. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori forbindelsen er af formel **II-a**:



II-a

eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, eller:

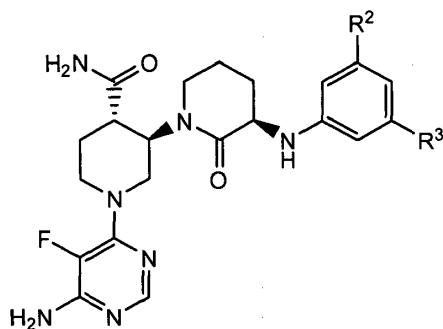
hvor forbindelsen er af formel **II-b**:



II-b

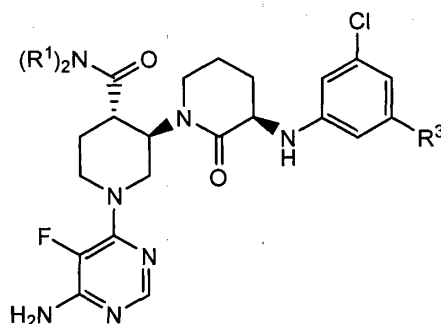
eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, eller:

10 hvori forbindelsen er af formel **III**:



III

3. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori forbindelsen er formel **IV**:



4. Forbindelsen ifølge krav 3, hvori R^3 er $-CF_3$, eller hvori R^3 er $-F$.

5 5. Forbindelsen ifølge krav 3, hvori begge R^1 er hydrogen.

6. Forbindelsen ifølge krav 3, hvori ett R^1 og det andre R^1 er en eventuelt substituert C_{1-6} alifatisk, fortrinnsvis hvori ett R^1 er hydrogen og det andre R^1 er metyl.

10 7. Forbindelsen ifølge krav 3, hvori (i) begge R^1 er eventuelt substituerte C_{1-6} -alifatiske grupper, eller:

hvori (ii) ett R^1 er hydrogen og det andre er eventuelt substituert C_{1-6} -alifatisk, eller:

hvori (iii) begge R^1 er eventuelt substituerte C_{1-6} -alifatiske grupper, eller:

hvori (iv) begge R^1 er hydrogen.

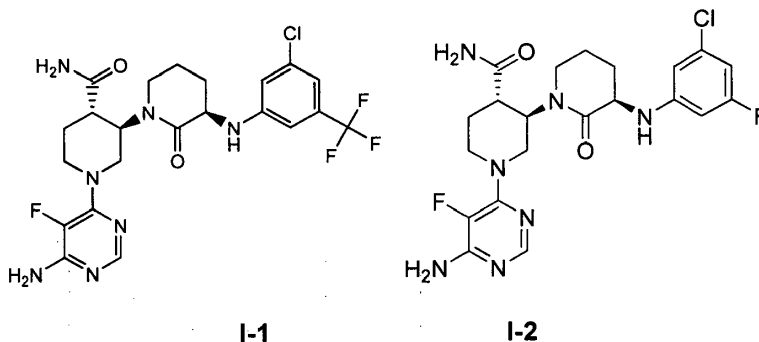
15

8. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori R^2 er $-Cl$, eller hvori R^2 er $-F$.

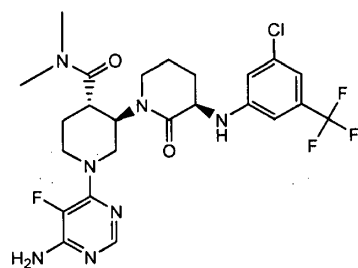
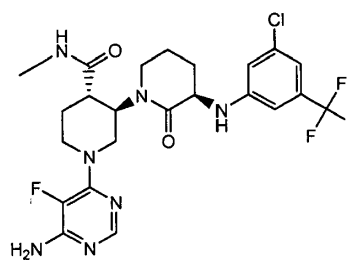
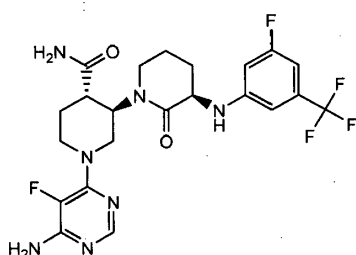
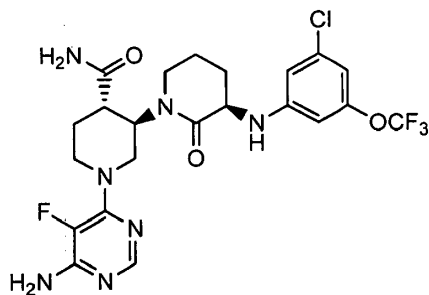
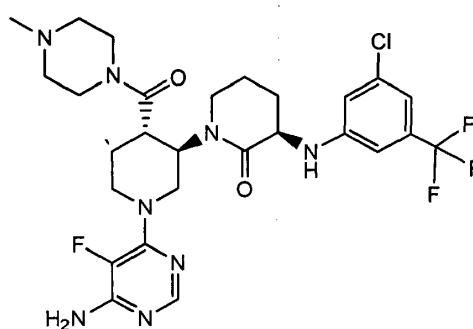
9. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori R^3 er $-CF_3$, eller hvori R^3 er $-OCF_3$, eller hvori R^3 er $-F$.

20

10. Forbindelsen ifølge krav 1, valgt fra gruppen som består av:



4

**I-3****I-4****I-5****I-6****I-7**

11. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-10 eller en sammensetning derav
5 for anvendelse i reduksjon av den enzymatiske aktiviteten til Brutons tyrosinkinase.

12. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-10 eller en sammensetning derav
for anvendelse i behandling av en forstyrrelse som er reagerer på hemming av Brutons
tyrosinkinase.

10

13. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-10 eller en sammensetning derav
for anvendelse i behandling av en forstyrrelse valgt fra gruppen som består av
autoimmune forstyrrelser, inflammatoriske forstyrrelser og kreft.

14. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 13, hvori forstyrrelsen er revmatoid artritt, eller hvori forstyrrelsen er systemisk lupus erytematose, eller hvori forstyrrelsen er atopisk dermatitt, eller hvori forstyrrelsen er leukemi eller lymfom.