



NORWAY

(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3660004 B1

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 401/14 (2006.01)
A61K 31/4035 (2006.01)
A61K 31/44 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)
C07D 233/86 (2006.01)
C07D 401/04 (2006.01)
C07D 403/14 (2006.01)
C07D 471/10 (2006.01)
C07D 491/107 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

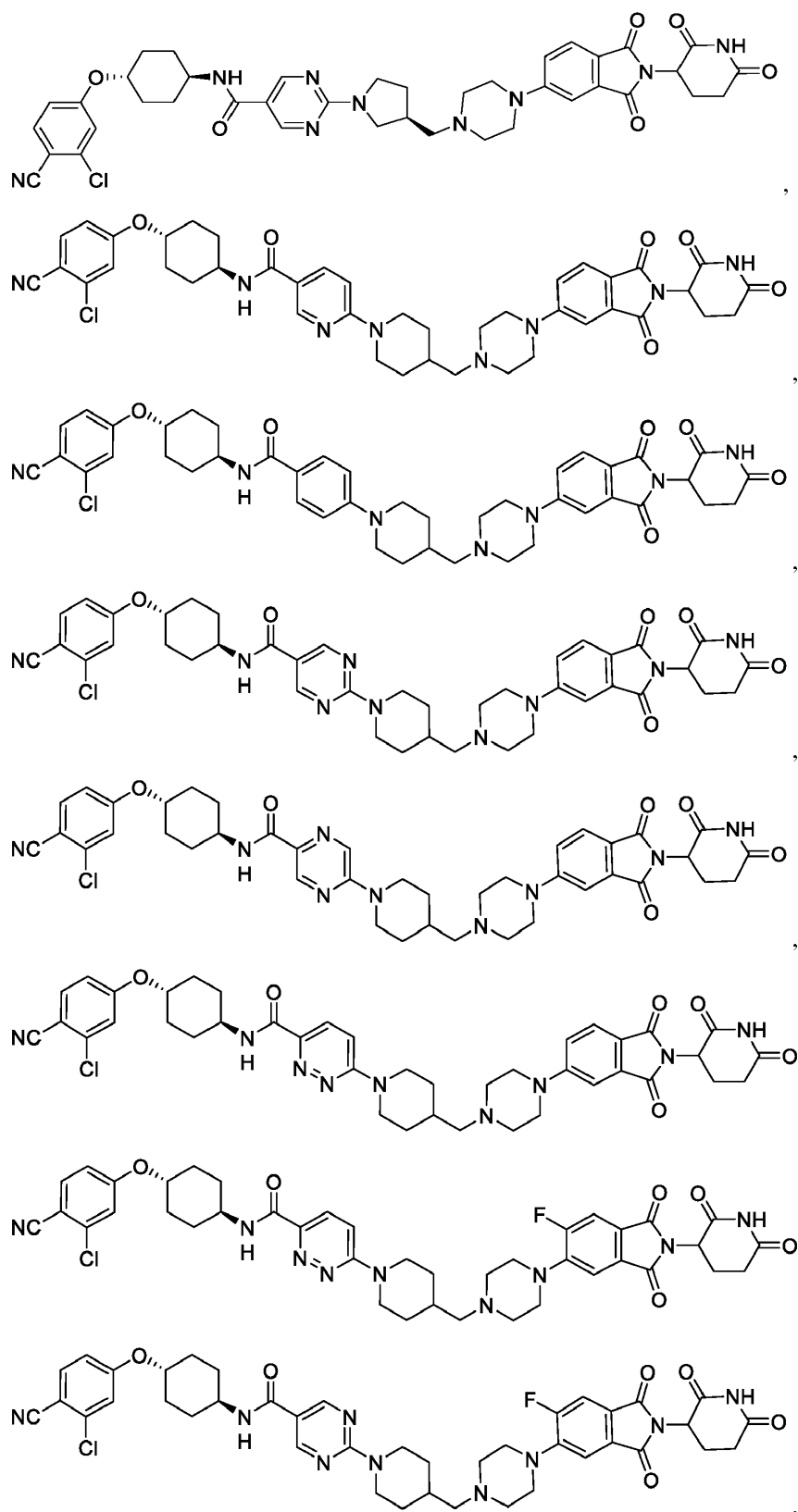
(45)	Translation Published	2023.05.22
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.02.22
(86)	European Application Nr.	20150564.1
(86)	European Filing Date	2017.10.11
(87)	The European Application's Publication Date	2020.06.03
(30)	Priority	2016.10.11, US, 201662406888 P 2017.07.03, US, 201762528385 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
(73)	Proprietor	Arvinas Operations, Inc., 5 Science Park, New Haven, CT 06511, USA
(72)	Inventor	CREW, Andrew P., 2 Winterberry Road, Guilford, CT 06437, USA HORNBERGER, Keith R., 182 Wolf Pit Drive, Southburg, CT 06488, USA SNYDER, Lawrence B., 85 Laurel Ridge Trail, Killingworth, CT 06419, USA ZIMMERMANN, Kurt, 5 Skeetfield Point Road, Durham, CT 06422, USA WANG, Jing, 25 Elm Street, Milford, CT 06460, USA BERLIN, Michael, 14 Hendrick Road, Flemington, NJ 08822, USA CREWS, Craig M., 286 Livingston Street, New Haven, CT 06511, USA DONG, Hanqing, 248 Opening Hill Rd., Madison, CT 06443, USA
(74)	Agent or Attorney	RWS, Europa House, Chiltern Park, Chiltern Hill, SL99FG CHALFONT ST PETER, Storbritannia

