



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3524601 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 471/04 (2006.01)
A61K 31/519 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

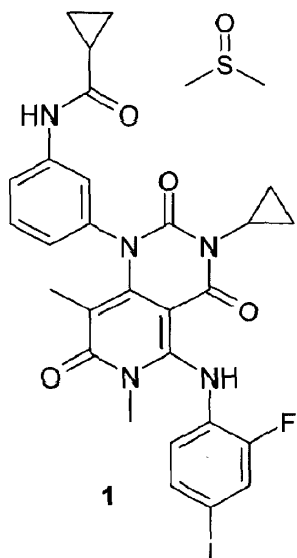
(45)	Translation Published	2022.01.17
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.10.13
(86)	European Application Nr.	16918763.0
(86)	European Filing Date	2016.12.12
(87)	The European Application's Publication Date	2019.08.14
(30)	Priority	2016.10.10, RU, 2016139641
(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
	Designated Validation States:	MA ; MD
(73)	Proprietor	R-Pharm Joint Stock Company (R-Pharm, JSC), Berzarina str. 19 bld. 1, Moscow 123154, Russland Repik, Alexey Evgenievich, 54 Kotoroslnaya nab., Apt. 9, Yaroslavl, 150000, Russland
(72)	Inventor	REPIK, Alexey Evgenievich, 54 Kotoroslnaya nab., Apt. 9., Yaroslavl, 150000, Russland IVACHTCHENKO, Alexandre Vasilievich, E. Hallandale Bch Blvd 1835 442, Hallandale Beach Florida 33009, USA IGNATIEV, Vasily Gennadievich, Skolkovskoye Shosse 13 Apt. 212, Moscow 121353, Russland CHAFEEV, Mikhail Airatovich, Gogolia Str. 9 Apt. 73, Moscow region Khimki 141401, Russland
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54)	Title	N-3-[3-CYCLOPROPYL-5-(2-FLUORO-4-IODOPHENYLAMINO)-6,8-DIMETHYL-2,4,7-TRIOXO-3,4,6,7-TETRAHYDRO-2H-PYRIDO[4,3-D]PYRIMIDIN-1-YL]-PHENYL-CYCLOPROPANECARBOXAMIDE DIMETHYL SULPHOXIDE SOLVATE AS AN MEK1/2 INHIBITOR
(56)	References Cited:	US-B2- 7 378 423 WO-A2-2014/066606 HYKOUK1 ABE ET AL.: 'Discovery of a Highly Potent and selective MbK Inhibitor: GSK1120212 (JTP-74057 DMSO Solvate' ACS MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS vol. 2, 2011, pages 3 20 - 324, XP055209291

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. N-{3-[3-cyklopropyl-5-(2-fluor-4-jodfenylamino)-6,8-dimetyl-2,4,7-triokso-3,4,6,7-tetrahydro-2H-pyrido[4,3-d]pyrimidin-1-yl]-fenyl}-syklopropankarboksamid-dimetylsulfoksid-solvat med formel 1:



2. Forbindelse ifølge krav 1 for anvendelse ved forebygging og/eller behandling av kreft relatert til MEK1, MEK2 og MEK1/2, nevnte kreft er valgt fra hjernesvulst, spiserørskreft, magekreft, leverkreft, bukspyttkjertelkreft, tykktarmskreft, lungekreft, nyrekreft, brystkreft, eggstokkreft, prostatakreft, hudkreft, nevroblastom, sarkom, osteokondrom, osteom, osteosarkom, seminom, ekstragonadale svulster, testikulær svulst, livmorkreft, hodekreft og nakkesvulst, myelomatose, ondartet lymfom, ekte polycytemi, leukemi, struma, bekkenkreft, urinveissvulst, blæretumor, kreft i galleblæren, kreft i gallekanalen, ondartet melanom og pediatriisk svulst, nevnte pediatriiske svulst er valgt fra Ewings sarkom, Wilms svulst, rabdomyosarkom, vaskulær sarkom, embryonal testikkelkreft, nevroblastom, retinoblastom, hepatoblastom og nefroblastom.

3. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 2, hvor kreften er malignt melanom.

4. Farmasøytisk sammensetning inneholdende terapeutisk effektiv
5 mengde av forbindelsen ifølge krav 1 som aktiv ingrediens, og
farmasøytisk akseptable hjelpestoffer for anvendelse i forebygging
og/eller behandling av kreft relatert til MEK1, MEK2 og MEK1/2, nevnte
kreft er valgt fra hjernesvulst, spiserørskreft, magekreft, leverkreft,
kreft i bukspyttkjertelen, tykktarmskreft, lungekreft, nyrekreft,
10 brystkreft, eggstokkreft, prostatakreft, hudkreft, neuroblastom, sarkom,
osteokondrom, osteom, osteosarkom, seminom, ekstragonadale
svulster, testikkelsvulst, livmorkreft, kreft i hodet og nakkesvulst,
myelomatose, ondartet lymfom, ekte polycytemi, leukemi, struma,
bekkenkreft, urinveissvulst, blæretumor, kreft i galleblæren,
15 gallegangskreft, ondartet melanom og pediatrik svulst, nevnte
pediatriske svulst er valgt fra Ewings sarkom, Wilms svulst,
rabdomyosarkom, vaskulær sarkom, embryonal testikkelkreft,
neuroblastom, retinoblastom, hepatoblastom og nefroblastom.

20 5. Farmasøytisk sammensetning for bruk ifølge krav 4, hvor kreften er
ondartet melanom.

6. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 4,
karakterisert ved at preparatet er i form av tabletter, kapsler eller
25 injeksjoner.

7. Legemiddel omfattende forbindelsen ifølge krav 1 for anvendelse ved
forebygging og/eller behandling av kreft relatert til MEK1, MEK2 og
MEK1/2, nevnte kreft er valgt fra hjernesvulst, spiserørskreft, magekreft,
30 leverkreft, kreft i bukspyttkjertelen, tykktarmskreft, lungekreft,
nyrekreft, brystkreft, eggstokkreft, prostatakreft, hudkreft,

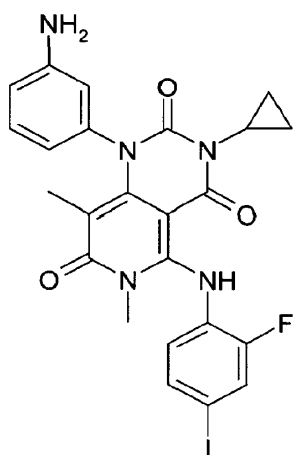
nevroblastom, sarkom, osteokondrom, osteom, osteosarkom, seminom, ekstragonadale svulster, testikulær svulst, livmorkreft, hodekreft og nakkesvulst, myelomatose, ondartet lymfom, ekte polycytemi, leukemi, struma, bekkenkreft, ureteral svulst, blæretumor, kreft i galleblæren, kreft i gallekanalen, ondartet melanom og pediatrik svulst, nevnte 5 pediatrike svulst er valgt fra Ewings sarkom, Wilms svulst, rabdomyosarkom, vaskulær sarkom, embryonal testikkelkreft, neuroblastom, retinoblastom, hepatoblastom og nefroblastom.

10 8. Legemiddel for bruk ifølge krav 7, hvor kreften er malignt melanom.

9. Fremgangsmåte for fremstilling av det farmasøytiske preparatet ifølge krav 4 ved å blande terapeutisk effektiv mengde av forbindelsen ifølge krav 1 med farmasøytisk akseptable hjelpestoffer.

15

10. Fremgangsmåte for fremstilling av forbindelsen ifølge krav 1, inkludert interaksjon av forbindelsen i henhold til formel 2 eller dets salt med cyklopropankarboksytsyre eller dets aktiverte derivat:



2

20