



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3953357 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 487/04 (2006.01)
A61K 31/53 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)

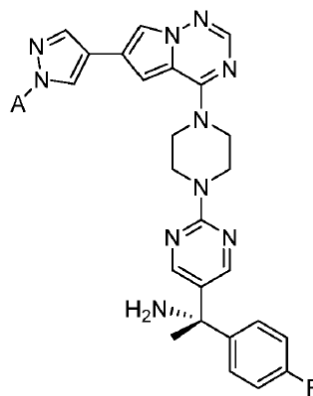
Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2024.08.12
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2024.04.17
(86)	European Application Nr.	20721083.2
(86)	European Filing Date	2020.04.08
(87)	The European Application's Publication Date	2022.02.16
(30)	Priority	2019.04.12, US, 201962833529 P 2019.10.04, US, 201962911016 P 2019.11.04, US, 201962930240 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
	Designated Extension States:	BA; ME
	Designated Validation States:	KH; MA; MD; TN
(73)	Proprietor	Blueprint Medicines Corporation, 45 Sidney Street, Cambridge, MA 02139, USA
(72)	Inventor	KIM, Joseph, L., 45 Sidney Street, Cambridge, MA 02139, USA DINEEN, Thomas, A., 45 Sidney Street, Cambridge, MA 02139, USA GUZI, Timothy, 45 Sidney Street, Cambridge, MA 02139, USA
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54)	Title	PYRROLOTRIAZINE DERIVATIVES FOR TREATING KIT- AND PDGFRA-MEDIATED DISEASES
(56)	References Cited:	WO-A1-2018/183712 WO-A1-2015/057873

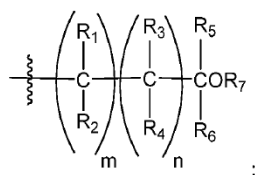
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters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

1. Forbindelse av formel I:



(I), farmasøytisk akseptabelt salt derav, og/eller et solvat av et hvilket som helst av det foregående, hvori:

5 A er



R₁ velges fra hydrogen og metyl;

R₂ velges fra hydrogen og metyl, eller

R₁ og R₂ tatt sammen danner et syklopropyl;

10 R₃ velges fra hydrogen og metyl;

R₄ velges fra hydrogen og metyl eller

R₃ og R₄ tatt sammen danner et syklopropyl;

R₅ velges fra hydrogen og metyl;

R₆ velges fra hydrogen og metyl, eller

15 R₅ og R₆ tatt sammen danner et syklopropyl, eller

én av R₂ eller R₄ tatt sammen med R₆ danner et syklobutyl;

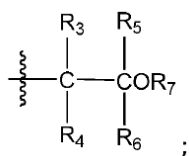
R₇ er hydrogen, eller én av R₂, R₄ eller R₆ tatt sammen med R₇ danner en ring valgt fra oksetan, tetrahydrofuran og tetrahydropyran, hvori tetrahydrofuranet eller tetrahydropyranet eventuelt substitueres med hydroksyl;

20 m er 0 eller 1; og

n er 0 eller 1.

2. Forbindelsen ifølge krav 1, et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og/eller et solvat av et hvilket som helst av det foregående, hvori:

A er:



R₃ velges fra hydrogen og metyl;

R₄ velges fra hydrogen og metyl, eller R₃ og R₄ tatt sammen danner et syklopropyl;

5 R₅ velges fra hydrogen og metyl;

R₆ velges fra hydrogen og metyl; eller

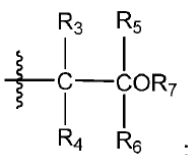
R₄ og R₆ tatt sammen danner et syklobutyl; eller

R₅ og R₆ tatt sammen danner et syklopropyl; og

R₇ er hydrogen;

10 fortrinnsvis hvori:

A er:



R₃ velges fra hydrogen og metyl;

R₄ velges fra hydrogen og metyl, eller R₃ og R₄ tatt sammen danner et syklopropyl;

15 R₅ velges fra hydrogen og metyl;

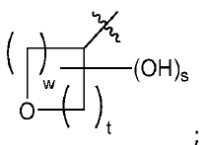
R₆ velges fra hydrogen og metyl; eller

R₅ og R₆ tatt sammen danner et syklopropyl, og

R₇ er hydrogen.