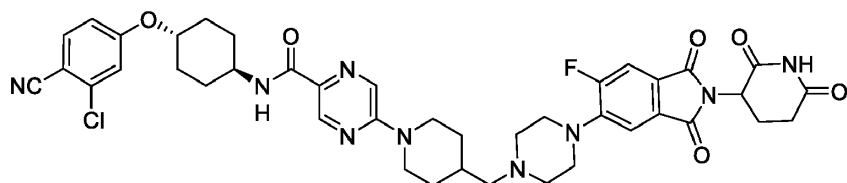
(54)	Title	COMPOUNDS AND METHODS FOR THE TARGETED DEGRADATION OF ANDROGEN RECEPTOR
(56)	References Cited:	WO-A1-2016/197032 US-A1- 2016 058 872 WO-A2-2015/160845

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

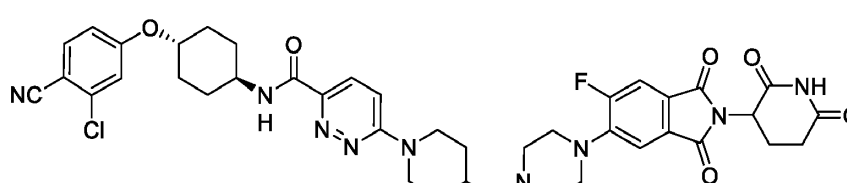
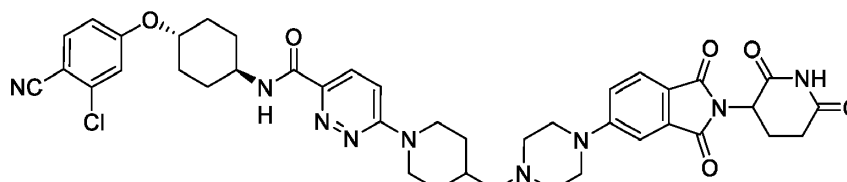
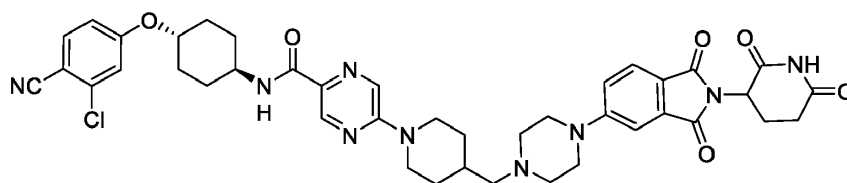
