



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3357513 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

A61K 45/06 (2006.01)

A61K 31/4166 (2006.01)

A61P 35/04 (2006.01)

A61K 31/4035 (2006.01)

A61K 31/454 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2023.12.04
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.10.25
(86)	European Application Nr.	16850363.9
(86)	European Filing Date	2016.09.28
(87)	The European Application's Publication Date	2018.08.08
(30)	Priority	2015.09.29, CN, 201510631654
(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
(73)	Proprietor	Kangpu Biopharmaceuticals, Ltd., 780 Cailun Road, Suite 818 Zhangjiang Hi-Tech Park Pudong New Area, Shanghai 201203, Kina
(72)	Inventor	GE, Chuansheng, 780 Cailun Road, Suite 818, Zhangjiang Hi-Tech Park Pudong New Area, Shanghai 201203, Kina LIAO, Baisong, 780 Cailun Road, Suite 818, Zhangjiang Hi-Tech Park Pudong New Area, Shanghai 201203, Kina LEE, Wen-Cherng, 780 Cailun Road, Suite 818, Zhangjiang Hi-Tech Park Pudong New Area, Shanghai 201203, Kina
(74)	Agent or Attorney	RWS, Europa House, Chiltern Park, Chiltern Hill, SL99FG CHALFONT ST PETER, Storbritannia

(54) Title **PHARMACEUTICAL COMPOSITION AND APPLICATION THEREOF**

(56) References

Cited:

WO-A1-02/059106, US-A1- 2015 080 419, US-A1- 2014 011 774, US-A1- 2011 196 150,
US-A1- 2004 087 546, US-A1- 2003 045 552, WO-A1-2014/152833, WO-A1-2011/050962,
FANG, LUO ET AL.: 'The New Progress of Global Antineoplastic Drug R&D' PROCEEDINGS OF
ANTICANCER DRUG SYMPOSIUM ON RESEARCH PROGRESS AND PERSONALIZED
THERAPY 31 December 2013, pages 211 - 233, XP009508158
MICHAEL E. JUNG ET AL: "Structure-Activity Relationship for Thiohydantoin Androgen
Receptor Antagonists for Castration-Resistant Prostate Cancer (CRPC)", JOURNAL OF
MEDICINAL CHEMISTRY, vol. 53, no. 7, 8 April 2010 (2010-04-08), pages 2779-2796,
XP055122595, ISSN: 0022-2623, DOI: 10.1021/jm901488g
ANDRESSA ARDIANI ET AL: "Androgen deprivation therapy sensitizes prostate cancer cells to
T-cell killing through androgen receptor dependent modulation of the apoptotic pathway",
ONCOTARGET, vol. 5, no. 19, 15 October 2014 (2014-10-15), XP055488676, United States
ISSN: 1949-2553, DOI: 10.18632/oncotarget.2429
CHADI NABHAN ET AL: "The Role of IMiDs Alone or in Combination in Prostate Cancer",
CLINICAL GENITOURINARY CANCER, vol. 10, no. 3, 1 September 2012 (2012-09-01), pages
141-146, XP055488662, US ISSN: 1558-7673, DOI: 10.1016/j.clgc.2012.03.005

Jeanny B Aragon-Ching ET AL: "Thalidomide analogues as anticancer drugs", Recent patents on anti-cancer drug discovery, 1 June 2007 (2007-06-01), pages 167-174, XP055474095, United Arab Emirates Retrieved from the Internet: URL:<https://www.ncbi.nlm.nih.gov/pmc/articles/PMC2048745/>

CHADI NABHAN ET AL: "Lenalidomide Monotherapy in Chemotherapy-Naive, Castration-Resistant Prostate Cancer Patients: Final Results of a Phase II Study", CLINICAL GENITOURINARY CANCER, vol. 12, no. 1, 1 February 2014 (2014-02-01), pages 27-32, XP055488660, US ISSN: 1558-7673, DOI: 10.1016/j.clgc.2013.09.001

GULLEY J L ET AL: "Kinetics of Serum Androgen Normalization and Factors Associated With Testosterone Reserve After Limited Androgen Deprivation Therapy for Nonmetastatic Prostate Cancer", JOURNAL OF UROLOGY, LIPPINCOTT WILLIAMS & WILKINS, BALTIMORE, MD, US, vol. 180, no. 4, 1 October 2008 (2008-10-01), pages 1432-1437, XP025410332, ISSN: 0022-5347, DOI: 10.1016/J.JURO.2008.06.017 [retrieved on 2008-08-16]

FIGG W D ET AL: "A Double-Blind Randomized Crossover Study of Oral Thalidomide Versus Placebo for Androgen Dependent Prostate Cancer Treated With Intermittent Androgen Ablation", JOURNAL OF UROLOGY, LIPPINCOTT WILLIAMS & WILKINS, BALTIMORE, MD, US, vol. 181, no. 3, 1 March 2009 (2009-03-01), pages 1104-1113, XP025993684, ISSN: 0022-5347, DOI: 10.1016/J.JURO.2008.11.026 [retrieved on 2009-01-23]

PANG, RAN ET AL.: 'The Progress of Treatment of HRPc' CHINESE JOURNAL OF SURGERY OF INTEGRATED TRADITIONAL AND WESTERN MEDICINE vol. 19, no. 1, 28 February 2013, pages 100 - 102, XP009505371

William D. Figg ET AL: "A Randomized Phase II Trial of Thalidomide, an Angiogenesis Inhibitor, in Patients with Androgen-independent Prostate Cancer", Clinical Cancer Research, 1 July 2001 (2001-07-01), page 1888, XP055488059, United States Retrieved from the Internet: URL:<http://clincancerres.aacrjournals.org/content/clincanres/7/7/1888.full.pdf>

