



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 3354652 B1

NORWAY

(19) NO  
(51) Int Cl.  
**C07D 487/04 (2006.01)**  
**A61K 31/519 (2006.01)**  
**A61P 1/00 (2006.01)**  
**A61P 11/00 (2006.01)**  
**A61P 11/06 (2006.01)**  
**A61P 27/02 (2006.01)**  
**A61P 35/00 (2006.01)**

**Norwegian Industrial Property Office**

(45) Translation Published 2020.09.14

(80) Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent 2020.05.06

(86) European Application Nr. 17211097.5

(86) European Filing Date 2011.03.09

(87) The European Application's Publication Date 2018.08.01

(30) Priority 2010.03.10, US, 312588 P  
2010.11.19, US, 415602 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 EP3050882, 2011.03.09

(73) Proprietor Incyte Holdings Corporation, 1801 Augustine Cut-Off, Wilmington, DE 19803, USA

(72) Inventor HUANG, Taisheng, 522 Chariot Court, Wilmington, DE 19808, USA  
XUE, Chu-Biao, 307 Wellspring Court, Hockessin, DE 19707, USA  
WANG, Anlai, c/o Incyte Corporation 1801 Augustine Cut-Off, Wilmington, Delaware 19803, USA  
KONG, Ling, 5 Fritze Court, Hockessin, DE 19707, USA  
YE, Hai Fen, 45 West Park Place, Newark, DE 19711, USA  
YAO, Wenqing, 748 Meadowbank Road, Kennett Square, PA 19348, USA  
RODGERS, James D., c/o Incyte Corporation 1801 Augustine Cut-Off, Wilmington, Delaware 19803, USA  
SHEPARD, Stacey, 2200 C Inglewood Road, Wilmington, DE 19803, USA  
WANG, Haisheng, 207 Hockessin Circle, Hockessin, DE 19707, USA  
SHAO, Lixin, 20 Presidential Drive Apt C, Wilmington, DE 19807, USA  
LI, Hui-Yin, c/o Incyte Corporation 1801 Augustine Cut-Off, Wilmington, Delaware 19803, USA  
LI, Qun, 10 Crompton Court, Newark, DE 19702, USA

(74) Agent or Attorney OSLO PATENTKONTOR AS, Hoffsvveien 1A, 0275 OSLO, Norge

---

(54) Title **PIPERIDIN-4-YL AZETIDINE DERIVATIVES AS JAK1 INHIBITORS**

(56) References

Cited: WO-A1-2007/070514  
WO-A1-2007/117494  
US-A1- 2009 233 903  
WO-A1-2012/068450  
WO-A1-2010/039939

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 som er {1-{1-[3-Fluor-2-(trifluormetyl)isonikotinoyl]piperidin-4-yl}-3-[4-(7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-yl)-1H-pyrazol-1-yl]azetidin-3-yl}acetonitril, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse i
- 5 behandling av en JAK-assosiert sykdom valgt fra:
- (a) ulcerøs kolitt;
  - (b) kronisk obstruktiv lungesykdom (KOLS);
  - (c) pemphigus vulgaris;
  - (d) astma;
  - 10 (e) systemisk lupus erythematosus;
  - (f) sklerodermi;
  - (g) ankyloserende spondylitt;
  - (h) akutt lymfoblastisk leukemi (ALL);
  - (i) akutt myelogen leukemi (AML);
  - 15 (j) kutan T-celle lymfom (CTCL);
  - (k) mycosis fungoides;
  - (l) tykktarmskreft;
  - (m) kolorektal kreft;
  - (n) post-essensiell trombocytomia myelofibrose (Post-ET MF);
  - 20 (o) post polycythemii vera myelofibrose (Post-PV MF);
  - (p) acneiform utslett;
  - (q) sarkoidose;
  - (r) rhinitt;
  - (s) bihulebetennelse;
  - 25 (t) blefaritt;
  - (u) konjunktivitt;
  - (v) uveitt;
  - (w) skleritt;
  - (x) iritt;
  - 30 (y) kakeksi;
  - (z) systemisk inflammatorisk responssyndrom (SIRS); og
  - (æ) septisk sjokk.
2. Forbindelse eller salt for anvendelse ifølge krav 1, hvor saltet er {1-{1-[3-
- 35 fluor-2-(trifluormetyl)isonikotinoyl]piperidin-4-yl}-3-[4-(7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-yl)-1H-pyrazol-1-yl]azetidin-3-yl}acetonitriladipinsyresalt.

3. Forbindelse eller salt for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 2, hvor den JAK-assosierte sykdommen er ulcerøs kolitt.
4. Forbindelse eller salt for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 2, hvor den JAK-assosierte sykdommen er kronisk obstruktiv lungesykdom (KOLS).
5. Forbindelse eller salt for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 2, hvor den JAK-assosierte sykdommen er pemphigus vulgaris.
- 10 6. Forbindelse eller salt for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 2, hvor den JAK-assosierte sykdommen er astma.
7. Forbindelse eller salt for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 2, hvor den JAK-assosierte sykdommen er systemisk lupus erythematosus.
- 15 8. Forbindelse eller salt for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 2, hvor den JAK-assosierte sykdommen er sklerodermi.
9. Forbindelse eller salt for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 2, hvor den JAK-assosierte sykdommen er ankyloserende spondylitt.
- 20 10. Forbindelse eller salt for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 2, hvor den JAK-assosierte sykdommen er akutt lymfoblastisk leukemi (ALL).
- 25 11. Forbindelse eller salt for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 2, hvor den JAK-assosierte sykdommen er akutt myelogen leukemi (AML).
12. Forbindelse eller salt for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 2, hvor den JAK-assosierte sykdommen er kutan T-celle lymfom (CTCL).
- 30 13. Forbindelse eller salt for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 2, hvor den JAK-assosierte sykdommen er mycosis fungoides.
14. Forbindelse eller salt for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 2, hvor den JAK-assosierte sykdommen er tykktarmskreft.
- 35 15. Forbindelse eller salt for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 2, hvor den JAK-assosierte sykdommen er kolorektal kreft.