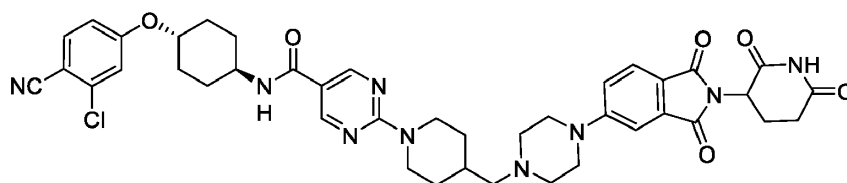
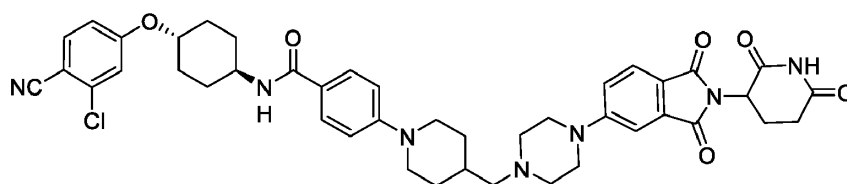
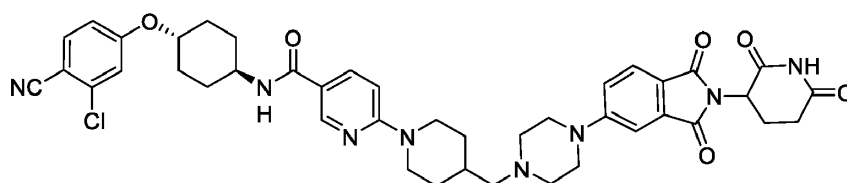
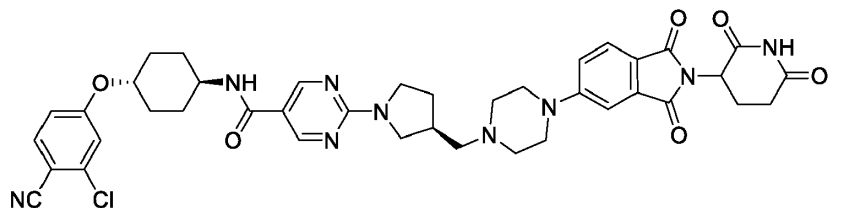
1. Forbindelse som har strukturen:

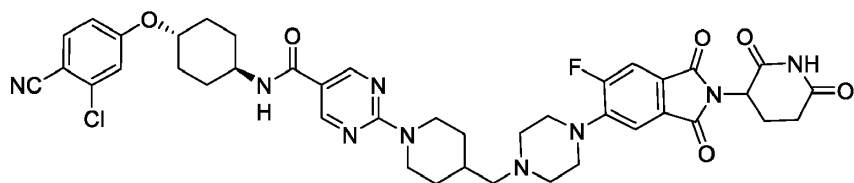




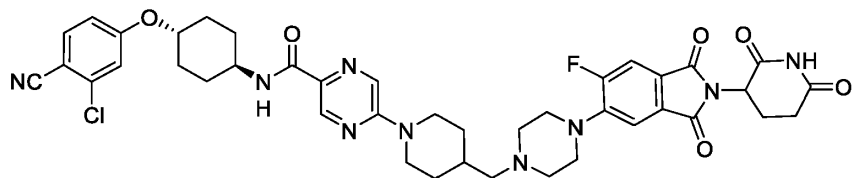
eller et farmasøytisk akseptabelt salt, enantiomer, stereoisomer eller isotopisk derivat ifølge et hvilket som helst av det foregående.