20 3. Forbindelsen ifølge krav 1, et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og/eller et solvat
av et hvilket som helst av det foregående, hvori:

A er



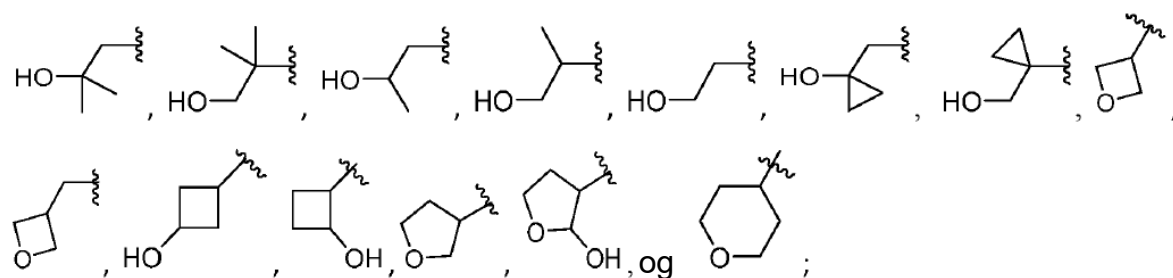
w er 1 eller 2:

25 t er 1 eller 2; og

s er 0 eller 1.

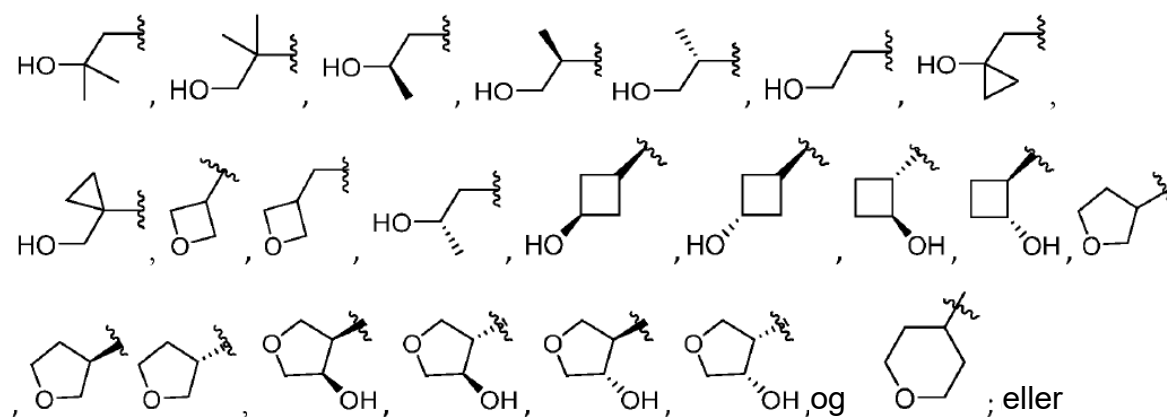
4. Forbindelsen ifølge krav 1, et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og/eller et solvat av et hvilket som helst av det foregående, hvori A velges fra:

(i)

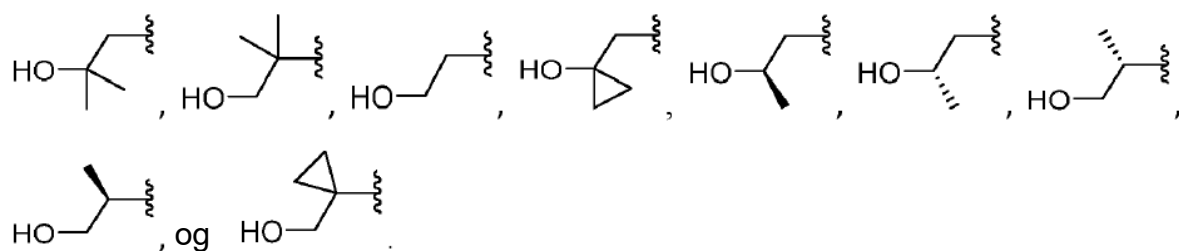


5 (ii)

