



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3662910 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/519 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)
C07D 471/14 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2024.12.23
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2024.09.18
(86)	European Application Nr.	19218049.5
(86)	European Filing Date	2015.03.30
(87)	The European Application's Publication Date	2020.06.10
(30)	Priority	2014.03.31, US, 201461972689 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
(62)	Divided application	EP3125898, 2015.03.30
(73)	Proprietor	The Scripps Research Institute, 10550 North Torrey Pines Road, La Jolla, CA 92037, USA
(72)	Inventor	JANDA, Kim D, 5787 La Jolla Corona Dr., La Jolla, CA 92037, USA JACOB, Nicholas T., 10720 Ocean Heights Way, San Diego, CA 92121, USA LOCKNER, Jonathan W., 10750 Sabre Hill Drive 147, San Diego, CA 92128, USA
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54) Title **PHARMACOPHORE FOR TRAIL INDUCTION**

(56) References

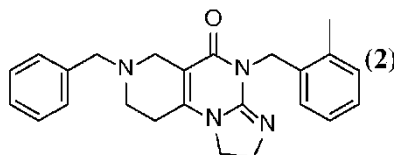
Cited:

WO-A2-2004/039774
US-A1- 2014 335 048
US-A1- 2009 306 161
J. E. ALLEN ET AL: "Dual Inactivation of Akt and ERK by TIC10 Signals Foxo3a Nuclear Translocation, TRAIL Gene Induction, and Potent Antitumor Effects", SCIENCE TRANSLATIONAL MEDICINE, vol. 5, no. 171, 6 February 2013 (2013-02-06), pages 171ra17 - 171ra17, XP055300328, ISSN: 1946-6234, DOI: 10.1126/scitranslmed.3004828
NICHOLAS T. JACOB ET AL: "Pharmacophore Reassignment for Induction of the Immunosurveillance Cytokine TRAIL", ANGEWANDTE CHEMIE INTERNATIONAL EDITION, vol. 53, no. 26, 23 June 2014 (2014-06-23), pages 6628 - 6631, XP055259380, ISSN: 1433-7851, DOI: 10.1002/anie.201402133

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 omfattende forbindelse **2**, 7-benzyl-4-(2-metylbenzyl)-1,2,6,7,8,9-heksahydroimidazo[1,2-a]pyrido[3,4-e]pyrimidin-5(4H)-on:



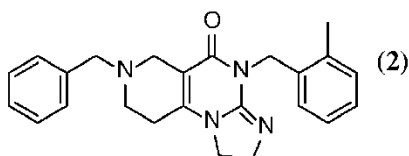
eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

2. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1 for bruk ved behandling av en kreft.

3. Farmasøytisk sammensetning for bruk ifølge krav 2, hvor kreften er valgt fra gruppen bestående av eggstokk-, kolon-, bryst-, lever-, bukspyttkjertel-, mage-tarm-, hode- og hals-, livmorhals-, prostata- og lungekreft, melanomer, glioblastomer, myelomer, nevroblastiske CNS-tumorer, monocytære leukemier, leukemier med opphav i B-celler, leukemier med opphav i T-celler, lymfomer med opphav i B-celler, lymfomer med opphav i T-celler, tumorer med opphav i mastceller og kombinasjoner derav.

4. Farmasøytisk sammensetning for bruk ifølge krav 2, hvor forbindelsen **2** induserer ekspresjon av TNF-relatert apoptoseinduserende ligand (TRAIL).

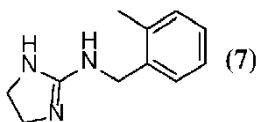
5. Fremgangsmåte for fremstilling av forbindelse **2**:



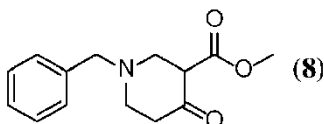
omfattende å bringe forbindelse **7**

EP3662910

2



i kontakt med forbindelse **8**, som dets hydrokloridsalt,



5

med tilbakestrømming av metanol og natriummetoksid for å frembringe forbindelse **2**.

10 **6.** Fremgangsmåte ifølge krav 5, hvor molforholdet av forbindelse **7** til forbindelse **8** er 2,1:1.

7. Fremgangsmåte ifølge krav 5, hvor tilbakestrømmingen utføres i 18 timer.

15 **8.** Fremgangsmåte ifølge krav 5, hvor molforholdet av natriummetoksid til forbindelse **8** er 0,75:1.