



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3394065 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 487/04 (2006.01)
A61K 31/519 (2006.01)
A61P 35/02 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

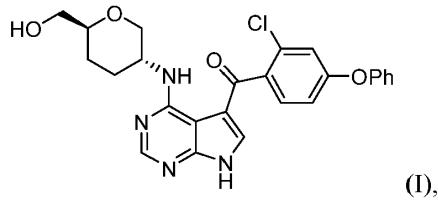
(45) Translation Published 2021.07.26
(80) Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent 2021.04.07
(86) European Application Nr. 15911490.9
(86) European Filing Date 2015.12.23
(87) The European Application's Publication Date 2018.10.31
(84) Designated Contracting States: AL ; 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 ArQule, Inc., One Wall Street, Burlington, MA 01803, USA
(72) Inventor LAPIERRE, Jean-Marc, 1 Alexandra Drive, PelhamNew Hampshire 03076, USA
EATHIRAJ, Sudharshan, 24 Ptarmigan Drive, ShrewsburyMassachusetts 01545, USA
NAMDEV, Nivedita, 18 Briarwood Drive, WestfordMassachusetts 01545, USA
SCHWARTZ, Brian, 18 October Hill Rd., WoodbridgeConnecticut 06525, USA
OTA, Yusuke, c/o DAIICHI SANKYO COMPANY LIMITED3-5-1 Nihonbashi HonchoChuo-ku, Tokyo 103-8426, Japan
MOMOSE, Takayuki, c/o DAIICHI SANKYO COMPANY LIMITED3-5-1 Nihonbashi HonchoChuo-ku, Tokyo 103-8426, Japan
TSUNEMI, Tomoyuki, c/o DAIICHI SANKYO COMPANY LIMITED3-5-1 Nihonbashi HonchoChuo-ku, Tokyo 103-8426, Japan
INAGAKI, Hiroaki, c/o DAIICHI SANKYO COMPANY LIMITED3-5-1 Nihonbashi HonchoChuo-ku, Tokyo 103-8426, Japan
NAKAYAMA, Kiyoshi, c/o DAIICHI SANKYO COMPANY LIMITED3-5-1 Nihonbashi HonchoChuo-ku, Tokyo 103-8426, Japan
(74) Agent or Attorney TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

(54) Title **TETRAHYDROPYRANYL AMINO-PYRROLOPYRIMIDINONE AND METHODS OF USE THEREOF**
(56) References Cited: WO-A1-2014/188173
WO-A1-2015/189620
US-B2- 8 940 893
US-B2- 8 673 928
US-B1- 8 377 946

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

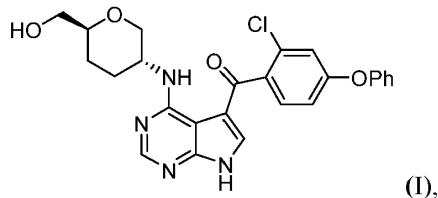
1. En forbindelse med formel (I):



5

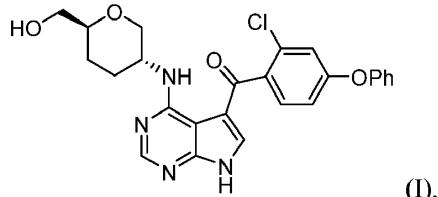
eller et farmasøytisk akseptabelt salt, tautomer, solvat eller polymorf derav.

2. Forbindelsen med formel (I):



10 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge krav 1.

3. Forbindelsen med formel (I):



ifølge krav 1.

15

4. En farmasøytisk sammensetning omfattende en forbindelse ifølge krav 1 eller et farmasøytisk akseptabelt salt, tautomer, solvat eller polymorf derav, og et farmasøytisk akseptabelt fortynningsmiddel, hjelpestoff eller bærer.

5. En forbindelse ifølge krav 1 eller et farmasøytisk akseptabelt salt, tautomer, solvat eller polymorf derav, eller en farmasøytisk sammensetning ifølge krav 4, for bruk i en fremgangsmåte for behandling av en BTK-mediert lidelse eller for modulering av BTK.

