



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3333161 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 401/02 (2006.01)
A61K 31/437 (2006.01)
A61K 31/506 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)
C07D 471/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

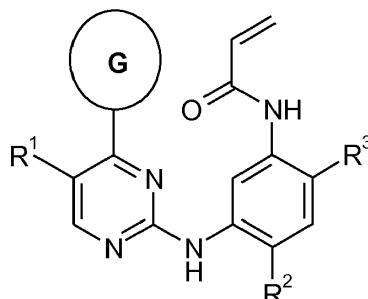
(45)	Translation Published	2020.07.13
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.02.19
(86)	European Application Nr.	17194307.9
(86)	European Filing Date	2012.07.25
(87)	The European Application's Publication Date	2018.06.13
(30)	Priority	2011.07.27, US, 201161512061 P 2012.01.27, US, 201261591363 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
(62)	Divided application	EP3009431, 2012.07.25
(73)	Proprietor	Astrazeneca AB, 151 85 Södertälje, Sverige
(72)	Inventor	BUTTERWORTH, Sam, c/o AstraZeneca Intellectual Property, AstraZenecaAlderley Park, Macclesfield, Cheshire SK10 4TG, Storbritannia WARD, Richard, Andrew, AstraZenecaDarwin Building Cambridge Science Park, MiltonRoad, Cambridge, Cambridgeshire CB4 0WG, Storbritannia FINLAY, Maurice, Raymond, Verschoyle, AstraZeneca, Darwin BuildingCambridge Science Park, Milton Road, Cambridge, Cambridgeshire CB4 0WG, Storbritannia KADAMBAR, Vasantha, Krishna, AstraZenecaAlderley Park, Macclesfield, Cheshire SK10 4TG, Storbritannia CHINTAKUNTLA, Chandrasekhara, Reddy, AstraZenecaAlderley Park, Macclesfield, Cheshire SK10 4TG, Storbritannia MURUGAN, Andiappan, AstraZenecaAlderley Park, Macclesfield, Cheshire SK10 4TG, Storbritannia CHUAQUI, Claudio, Edmundo, AstraZeneca35 Gatehouse Drive, Waltham, MA 02451, USA REDFEARN, Heather, Marie, AstraZenecaCharter Way, Macclesfield, Cheshire SK10 2NA, Storbritannia
(74)	Agent or Attorney	TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

-
- (54) Title **2-(2,4,5-SUBSTITUTED-ANILINO)PYRIMIDINE DERIVATIVES AS EGFR MODULATORS
USEFUL FOR TREATING CANCER**
- (56) References
Cited: WO-A1-2009/158571
 US-A1- 2011 046 370
 WO-A1-02/083653
 WO-A1-2011/053476

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. En forbindelse med formel (I):



(I)

hvor:

G er valgt fra 4,5,6,7-tetrahydropyrazolo[1,5-a]pyridin-3-yl, 1*H*-indol-3-yl, 1-metyl-1-*H*-indol-3-yl og pyrazolo[1,5-a]pyridin-3-yl;

R¹ er valgt fra hydrogen, fluor, klor, metyl og cyano;

R² er valgt fra metoksy og metyl; og

R³ er valgt fra (3*R*)-3-(dimetylamino)pyrrolidin-1-yl, (3*S*)-3-(dimetylamino)pyrrolidin-1-yl, 3-(dimetylamino)azetidin-1-yl, [2-(dimetylamino)etyl]-(metyl)amino, [2-(metylamino)etyl](metyl)amino, 5-metyl-2,5-diazaspiro[3,4]okt-2-yl, (3*aR*,6*aR*)-5-metylheksa-hydro-pyrrolo[3,4-*b*]pyrrol-1(2*H*)-yl, 1-metyl-1,2,3,6-tetrahydropyridin-4-yl, 4-metylpiperazin-1-yl, 4-[2-(dimetylamino)-2-oksoetyl]piperazin-1-yl, metyl[2-(4-metylpiperazin-1-yl)etyl]amino, metyl[2-(morfolin-4-yl)etyl]amino og 4-[(2*S*)-2-aminopropanoyl]piperazin-1-yl;

eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

2. En forbindelse med formel (I), eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, ifølge krav 1, hvor G er valgt fra 1*H*-indol-3-yl, 1-metyl-1*H*-indol-3-yl og pyrazolo[1,5-a]pyridin-3-yl.

3. En forbindelse med formel (I), eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, ifølge krav 1 eller krav 2, hvor R¹ er hydrogen.

4. En forbindelse med formel (I), eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvor R² er metoksy.

5. En forbindelse med formel (I), eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, hvor G er 1-metyl-1*H*-indol-3-yl.

6. En forbindelse med formel (I), eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, ifølge krav 1, hvor R^3 er [2-(dimetylamino)etyl]-(metyl)amino.

7. En farmasøytisk sammensetning, som omfatter forbindelsen med formel (I), eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6, i assosiasjon med et farmasøytisk akseptabelt fortynningsmiddel eller bærer.

8. Forbindelsen med formel (I), eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6, for anvendelse som et medikament.

9. Forbindelsen med formel (I), eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6, for anvendelse ved behandling av kreft.

10. Forbindelsen med formel (I), eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6, for anvendelse ved behandling av ikke-småcellet lungekreft.

11. Forbindelsen med formel (I), eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6, for anvendelse ved behandling av en sykdom mediert gjennom L858R EGFR mutant og/eller T790M EGFR og / eller Exon19 delesjon-aktiverende mutant.

12. Et farmasøytisk produkt som omfatter forbindelsen med formel (I) eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6, og en ytterligere anti-tumorsubstans for anvendelse ved samtidig behandling av kreft.

13. Det farmasøytiske produktet for anvendelse ifølge krav 12, hvor kreften er ikke-småcellet lungekreft.

14. Forbindelsen med formel (I), eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6, og et ytterligere anti-tumorsubstans for anvendelse ved samtidig behandling av kreft.

15. Forbindelsen med formel (I), eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6, og et ytterligere anti-tumorsubstans, for anvendelse ved samtidig behandling av ikke-småcellet lungekreft.