



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3757112 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

C07H 19/10 (2006.01)

A61K 9/00 (2006.01)

A61K 9/08 (2006.01)

A61K 31/7068 (2006.01)

A61K 47/16 (2006.01)

A61K 47/20 (2006.01)

A61K 47/22 (2006.01)

A61P 35/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2023.08.07
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.06.07
(86)	European Application Nr.	20187951.7
(86)	European Filing Date	2015.06.25
(87)	The European Application's Publication Date	2020.12.30
(30)	Priority	2014.06.25, GB, 201411253 2014.06.25, IN, 2050MU2014
(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
(62)	Divided application	EP3160978, 2015.06.25
(73)	Proprietor	Nucana PLC, 3 Lochside Way, Edinburgh EH12 9DT, Storbritannia
(72)	Inventor	GRIFFITH, Hugh, NuCana plc 3 Lochside Way, Edinburgh, Scotland EH12 9DT, Storbritannia MCGUIGAN, Christopher, -, deceased, Storbritannia SLUSARCZYK, Magdalena, School of Pharmacy and Pharmaceutical Sciences, Cardiff University Redwood Building King Edward VII Avenue, Cardiff, South Glamorgan CF10 3NB, Storbritannia SERPI, Michaela, School of Pharmacy and Pharmaceutical Sciences, Cardiff University Redwood Building King Edward VII Avenue, Cardiff, South Glamorgan CF10 3NB, Storbritannia FERRARI, Valentina, 83 West Cliff Road, Ramsgate, Kent CT11 9NS, Storbritannia
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54) Title **GEMCITABINE PRODRUGS**

(56) References

Cited:

WO-A1-2014/076490

WO-A2-2005/012327

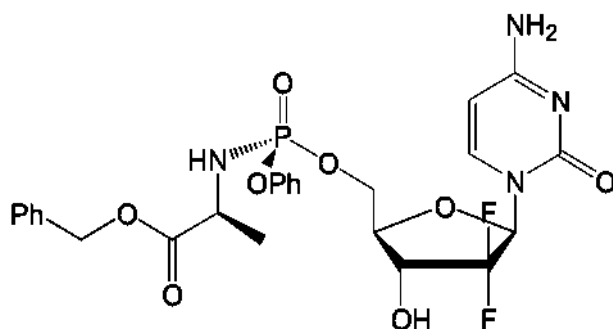
WO-A2-2015/081133

MAGDALENA SLUSARCZYK ET AL: "Application of ProTide Technology to Gemcitabine: A Successful Approach to Overcome the Key Cancer Resistance Mechanisms Leads to a New Agent (NUC-1031) in Clinical Development", JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, vol. 57, no. 4, 27 February 2014 (2014-02-27), pages 1531-1542, XP055205033, ISSN: 0022-2623, DOI: 10.1021/jm401853a

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

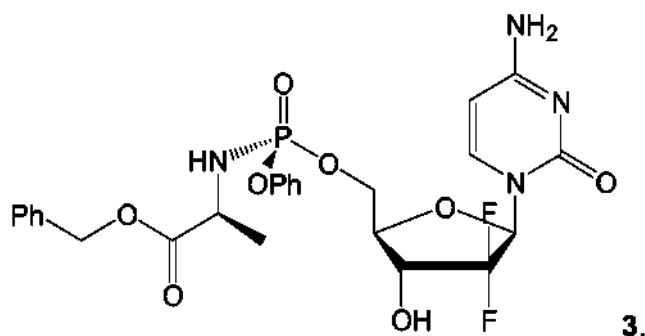
1. Gemcitabin-[fenyl-(benzoksy-L-alaninyl)]-(*S*)-fosfat **3**:



3, eller et farmasøytisk akseptabelt

- salt derav, som har en diastereoisomerisk renhet større enn 90 %, for anvendelse i behandling av en kreft valgt fra kreft i bukspyttkjertelen, eggstokkreft, lungekreft, blærekreft, kolangiokarsinom, nyrekreft, livmorhalskreft og kreft i thymus.

2. Gemcitabin-[fenyl-(benzoksy-L-alaninyl)]-(*S*)-fosfat **3**:



3,

- 10 som har en diastereoisomerisk renhet større enn 90 %, for anvendelse i behandling av en kreft valgt fra kreft i bukspyttkjertelen, eggstokkreft, lungekreft, blærekreft, kolangiokarsinom, nyrekreft, livmorhalskreft og kreft i thymus.

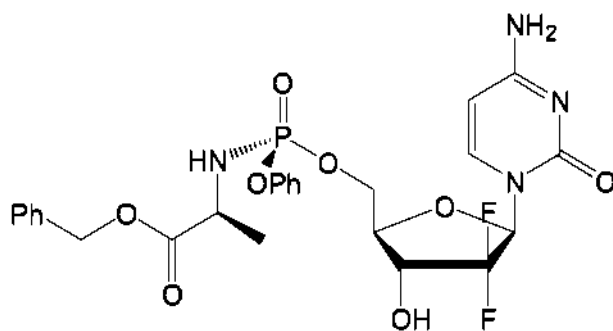
3. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 2, hvori kreften er kreft i bukspyttkjertelen.

4. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 2, hvori kreften er eggstokkreft.

5. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 2, hvori kreften er kolangiokarsinom.

20

6. Farmasøytisk formulering omfattende gemcitabin-[fenyl-(benzoksy-L-alaninyl)]-(*S*)-fosfat **3**:



3, eller et farmasøytisk akseptabelt

salt eller solvat derav, som har en diastereoisomerisk renhet på mer enn 90 %, og minst ett farmasøytisk akseptabelt hjelpestoff, for anvendelse i behandling av en kreft valgt fra kreft i bukspyttkjertelen, eggstokkreft, lungekreft, blærekreft, kolangiokarsinom, nyrekreft, livmorhalskreft og kreft i thymus.

7. Formuleringen for anvendelse ifølge krav 6, hvori kreften er kreft i bukspyttkjertelen.
8. Formuleringen for anvendelse ifølge krav 6, hvori kreften er eggstokkreft.
- 10 9. Formuleringen for anvendelse ifølge krav 6, hvori kreften er kolangiokarsinom.
10. Formuleringen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 6 til 9, hvori formuleringen omfatter syklodekstrin.
- 15 11. Formuleringen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 6 til 10, hvori formuleringen er for oral administrering.
- 20 12. Formuleringen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 6 til 10, hvori formuleringen er for intravenøs administrering.
13. Formuleringen for anvendelse ifølge krav 12, hvori formuleringen omfatter et polart organisk løsningsmiddel.
- 25 14. Forbindelsen eller formuleringen for anvendelse ifølge et hvilket som helst foregående krav, hvori den diastereoisomere renheten til gemcitabin-[fenyl-benzoksy-L-alaninyl)]-(S)-fosfat **3** er større enn 98 %.

15. Forbindelsen eller formuleringen for anvendelse ifølge krav 14, hvori den diastereoisomere renheten til gemcitabin-[fenyl-benzoksy-L-alaninyl]-(*S*)-fosfat **3** er større enn 99,5 %.