6. Forbindelsen eller sammensetningen for bruk ifølge krav 5, hvor den BTK-medierte lidelsen er valgt fra immunforstyrrelser, kreft, kardiovaskulære sykdommer, virusinfeksjoner, betennelse, metabolisme/endokrine funksjonsforstyrrelser og nevrologiske lidelser.

7. Forbindelsen eller sammensetningen for bruk ifølge krav 6, hvor kreften er valgt fra kreft i bryst, eggstokk, livmorhals, prostata, testis, urinvei, spiserør, strupehode, mage, hud, lunge, bein, kolon, pankreas, skjoldbruskkjertel, gallevei, hårete celler, bukhule, nasofaryngeal, svelg, leppe, tunge, munn, tynntarm, kolon-endetarm, tykktarm, endetarm, hjernen og sentralnervesystemet, bronkie, leveren, intrahepatisk galleveier, nyre og nyrebekken, urinblære, livmor-korpus, livmorhals eller munnhule, glioblastom, neuroblastom, keratoakantom, epidermoid karsinom, storcellekarsinom, ikke-småcellelungekarsinom (NSCLC), småcellekarsinom, lungeadenokarsinom, adenom, adenokarcinom, follikulært karsinom, udifferensiert karsinom, papillarkarsinom, seminom, melanom, sarkom, blærekarsinom, leverkarsinom, nyrekarsinom, myeloide lidelser, lymfom, Hodgkins leukemi, hepatocellulær kreft, glioma/glioblastom, endometriekreft, multippel myelom, akutt myelogen leukemi, kronisk myelogen leukemi, lymfocytisk leukemi, kronisk lymfoid leukemi (CLL), myeloid leukemi, ikke-Hodgkins lymfom og villous kolonadenom.

15

8. Forbindelsen eller sammensetningen for bruk ifølge krav 7, hvor kreften er Hodgkins leukemi.

20

9. Forbindelsen eller sammensetningen for bruk ifølge krav 7, hvor kreften er kronisk lymfoid leukemi (CLL).

10. Forbindelsen eller sammensetningen for bruk ifølge krav 7, hvor kreften er lymfom.

25

11. Forbindelsen eller sammensetningen for bruk ifølge krav 7, hvor kreften er ikke-Hodgkins lymfom.

12. Forbindelsen eller sammensetningen for bruk ifølge krav 7, hvor kreften er akutt myelogen leukemi.

30

13. Forbindelsen eller sammensetningen for bruk ifølge krav 7, hvor kreften er myelomatose.

14. Forbindelsen eller sammensetningen for bruk ifølge krav 7, hvor kreften er lymfocytisk leukemi.

35

15. Forbindelsen eller sammensetningen for bruk ifølge krav 7, hvor kreften er myeloid leukemi.

16. Forbindelsen eller sammensetningen for bruk ifølge krav 6, hvor den BTK-medierte lidelsen er revmatoid artritt, systemisk og lokal betennelse, leddgikt, betennelse relatert til immunundertrykkelse, avstøtning av organtransplantasjon, allergier, ulcerøs kolitt, Crohns sykdom, dermatitt, astma, systemisk lupus erytematose, Sjögrens syndrom, 5 multippel sklerose, sklerodermi/systemisk sklerose, idiopatisk trombocytopen purpura (ITP), anti-neutrofile cytoplasmatiske antistoffer (ANCA) vaskulitt, kronisk obstruktiv lungesykdom (COPD) eller psoriasis.

17. Forbindelsen eller sammensetningen for bruk ifølge krav 10, hvor lymfom er B-celle 10 lymfom.

18. Forbindelsen eller sammensetningen for bruk ifølge krav 10, hvor lymfom er anaplastisk storcellelymfom.

19. Forbindelsen eller sammensetningen for bruk ifølge krav 7, hvor lymfom er primært 15 sentralnervesystemlymfom.

20. Forbindelsen eller sammensetningen for bruk ifølge krav 10, hvor lymfom er Waldenströms-makroglobulinemi.

21. Forbindelsen eller sammensetningen for bruk ifølge krav 7, hvor kreften er myeloide 20 lidelser.

22. Forbindelsen eller sammensetningen for bruk ifølge krav 7, hvor kreften er sarkom.

23. Forbindelsen eller sammensetningen for bruk ifølge krav 7, hvor kreften er 25 hjernesvulst.