



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3882250 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 487/04 (2006.01)
A61K 31/519 (2006.01)
A61P 29/00 (2006.01)
A61P 31/12 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)
C07D 405/12 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2023.06.12
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.02.15
(86)	European Application Nr.	21165852.1
(86)	European Filing Date	2015.12.23
(87)	The European Application's Publication Date	2021.09.22
(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
(62)	Divided application	EP3394065, 2015.12.23
(73)	Proprietor	ArQule, Inc., One Wall Street, Burlington, MA 01803, USA
(72)	Inventor	LAPIERRE, Jean-Marc, Pelham 03076, USA EATHIRAJ, Sudharshan, Shrewsbury 01545, USA NAMDEV, Nivedita, Westford 01545, USA SCHWARTZ, Brian, Woodbridge 06525, USA OTA, Yusuke, Chuo-ku 103-8426, Japan MOMOSE, Takayuki, Chuo-ku 103-8426, Japan TSUNEMI, Tomoyuki, Chuo-ku 103-8426, Japan INAGAKI, Hiroaki, Chuo-ku 103-8426, Japan NAKAYAMA, Kiyoshi, Chuo-ku 103-8426, Japan
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54)	Title	TETRAHYDROPYRANYL AMINO-PYRROLOPYRIMIDINONE FOR USE IN TREATING BTK-MEDIATED DISORDERS
------	-------	---

(56)	References	
	Cited:	WO-A1-2014/188173, WO-A1-2015/189620 US-B1- 8 377 946, US-A1- 2014 275 014 US-A1- 2014 275 023, US-A1- 2011 152 258

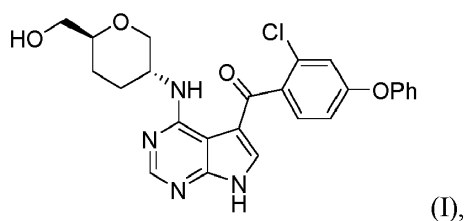
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters 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/>

EP 3 882 250

1

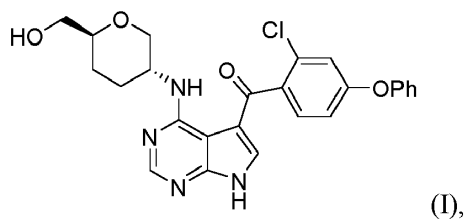
Patentkrav

- 1.** En forbindelse med formel (I):



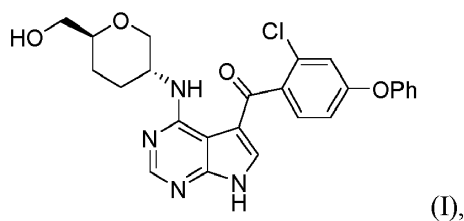
eller et farmasøytisk akseptabelt salt, tautomer, solvat, eller polymorf derav, for anvendelse i en fremgangsmåte for å behandle en BTK-mediert forstyrrelse eller for å modulere BTK, hvor BTK er mutant BTK, fortrinnsvis BTK-C481S-mutant.

- 2.** Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 1, hvor forbindelsen har formel (I):



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

- 3.** Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 1, hvor forbindelsen har formel (I):



- 4.** Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 1, hvor forbindelsen er til stede som en farmasøytisk sammensetning som omfatter forbindelsen eller et farmasøytisk

akseptabelt salt, tautomer, solvat, eller polymorf derav, og et farmasøytisk akseptabelt fortynningsmiddel, eksipiens eller bærer.

5 **5.** Forbindelsen for anvendelse i henhold til krav 1, hvor den BTK-medierte forstyrrelsen er valgt fra immunforstyrrelser, kreft, kardiovaskulær sykdom, virusinfeksjoner, inflammasjoner, metabolisme/endokrinfunksjonsforstyrrelser og nevrologiske forstyrrelser.

10 **6.** Forbindelsen for anvendelse i henhold til krav 5, hvor kreften er valgt fra en kreft i brystet, eggstokk, livmorhals, prostata, testis, urogenital kanalen, spiserør, strupehodet, mage, hud, lunge, bein, kolon, bukspyttkjertel, skjoldbruskkjertelen, galleveien, hårceller, kinnhulen, naso-farynks, svelget, leppen, tungen, munnen, tynntarmen, kolon-rektum, tykktarmen, rektum, hjernen og sentralnervesystemet, bronkus, lever, intrahepatisk gallegang, nyre og nyrebekken, urinblære, 15 livmor kroppen, livmorhalsen, eller munnhulen, glioblastom, neuroblastom, keratoakantom, epidermoid karsinom, storcellet karsinom, ikke-småcellet lungekarsinom (NSCLC), småcellet karsinom, lungeadenokarsinom, adenom, adenokarsinom, follikulært karsinom, uddifferensiert karsinom, papillært karsinom, seminom, melanom, sarkom, blærekarsinom, leverkarsinom, nyrekarsinom, 20 myeloide forstyrrelser, lymfom, Hodgkins leukemi, hepatocellulær kreft, gliom/-glioblastom, endometrie kreft, multippelt myelom, akutt myelogen leukemi, kronisk myelogen leukemi, lymfatisk leukemi, kronisk lymfoid leukemi (CLL), myeloid leukemi, non-Hodgkin lymfom, og villøst kolon adenom.

25 **7.** Forbindelsen for anvendelse i henhold til krav 6, hvor kreften er kronisk lymfoid leukemi (CLL).

8. Forbindelsen for anvendelse i henhold til krav 6, hvor kreften er lymfom.

30 **9.** Forbindelsen for anvendelse i henhold til krav 8, hvor lymfomet er non-Hodgkin lymfom.

EP 3 882 250

3

10. Forbindelsen for anvendelse i henhold til krav 8, hvor lymfomet er B-celle lymfom.

5 **11.** Forbindelsen for anvendelse i henhold til krav 8, hvor lymfomet er anaplastisk storcellet lymfom, primært sentralnervesystem lymfom eller Waldenstroms makroglobulinemi.

10 **12.** Forbindelsen for anvendelse i henhold til krav 6, hvor kreften er myeloid forstyrrelser eller myeloid leukemi.

15 **13.** Forbindelsen for anvendelse i henhold til krav 6, hvor kreften er akutt myelogen leukemi.

20 **14.** Forbindelsen for anvendelse i henhold til krav 6, hvor kreften er multippelt myelom.

25 **15.** Forbindelsen for anvendelse i henhold til krav 6, hvor kreften er lymfatisk leukemi.

30 **16.** Forbindelsen for anvendelse i henhold til krav 6, hvor kreften er sarkom eller hjernesvulst.

35 **17.** Forbindelsen for anvendelse i henhold til krav 5, hvor den BTK-medierte forstyrrelsen er revmatoid artritt, systemisk og lokal inflammasjon, artritt, inflammasjon relatert til immunsuppresjon, organtransplantasjonsavstøtning, allergier, ulcerøs kolitt, Crohns sykdom, dermatitt, astma, systemisk lupus erythematosus, Sjögrens syndrom, multippel sklerose, sklerodermi/systemisk sklerose, idiopatisk trombocytopenisk purpura (ITP), anti-nøytrofile cytoplasmiske antistoffer (ANCA) vaskulitt, kronisk obstruktiv lunge sykdom (KOLS), eller psoriasis.