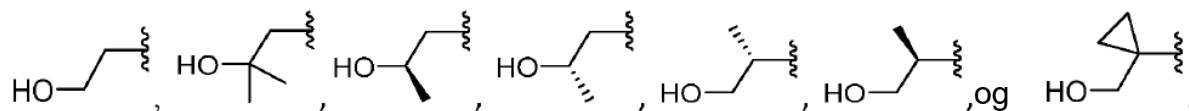
(ii)



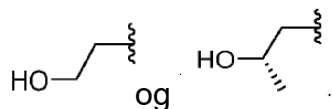
(iii)



10 5. Forbindelsen ifølge krav 1, et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og/eller et solvat
av et hvilket som helst av det foregående, hvori A velges fra



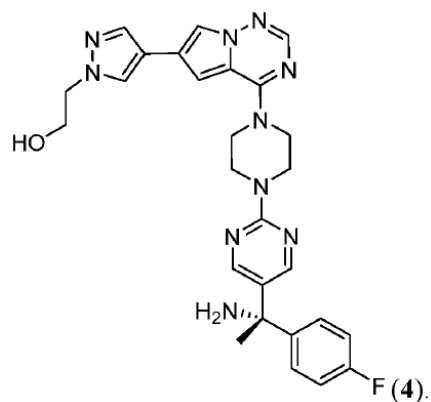
fortrinnsvis hvori A velges fra



EP 3953357

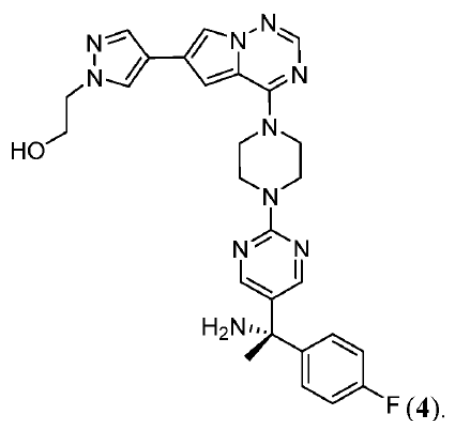
4

6. Forbindelse ifølge krav 1, et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og/eller et solvat av et hvilket som helst av det foregående, hvori forbindelsen er:



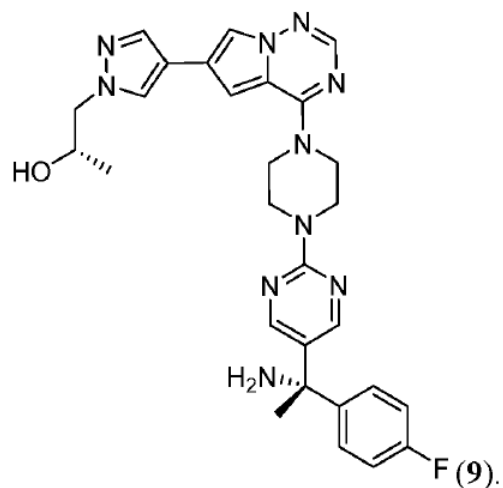
5

7. Forbindelsen ifølge krav 6,



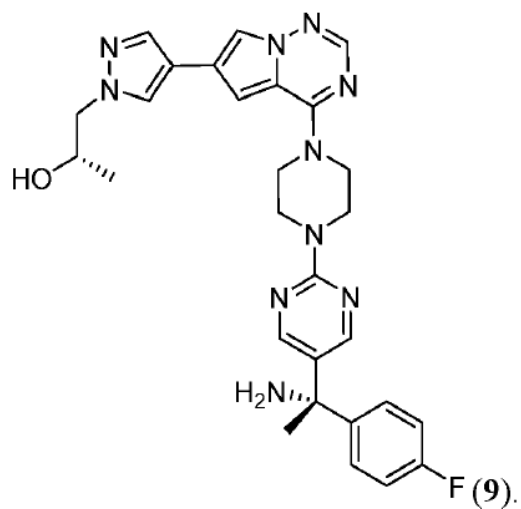
8. Forbindelse ifølge krav 1, et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og/eller et solvat av et hvilket som helst av det foregående, hvori forbindelsen er:

