



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3575293 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 401/14 (2006.01)
A61K 31/4709 (2006.01)
A61P 9/00 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)
A61P 35/02 (2006.01)
A61P 37/00 (2006.01)
C07C 309/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.07.19
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.03.10
(86)	European Application Nr.	18744970.7
(86)	European Filing Date	2018.01.25
(87)	The European Application's Publication Date	2019.12.04
(30)	Priority	2017.01.26, JP, 2017011835
(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	ONO Pharmaceutical Co., Ltd., 1-5, Doshomachi 2-chome Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka 541-8526, Japan
(72)	Inventor	NEKADO, Takahiro, c/o ONO PHARMACEUTICAL CO. LTD.1-1 Sakurai 3- chomeShimamoto-cho, Mishima-gunOsaka 618-8585, Japan KIJIMA, Hideomi, c/o ONO PHARMACEUTICAL CO. LTD.1-1 Sakurai 3- chomeShimamoto-cho, Mishima-gunOsaka 618-8585, Japan ONO, Shizuka, c/o ONO PHARMACEUTICAL CO. LTD.1-1 Sakurai 3- chomeShimamoto-cho, Mishima-gunOsaka 618-8585, Japan NISHIYAMA, Toshihiko, c/o ONO PHARMACEUTICAL CO. LTD.1-1 Sakurai 3- chomeShimamoto-cho, Mishima-gunOsaka 618-8585, Japan
(74)	Agent or Attorney	TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

(54)	Title	ETHANESULFONATE SALT OF N-5-[(6,7-DIMETHOXY-4-QUINOLINYL)OXY]-2-PYRIDINYL- 2,5-DIOXO-1-PHENYL-1,2,5,6,7,8-HEXAHYDRO-3-QUINOLINECARBOXAMIDE
(56)	References Cited:	EP-A1- 3 026 045 WO-A1-2015/012298 JP-A- 2003 519 698 BERGE, S. M. et al.: "Pharmaceutical salts", Journal of Pharmaceutical Sciences, vol. 66, no. 1, 1977, pages 1-19, XP002675560,

Anonymous: "API form screening and selection in drug discovery stage", PHARM STAGE, vol. 6,

no. 10, 2007, pages 20-25, XP008145548, ISSN: 1346-3918

BYRN, S. et al.: "Pharmaceutical Solids: A Strategic Approach to Regulatory Considerations",
Pharmaceutical Research, vol. 12, no. 7, 1995, pages 945-954, XP055531015,

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-{5-[(6,7-dimetoksy-4-kinolinyloxy)-2-pyridinyloxy]-2,5-diokso-1-fenyl-1,2,5,6,7,8-heksahydro-3-kinolinkarboksamidetansulfonat.

2. En krystall av N-{5-[(6,7-dimetoksy-4-kinolinyloxy)-2-pyridinyloxy]-2,5-diokso-1-fenyl-1,2,5,6,7,8-heksahydro-3-kinolinkarboksamidetansulfonat.

3. Krystall ifølge krav 2, hvor krystallet i et pulverrøntgendiffraksjonsspektrum har peaks ved 2θ på $7,3 \pm 0,2^\circ$, $7,9 \pm 0,2^\circ$, $9,1 \pm 0,2^\circ$, $10,7 \pm 0,2^\circ$, $11,2 \pm 0,2^\circ$, $12,5 \pm 0,2^\circ$, $13,4 \pm 0,2^\circ$, $15,6 \pm 0,2^\circ$, $16,2 \pm 0,2^\circ$, $16,5 \pm 0,2^\circ$, $17,7 \pm 0,2^\circ$, $18,0 \pm 0,2^\circ$, $18,4 \pm 0,2^\circ$, $19,1 \pm 0,2^\circ$, $20,1 \pm 0,2^\circ$, $20,8 \pm 0,2^\circ$, $21,2 \pm 0,2^\circ$, $21,5 \pm 0,2^\circ$, $22,4 \pm 0,2^\circ$, $23,0 \pm 0,2^\circ$, $23,6 \pm 0,2^\circ$ og $24,0 \pm 0,2^\circ$, målt under de følgende forholdene:

mål: Cu,

filter: ikke brukt,

spenning: 40 kV, og

elektrisk strøm: 40 mA.

4. Krystall ifølge krav 2 til 3, hvor krystallet i differensielle scanningskalorimetri har en endoterm peak av en onset-temperatur på $283^\circ\text{C} \pm 2^\circ\text{C}$ eller en peak-temperatur på $286^\circ\text{C} \pm 2^\circ\text{C}$, målt under de følgende forholdene:

prøvemengde: 1 til 2 mg,

prøvecelle: aluminiumskall 40 μL ,

strømningsmengde nitrogengass: 40 ml/min, og

temperaturstigningshastighet: $10^\circ\text{C}/\text{min}$ (25 til 240°C).

5. En farmasøytisk sammensetning omfattende N-{5-[(6,7-dimetoksy-4-kinolinyloxy)-2-pyridinyloxy]-2,5-diokso-1-fenyl-1,2,5,6,7,8-heksahydro-3-kinolinkarboksamidetansulfonat eller krystallet ifølge et hvilket som helst av kravene 2 til 4, og en farmasøytisk akseptabel bærer.

6. N-{5-[(6,7-dimetoksy-4-kinolinyloxy)-2-pyridinyloxy]-2,5-diokso-1-fenyl-1,2,5,6,7,8-heksahydro-3-kinolinkarboksamidetansulfonat eller krystallet derav ifølge et hvilket som helst av kravene 2 til 4 for bruk i forebygging og/eller behandling av en Axl-relatert sykdom, hvor den Axl-relaterte sykdommen er kreft, en immunsystemsykdom eller en sirkulasjonssystems sykdom.

7. Forbindelse for bruk ifølge krav 6, hvor kreften er leukemi, malignt lymfom, multippelt myelom, myelodysplastiske syndromer, melanom, uvealt malignt melanom, hode- og nakkekraft, esofageal kraft, esofageal adenocarcinom, magekraft, tykktarmskraft, kolonkraft, endetarmskraft, leverkraft, galleblære- og gallegangskraft, kraft i galleveiene, 5 kraft i bukspyttkjertelen, skjoldbruskkjertelkraft, lungekraft, brystkraft, eggstokkraft, livmorhalskraft, livmorkraft, endometrisk kraft, vaginal kraft, vulvakraft, nyrecelle karsinom, urotelial karsinom, prostatakraft, testikulær kraft, sarkom i bein og bløtvev, hudkraft, gliom, hjernesvulster, plevramesoteliom eller kraft av ukjent sak.