- 5 2. Forbindelsen ifølge krav 1, som har strukturen:

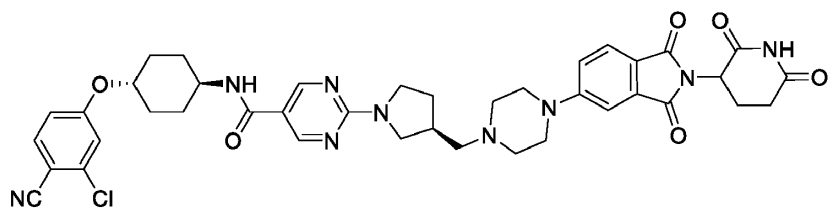




eller

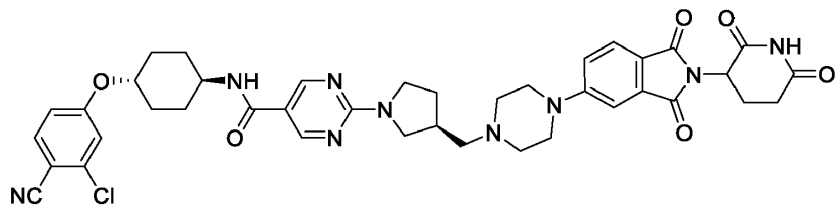


- 5 3. Forbindelsen ifølge krav 1, som har strukturen:

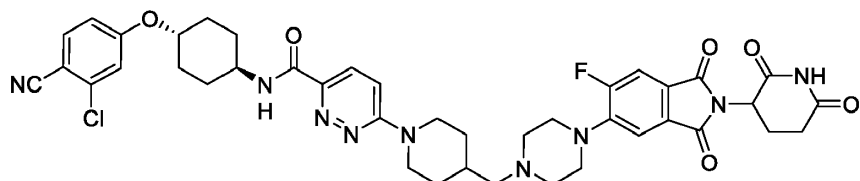


eller et farmasøytisk akseptabelt salt, enantiomer, stereoisomer eller isotopisk derivat derav.

- 10 4. Forbindelsen ifølge krav 1, som har strukturen:

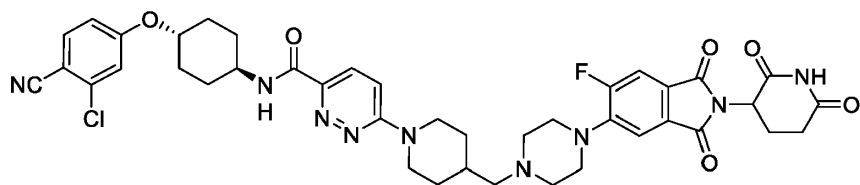


5. Forbindelsen ifølge krav 1, som har strukturen:



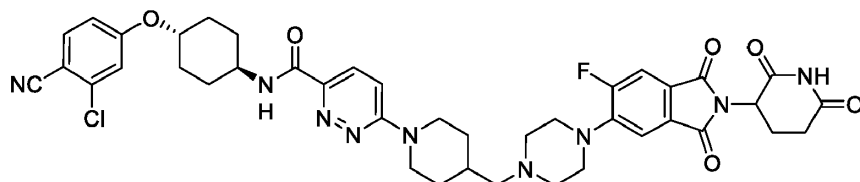
- 15 eller et farmasøytisk akseptabelt salt, enantiomer, stereoisomer eller isotopisk derivat derav.

