



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3103453 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/497 (2006.01)
A61K 31/517 (2006.01)
A61K 31/5377 (2006.01)
A61K 45/00 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)
A61P 35/02 (2006.01)
A61P 43/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2020.06.15
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.04.01
(86)	European Application Nr.	15746276.3
(86)	European Filing Date	2015.02.03
(87)	The European Application's Publication Date	2016.12.14
(30)	Priority	2014.02.04, JP, 2014019226
(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	Astellas Pharma Inc., 5-1, Nihonbashi-Honcho 2-chome, Chuo-kuTokyo 103-8411, Japan
(72)	Inventor	EGUCHI, Tomohiro, c/o Astellas Pharma Inc.5-1 Nihonbashi-Honcho 2-chomeChuo-ku, Tokyo 103-8411, Japan MORI, Masamichi, c/o Astellas Pharma Inc.5-1 Nihonbashi-Honcho 2-chomeChuo-ku, Tokyo 103-8411, Japan YAMAKI, Yoko, c/o Astellas Pharma Inc.5-1 Nihonbashi-Honcho 2-chomeChuo-ku, Tokyo 103-8411, Japan
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54)	Title	MEDICINAL COMPOSITION COMPRISING DIAMINO HETEROCYCLIC CARBOXAMIDE COMPOUND AS ACTIVE INGREDIENT
------	-------	--

(56)	References Cited:	JP-A- 2011 515 397 EP-A1- 2 428 508 WO-A1-2015/127234 WO-A1-2010/128659
------	-------------------	--

US-A1- 2013 150 363

WO-A1-2013/040801

YAKES, F.M. ET AL.: 'Cabozantinib (XL184), a novel MET and VEGFR2 inhibitor, simultaneously suppresses metastasis, angiogenesis, and tumor growth' MOL. CANCER. THER. vol. 10, no. 12, 2011, pages 2298 - 2308, XP055031202

RAFAEL ROSELL ET AL: "Genetics and biomarkers in personalisation of lung cancer treatment", THE LANCET, vol. 382, no. 9893, 1 August 2013 (2013-08-01), pages 720-731, XP055098533, ISSN: 0140-6736, DOI: 10.1016/S0140-6736(13)61715-8

MOLLARD, A. ET AL.: 'Design, Synthesis and Biological Evaluation of a Series of Novel Axl Kinase Inhibitors' ACS MED. CHEM. LETT. vol. 2, no. 12, 2011, pages 907 - 912, XP055218969

BYERS, L.A . ET AL.: 'An epithelial-mesenchymal transition gene signature predicts resistance to EGFR and PI3K inhibitors and identifies Axl as a therapeutic target for overcoming EGFR inhibitor resistance' CLIN. CANCER RES. vol. 19, no. 1, 2013, pages 279 - 290, XP055197075

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. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av
5 AXL-relatert kreft, omfattende 6-etyl-3-({3-metoksy-4-[4-(4-metylpiperazin-1-yl)piperidin-1-yl]fenyl}amino)-5-(tetrahydro-2H-pyran-4-ylamino)pyrazin-2-karboksamid eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og et farmasøytisk akseptabelt hjelpestoff, hvor den AXL-relaterte kreften er kreft som har oppnådd resistens ved aktivering av AXL mot terapi med et antikreftmiddel.
- 10 2. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 1, hvor den AXL-relaterte kreften er kreft med høy uttrykkelse av AXL.
3. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 1, hvor kreften som har
15 oppnådd resistens ved aktivering av AXL mot terapi med et antikreftmiddel er ikke-småcellet lungekreft med aktiverende mutasjoner av EGFR, som har oppnådd resistens mot terapi med en EGFR-tyrosinkinasehemmer.
4. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 3, som er anvendt i
20 kombinasjon med EGFR-tyrosinkinasehemmeren.
5. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 4, hvor EGFR-tyrosinkinasehemmeren er en EGFR-tyrosinkinasehemmer valgt fra gruppen bestående av erlotinib, gefitinib, og lapatinib.
- 25 6. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 5, hvor EGFR-tyrosinkinasehemmeren er erlotinib.
7. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene
30 1 til 6, hvor 6-etyl-3-({3-metoksy-4-[4-(4-metylpiperazin-1-yl)piperidin-1-yl]fenyl}amino)-5-(tetrahydro-2H-pyran-4-ylamino)pyrazin-2-karboksamid eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav er 6-etyl-3-({3-metoksy-4-[4-(4-metylpiperazin-1-yl)piperidin-1-yl]fenyl}amino)-5-(tetrahydro-2H-pyran-4-ylamino)pyrazin-2-karboksamid.
- 35

8. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6, hvor 6-etyl-3-({3-metoksy-4-[4-(4-metylpiperazin-1-yl)piperidin-1-yl]fenyl}amino)-5-(tetrahydro-2H-pyran-4-ylamino)pyrazin-2-karboksamid eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav er 6-etyl-3-({3-metoksy-4-[4-(4-metylpiperazin-1-yl)piperidin-1-yl]fenyl}amino)-5-(tetrahydro-2H-pyran-4-ylamino)pyrazin-2-karboksamidhemifumarat.