10

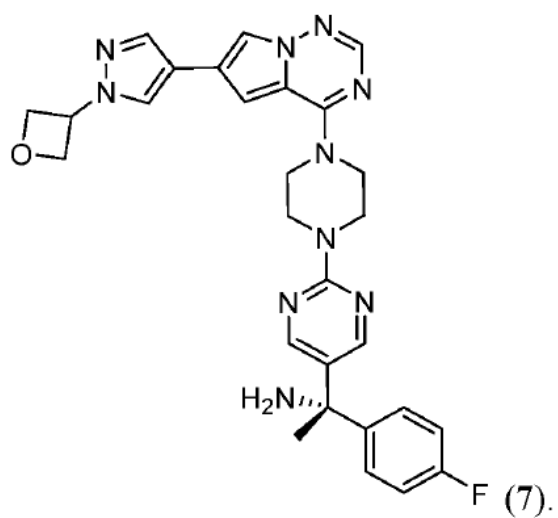


4

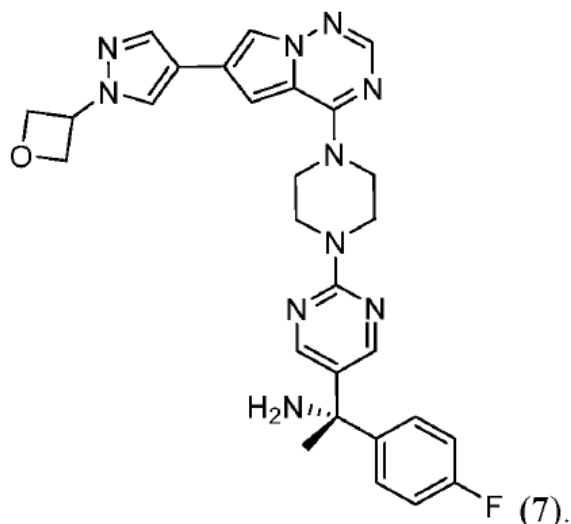
9. Forbindelsen ifølge krav 8



- 5 10 Forbindelse ifølge krav 1, et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og/eller et solvat av et hvilket som helst av det foregående, hvori forbindelsen er:



11. Forbindelsen ifølge krav 10,



12. Farmasøytisk sammensetning omfattende:

forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–11, et farmasøytisk akseptabelt
 5 salt derav, og/eller et solvat av et hvilket som helst av det foregående; og
 et farmasøytisk akseptabelt hjelpestoff.

13. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–11, et farmasøytisk
 akseptabelt salt derav, og/eller et solvat av et hvilket som helst av det foregående for
 10 anvendelse som et medikament for behandling av en sykdom eller tilstand hos en
 pasient med behov derav, hvori sykdommen eller tilstanden velges fra systemisk
 mastocytose, gastrointestinale stromale svulster, akutt myelogen leukemi, melanom,
 seminom, interkranielle kimcellesvulster, mediastinalt B-cellelymfom, Ewings sarkom,
 diffust storcellet B-cellelymfom, dysgerminom, myelodysplastisk syndrom, nasal
 15 NK/T-cellelymfom, kronisk myelomonocytisk leukemi og hjernekreft.

14. Forbindelsen, et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og/eller et solvat av et hvilket
 som helst av det foregående for anvendelsen ifølge krav 13, hvori sykdommen eller
 tilstanden er systemisk mastocytose, fortrinnsvis hvori den systemiske mastocytosen
 20 velges fra indolent systemisk mastocytose og ulmende systemisk mastocytose.

15. Forbindelsen, et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og/eller et solvat av et hvilket
 som helst av det foregående for anvendelsen ifølge krav 13, hvori sykdommen eller
 tilstanden er systemisk mastocytose, fortrinnsvis hvori den systemiske mastocytosen

velges fra aggressiv systemisk mastocytose, systemisk mastocytose med ikke-mastcelleavstamningssykdom og mastcelleleukemi.