6. Forbindelsen ifølge krav 1, som har strukturen:



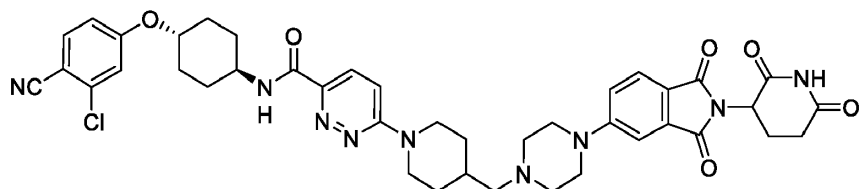
eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

7. Forbindelsen ifølge krav 1, som har strukturen:



5

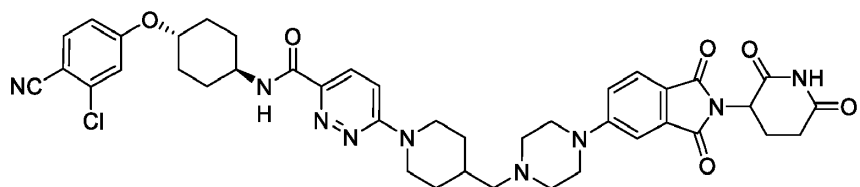
8. Forbindelsen ifølge krav 1, som har strukturen:



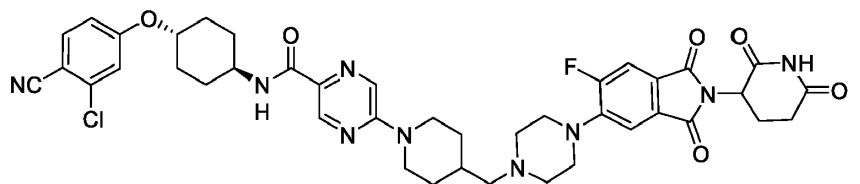
eller et farmasøytisk akseptabelt salt, enantiomer, stereoisomer eller isotopisk derivat derav.

10

9. Forbindelsen ifølge krav 1, som har strukturen:

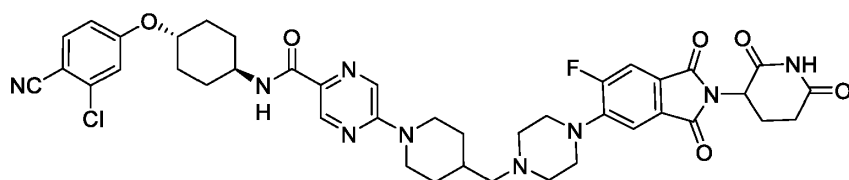


15 10. Forbindelsen ifølge krav 1, som har strukturen:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt, enantiomer, stereoisomer eller isotopisk derivat derav.

20 11. Forbindelsen ifølge krav 1, som har strukturen:



12. Farmasøytisk sammensetning omfattende en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–11, og en farmasøytisk akseptabel bærer.

5

13. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 12, videre omfattende en effektiv mengde av et ytterligere middel mot kreft.

14. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 13, hvori det ytterligere midlet mot kreft er en FLT-3-inhibitor, androgenreseptorinhibitor, VEGFR-inhibitor, EGFR TK-inhibitor, aurorakinaseinhibitor, PIK-1-modulator, Bcl-2-inhibitor, HDAC-inhibitor, c-MET-inhibitor, PARP-inhibitor, CDK-inhibitor, anti-HGF-antistoff, IGFR TK-inhibitor, PI3-kinaseinhibitor, AKT-inhibitor, JAK/STAT-inhibitor, sjekkpunkt-1-inhibitor, sjekkpunkt-2-inhibitor, fokal adhesjonskinaseinhibitor, MAP-kinasekinaseinhibitor eller VEGF-felleantistoff.

10

15

15. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 13, hvori det ytterligere midlet mot kreft er estramustin, docetaxsel, ketokonazol, goserelinacetat, histrelin, buserelin, cyproteron, flutamid, bicalutamid, nilutamid, pamidronat, zolendronat, mitoksantron, pemetreksed, ipilimumab, vorinostat, etoposid, gemcitabin, doksorubicin, vinkristin, temozolomid, capecitabin, PEG-merket irinotekan, tamoksifen, anastrozol, eksemestan, letrozol, diethylstilbestrol, østradiol, østrogen, bevacizumab, leuprolidacetat, triptorelinpamoat, medroksyprogesteronacetat, hydroksyprogesteronkaproat, raloksifen, megesterolacetat, karboplatin, cisplatin, dakarbazin, metotreksat, vinblastin, vinorelbin, topotekan, finasterid, arzoksifen, fulvestrant eller prednison.