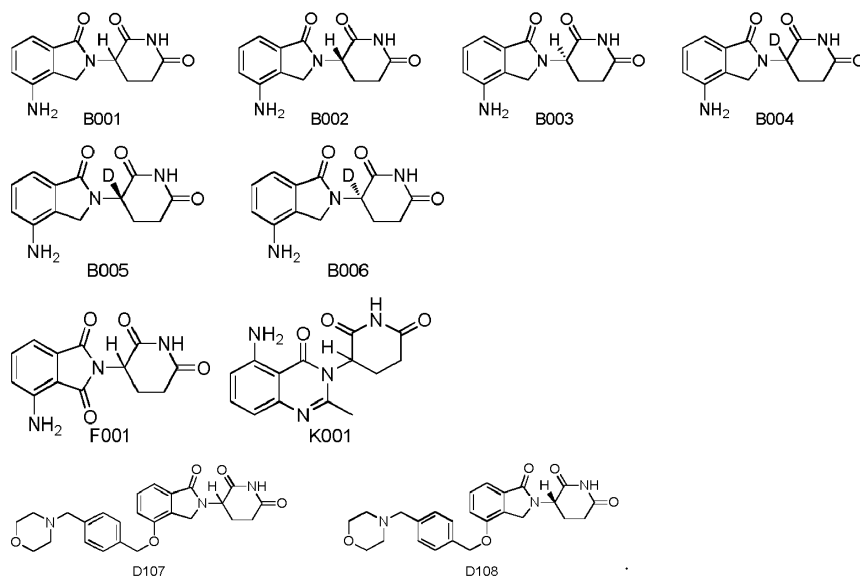
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters 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

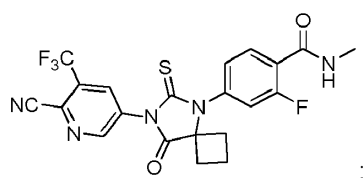
1. Farmasøytisk sammensetning som omfatter: i) en benzoheterosyklisk forbindelse, et farmasøytisk akseptabelt salt av dette, eller en stereoisomer av dette, og ii) én eller flere androgenreseptorveimodulatorer;

der kombinasjonen av den benzoheterosykliske forbindelsen og androgenreseptorveimodulatoren er denne: B001 og enzalutamid, K001 og enzalutamid, D107 og enzalutamid, B001 og ARN-509, K001 og ARN-509, D107 og ARN-509, B001 og galeteron, K001 og galeteron, D107 og galeteron, B001 og ODM-201, K001 og ODM-201, D108 og ODM-201, F001 og ODM-201, B002 og enzalutamid, B003 og enzalutamid, B004 og enzalutamid, B005 og enzalutamid, B006 og enzalutamid, B002 og ARN-509, B003 og ARN-509, B004 og ARN-509, B005 og ARN-509, B006 og ARN-509, B001 og enzalutamid og galeteron, B001 og enzalutamid og abirateronacetat, B001 og ARN-509 og abirateronacetat, B001 og ARN-509 og galeteron, K001 og enzalutamid og galeteron, K001 og enzalutamid og abirateronacetat, K001 og ARN-509 og abirateronacetat, K001 og ARN-509 og galeteron;

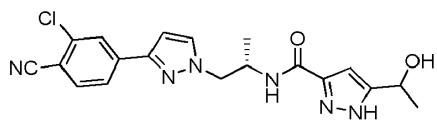
der strukturene av B001, B002, B003, B004, B005, B006, F001, K001, D107 og D108 er som følger:



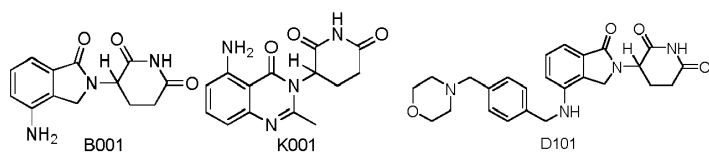
og der strukturen av ARN-509 er



strukturen av ODM-201 er



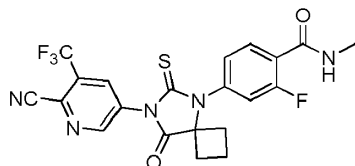
2. Farmasøytisk sammensetning som omfatter: i) en benzoheterosykklisk forbindelse, et farmasøytisk akseptabelt salt av dette, eller en stereoisomer av dette, og ii) én eller flere androgenreseptorveimodulatorer og iii) en hormonforbindelse; der den benzoheterosykliske forbindelsen er B001, K001 eller D101; og der kombinasjonen av androgenreseptorveimodulatoren og hormonforbindelsen er prednison og abirateronacetat, enzalutamid og prednison, ARN-509 og prednison, enzalutamid og galeteron og prednison, enzalutamid og abirateronacetat og prednison, ARN-509 og galeteron og prednison, ARN-509 og abirateronacetat og prednison; der strukturene av B001, K001 og D101 er som følger:



og

der

strukturen av ARN-509 er



3. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1 til bruk for å forebygge og/eller behandle en prostatakrefte.

4. Farmasøytisk sammensetning til bruk ifølge krav 3, der den benzoheterosykliske forbindelsen og androgenreseptorveimodulatoren blir administrert samtidig eller i rekkefølge eller separat.

5. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 2 til bruk for å forebygge og/eller behandle en prostatakrefte.

6. Farmasøytisk sammensetning til bruk ifølge krav 5, der den benzoheterosykliske forbindelsen, androgenreseptorveimodulatoren og hormonforbindelsen blir administrert samtidig eller i rekkefølge eller separat.