



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3160978 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07H 19/10 (2006.01)
A61K 31/7068 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2020.10.12
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.07.29
(86)	European Application Nr.	15733497.0
(86)	European Filing Date	2015.06.25
(87)	The European Application's Publication Date	2017.05.03
(30)	Priority	2014.06.25, GB, 201411253 2014.06.25, IN, 2050MU2014
(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	NuCana plc, 3 Lochside Way, Edinburgh EH12 9DT, Storbritannia
(72)	Inventor	GRIFFITH, Hugh, NuCana BioMed Limited 10 Lochside Place, Edinburgh Scotland EH12 9RG, Storbritannia MCGUIGAN, Christopher, School of Pharmacy and Pharmaceutical Sciences Cardiff University Redwood Building King Edward VII Avenue, Cardiff South Glamorgan CF10 3NB, Storbritannia SLUSARCZYK, Magdalena, School of Pharmacy and Pharmaceutical Sciences Cardiff University Redwood Building King Edward VII Avenue, Cardiff South Glamorgan CF10 3NB, Storbritannia SERPI, Michaela, School of Pharmacy and Pharmaceutical Sciences Cardiff University Redwood Building King Edward VII Avenue, Cardiff South Glamorgan CF10 3NB, Storbritannia FERRARI, Valentina, 83 West Cliff Road, Ramsgate CT11 9NS, Storbritannia
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54) Title **GEMCITABINE PRODRUGS**

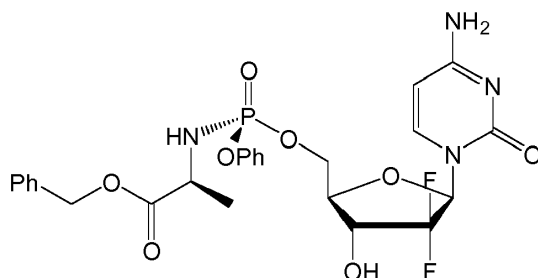
(56) References

Cited: WO-A1-2014/076490, WO-A2-2005/012327, WO-A2-2015/081133
MAGDALENA SLUSARCZYK ET AL: "Application of ProTide Technology to Gemcitabine: A
Successful Approach to Overcome the Key Cancer Resistance Mechanisms Leads to a New
Agent (NUC-1031) in Clinical Development", JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, vol. 57,
no. 4, 27 February 2014 (2014-02-27), pages 1531-1542, XP055205033, ISSN: 0022-2623, DOI:
10.1021/jm401853a

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 formulering omfattende gemcitabin-[fenyl-benzoksy-L-alaninyl)]-(*S*)-fosfat **3**:



5 eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav, som har en diastereoisomer renhet på mer enn 90 %, og minst én farmasøytisk akseptabelt eksipiens; hvori formuleringen er en vandig formulering som også omfatter et polart organisk løsningsmiddel.

10 2. Farmasøytisk formulering ifølge krav 1, hvori formuleringen er egnet for parenteral administrering.

3. Farmasøytisk formulering ifølge krav 2, hvori formuleringen er egnet for intravenøs administrering.

15 4. Farmasøytisk formulering ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvori formuleringen videre omfatter et syklodekstrin.

5. Farmasøytisk formulering ifølge krav 1, hvori formuleringen er egnet for oral administrering.

20

6. Farmasøytisk formulering ifølge et hvilket som helst foregående krav, hvori gemcitabin-[fenyl-benzoksy-L-alaninyl)]-(*S*)-fosfatet **3** er i form av en fri base.

25 7. Farmasøytisk formulering ifølge et hvilket som helst foregående krav, hvori gemcitabin-[fenyl-benzoksy-L-alaninyl)]-(*S*)-fosfatet **3** har en diastereoisomer renhet på mer enn 95 %.

8. Farmasøytisk formulering ifølge krav 7, hvori gemcitabin-[fenyl-benzoksy-L-alaninyl)]-(*S*)-fosfatet **3** har en diastereoisomer renhet på mer enn 98 %.

30 9. Farmasøytisk formulering ifølge krav 8, hvori gemcitabin-[fenyl-benzoksy-L-

alaninyl)]-(*S*)-fosfatet **3** har en diastereoisomer renhet på mer enn 99,5 %.

10. Farmasøytisk formulering ifølge et hvilket som helst foregående krav, for anvendelse i behandling av kreft.

5

11. Farmasøytisk formulering for anvendelse ifølge krav 10, hvori kreften velges fra: kreft i bukspyttkjertelen, brystkreft, eggstokkreft, blærekreft, tykktarmskreft, lungekreft, blærekreft, prostatakreft, kolangiokarsinom, nyrekreft, livmorhalskreft, tymisk kreft, en kreft med ukjent primær opprinnelse, lymfom eller leukemi.