



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3999506 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 471/04 (2006.01)
A61K 31/4375 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

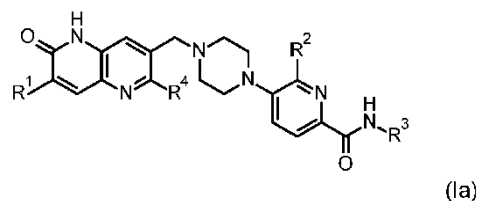
(45)	Translation Published	2025.04.14
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2025.01.15
(86)	European Application Nr.	20743121.4
(86)	European Filing Date	2020.07.17
(87)	The European Application's Publication Date	2022.05.25
(30)	Priority	2019.07.19, US, 201962876065 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	MA; TN
(73)	Proprietor	Astrazeneca AB, 151 85 Södertälje, Sverige
(72)	Inventor	PACKER, Martin, John, AstraZeneca R&D Alderley Alderley Park, Macclesfield Cheshire SK10 4TG, Storbritannia JOHANNES, Jeffrey, Wallace, AstraZeneca Pharmaceuticals LP 1800 Concord Pike, PO Box 15437, Wilmington, Delaware 19850-5437, USA HANDE, Sudhir, Mahadeo, AstraZeneca Pharmaceuticals LP 1800 Concord Pike, PO Box 15437, Wilmington, Delaware 19850-5437, USA DEGORCE, Sebastien, Louis, AstraZeneca Pharmaceuticals LP 1800 Concord Pike, PO Box 15437, Wilmington, Delaware 19850-5437, USA
(74)	Agent or Attorney	RWS, RWS Compass House, Vanwall Business Park, Vanwall Road, SL64UB MAIDENHEAD, BERKSHIRE, Storbritannia

(54)	Title	PARP1 INHIBITORS
(56)	References Cited:	US-A1- 2010 190 763 US-B2- 8 541 417 US-A1- 2018 162 834 US-A1- 2010 222 348

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 av formel (Ia)



5 hvori

R¹ er C₁₋₄alkyl,

R² velges fra H, halogen, C₁₋₄alkyl og C₁₋₄fluoralkyl,

R³ er H eller C₁₋₄alkyl, og

R⁴ er H;

10 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

2. Forbindelse eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge krav 1, hvori R² velges fra difluormetyl, trifluormetyl eller metyl.

15 3. Forbindelse eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge krav 1, hvori R² er H eller halogen.

4. Forbindelse eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge krav 1, hvori R¹ er etyl, R² velges fra H, klor og fluor, og R³ er metyl.

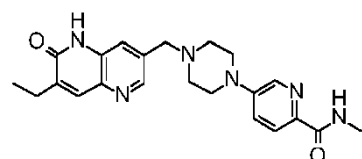
20

5. Forbindelse eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge krav 1 valgt fra:
5-[4-[(7-etyl-6-okso-5H-1,5-naftyridin-3-yl)metyl]piperazin-1-yl]-N-metyl-pyridin-2-karboksamid, 5-[4-[(7-etyl-6-okso-5H-1,5-naftyridin-3-yl)metyl]piperazin-1-yl]-6-fluor-N-metyl-pyridin-2-karboksamid,

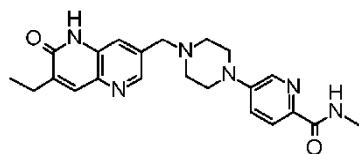
25 6-klor-5-[4-[(7-etyl-6-okso-5H-1,5-naftyridin-3-yl)metyl]piperazin-1-yl]-N-metyl-pyridin-2-karboksamid, og

5-[4-[(7-etyl-6-okso-5H-1,5-naftyridin-3-yl)metyl]piperazin-1-yl]pyridin-2-karboksamid.

6. Forbindelse eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, ifølge krav 1, hvori
30 forbindelsen er 5-[4-[(7-etyl-6-okso-5H-1,5-naftyridin-3-yl)metyl]piperazin-1-yl]-N-metyl-pyridin-2-karboksamid som har strukturen:



7. Forbindelse ifølge krav 1, hvori forbindelsen er 5-[4-[(7-etyl-6-okso-5H-1,5-naftyridin-3-yl)metyl]piperazin-1-yl]-N-metyl-pyridin-2-karboksamid som har strukturen:



5

8. Forbindelse eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge krav 1 som velges fra:

6-(difluormetyl)-5-[4-[(7-etyl-6-okso-5H-1,5-naftyridin-3-yl)metyl]piperazin-1-yl]-N-metylpyridin-2-karboksamid,

10 5-[4-[(7-etyl-6-okso-5H-1,5-naftyridin-3-yl)metyl]piperazin-1-yl]-N-metyl-6-(trifluormetyl)pyridin-2-karboksamid,

5-[4-[(7-etyl-6-okso-5H-1,5-naftyridin-3-yl)metyl]piperazin-1-yl]-N,6-dimetyl-pyridin-2-karboksamid, og

15 N-etyl-5-[4-[(7-etyl-6-okso-5H-1,5-naftyridin-3-yl)metyl]piperazin-1-yl]pyridin-2-karboksamid.

9. Farmasøytisk sammensetning omfattende en forbindelse eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8, og minst ett farmasøytisk akseptabelt fortynningsmiddel, eksipiens eller inert bærer.

20

10. Forbindelse eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8, for anvendelse som et medikament.

11. Forbindelse eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge et hvilket som helst
25 av kravene 1 til 8, for anvendelse i behandlingen av kreft hos en kreftpasient.

12. Forbindelse eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse ifølge krav 11, hvori kreften er mangelfull i HR-avhengig DNA DSB-reparasjonsreaksjonsvei.

30 13. Forbindelse eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse ifølge krav 11, hvori kreften omfatter én eller flere kreftceller som har en redusert eller opphevet evne til å reparere DNA DSB ved HR i forhold til normale celler.

14. Forbindelse eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse ifølge krav 11 eller 12, hvori kreften omfatter én eller flere kreftceller som har en BRCA1- eller BRCA2-mangelfull fenotype.
- 5 15. Forbindelse eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse ifølge krav 14, hvori kreften omfatter én eller flere kreftceller som mangler BRCA1 eller BRCA2.
- 10 16. Forbindelse eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 12 til 15, hvori pasienten er heterozygot for en mutasjon i et gen som koder for en komponent av den HR-avhengige DNA DSB-reparasjonsreaksjonsveien.
- 15 17. Forbindelse eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse ifølge krav 16, hvori pasienten er heterozygot for en mutasjon i BRCA1 og/eller BRCA2.
18. Forbindelse eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 11 til 17, hvori kreften velges fra en hvilken som helst av bryst-, eggstokk-, bukspyttkjertel-, prostata-, hematologisk, gastrointestinal og lungekreft.