20

25

16. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 15, hvori:

- (a) det ytterligere midlet mot kreft er estramustin, docetaxsel, ketokonazol, goserelinacetat, histrelin, triptorelinpamoat, buserelin, cyproteron, flutamid, bicalutamid, nilutamid, pamidronat eller zolendronat; eller
- (b) det ytterligere midlet mot kreft er docetaxsel, mitoksantron, estramustin eller leuprolidacetat.
- 30

17. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1–11 eller den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 12 for anvendelse i behandlingen av prostatakreft hos et individ.

5 18. Forbindelsen ifølge krav 6 for anvendelse i behandlingen av prostatakreft hos et individ.

19. Forbindelsen ifølge krav 7 for anvendelse i behandlingen av prostatakreft hos et individ.

10

20. Forbindelsen eller den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 17, hvori behandlingen videre omfatter anvendelsen av en effektiv mengde av et ytterligere middel mot kreft.

15 21. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 18, hvori behandlingen videre omfatter anvendelsen av en effektiv mengde av et ytterligere middel mot kreft.

22. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 19, hvori behandlingen videre omfatter anvendelsen av en effektiv mengde av et ytterligere middel mot kreft.

20

23. Forbindelsen eller den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 20–22, hvori det ytterligere midlet mot kreft er en FLT-3-inhibitor, androgenreseptorinhibitor, VEGFR-inhibitor, EGFR TK-inhibitor, aurorakinaseinhibitor, PIK-1-modulator, Bcl-2-inhibitor, HDAC-inhibitor, c-MET-inhibitor, PARP-inhibitor, CDK-inhibitor, anti-HGF-antistoff, IGFR TK-inhibitor, PI3-kinaseinhibitor, AKT-inhibitor, JAK/STAT-inhibitor, sjekkpunkt-1-inhibitor, sjekkpunkt-2-inhibitor, fokal adhesjonskinaseinhibitor, MAP-kinasekinaseinhibitor eller VEGF-felleantistoff.

25

24. Forbindelsen eller den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 20–22, hvori det ytterligere midlet mot kreft er estramustin, docetaksel, ketokonazol, goserelinacetat, histrelin, buserelin, cyproteron, flutamid, bicalutamid, nilutamid, pamidronat, zolendronat, mitoksantron, pemetreksed, ipilimumab, vorinostat, etoposid, gemcitabin, doksorubicin, vinkristin, temozolomid, kapecitabin, PEG-merket irinotekan, tamoksifen, anastrozol, eksemestan, letrozol, dietylstilbestrol, østradiol, østrogen, bevacizumab, leuprolideacetat, triptorelinpamoat, medroksyprogesteronacetat, hydroksyprogesteronkaproat, raloksifen, megestrolacetat, karboplatin, cisplatin, dakarbazin, metotreksat, vinblastin, vinorelbin, topotekan, finasterid, arzoksifen, fulvestrant eller prednison.

30

35

25. Forbindelsen eller den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 24, hvori:
- (a) det ytterligere midlet mot kreft er estramustin, docetaxsel, ketokonazol, goserelinacetat, histrelin, triptorelinpamoat, buserelin, cyproteron, flutamid, bicalutamid, nilutamid, pamidronat eller zolendronat; eller
- (b) det ytterligere midlet mot kreft er docetaxsel, mitoksantron, estramustin eller leuprolidacetat.
26. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 13–16 for anvendelse i behandlingen av prostatakreft hos et individ.