

(19)



SUOMI - FINLAND  
(FI)

PATENTTI- JA REKISTERIHALLITUS  
PATENT- OCH REGISTERSTYRELSEN  
FINNISH PATENT AND REGISTRATION OFFICE

(10) **FI/EP3952995 T3**  
(12) **EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS**  
**ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT**  
**TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION**

- (45) Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning - **26.10.2023**  
Translation available to the public
- (97) Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för **20.09.2023**  
det europeiska patentet - Date of grant of European patent
- (51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -  
International patent classification  
**C07F 5/02** ( 2006 . 01 )  
**A61P 31/00** ( 2006 . 01 )  
**A61K 45/06** ( 2006 . 01 )  
**A61P 35/00** ( 2006 . 01 )
- (96) Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan - **EP20722196.1**  
European patent application
- (22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date **10.04.2020**
- (97) Patentihakemuksen julkiseksitulospäivä - Patentansökans **16.02.2022**  
publiceringsdag - Patent application available to the public
- (86) Kansainvälinen hakemus - Internationell **10.04.2020 PCT/US2020027700**  
ansökan - International application
- (30) Etuoikeus - Prioritet - Priority  
12.04.2019 US US201962833455 P 31.07.2019 US US201962881111 P

(73) Haltija - Innehavare - Holder  
**1• Riboscience LLC**, 3901 Laguna Avenue , Palo Alto, CA 94306 , (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor  
**1• HAWLEY, Ronald**, 3901 Laguna Avenue , Palo Alto, California 94306 , (US)  
**2• KLUMPP, Klaus**, 3901 Laguna Avenue , Palo Alto, California 94306 , (US)

(74) Asiamies - Ombud - Agent  
**Zacco Sweden AB**, P.O. Box 5581 Valhallavägen 117 N, 114 85 Stockholm , (SE)

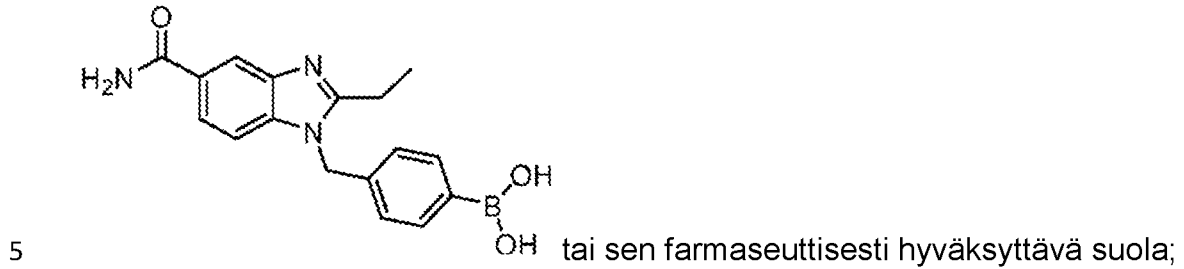
(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention  
**Bisyklisiä heteroaryyli johdannaisia ektonukleotidipyrofosfataasifosfodiesterasi-1:n inhibiittoreina**  
**BICYCLIC HETEROARYL DERIVATIVES AS ECTONUCLEOTIDE PYROPHOSPHATASE PHOSPHODIESTERASE 1 INHIBITORS**

EP3952995

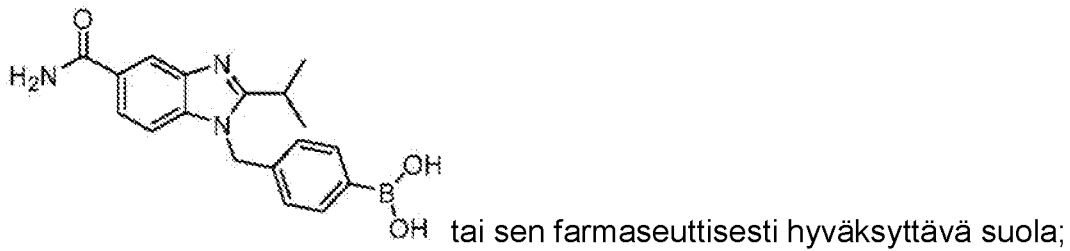
PATENTTIVAATIMUKSET

1. Yhdiste, joka valitaan seuraavista:

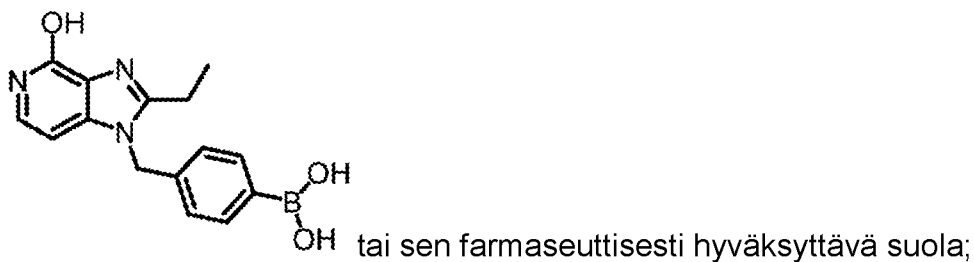
seuraavan rakenteen mukainen 4-((5-karbamoyyli-2-etyyli-1,3-bentsodiatsol-1-yyli)metyyli)fenyyliboorihappo:



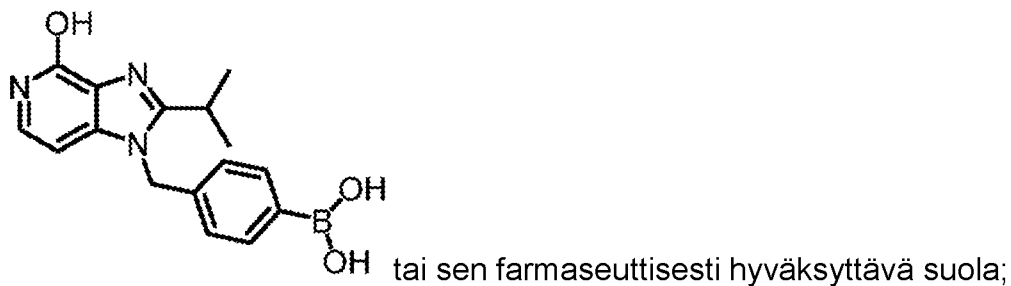
seuraavan rakenteen mukainen 4-((5-karbamoyyli-2-isopropyyli-1,3-bentsodiatsol-1-yyli)metyyli)fenyyliboorihappo:



10 seuraavan rakenteen mukainen 4-((2-etyyli-4-hydroksiimidatso[4,5-c]pyridin-1-yyli)metyyli)fenyyliboorihappo:

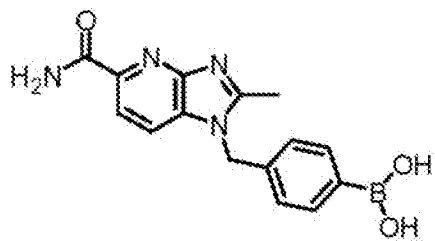


seuraavan rakenteen mukainen 4-((4-hydroksi-2-isopropyyliimidatso[4,5-c]pyridin-1-yyli)metyyli)fenyyliboorihappo:



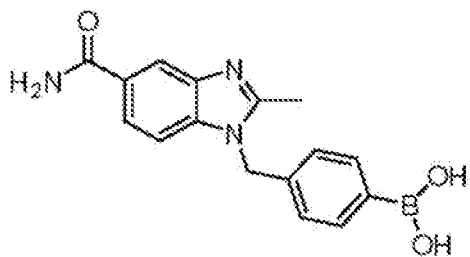
EP3952995

seuraavan rakenteen mukainen 4-((5-karbamoyyli-2-metyyli-1H-imidatso[4,5-b]pyridin-1-yyli)metyyli)fenyyli)boorihappo:



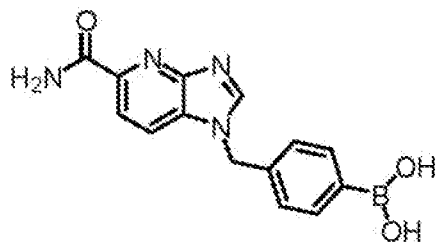
tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola;

5 seuraavan rakenteen mukainen 4-((5-karbamoyyli-2-metyyli-1H-bentso[d]imidatso[1,5-b]pyridin-1-yyli)metyyli)fenyyli)boorihappo:



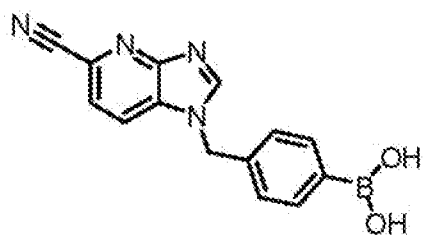
tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola;

seuraavan rakenteen mukainen 4-((5-karbamoyyliimidatso[4,5-b]pyridin-1-yyli)metyyli)fenyyliboorihappo:



tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola;

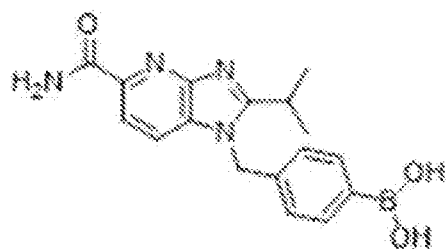
10 seuraavan rakenteen mukainen 4-((5-cyanoimidatso[4,5-b]pyridin-1-yyli)metyyli)fenyyliboorihappo:



tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola;

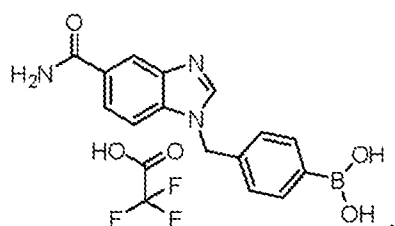
seuraavan rakenteen mukainen 4-((5-karbamoyyli-2-isopropyyli-imidatso[4,5-b]pyridin-1-yyli)metyyli)fenyyliboorihappo:

EP3952995



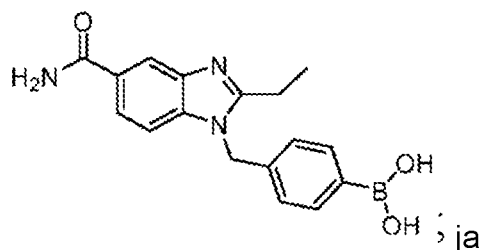
tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola; ja

4-((5-karbamoyyli-1,3-bentsodiatsol-1-yyli)metyyli)fenyyliboorihappotrifluoretikkahapposuola



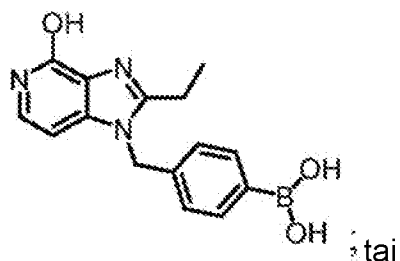
5. 2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, joka valitaan seuraavista:

seuraavan rakenteen mukaisesta 4-((5-karbamoyyli-2-etyyli-1,3-bentsodiatsol-1-yyli)metyyli)fenyyliboorihappo:



; ja

10 seuraavan rakenteen mukainen 4-((2-etyyli-4-hydroksiimidatso[4,5-c]pyridin-1-yyli)metyyli)fenyyliboorihappo:



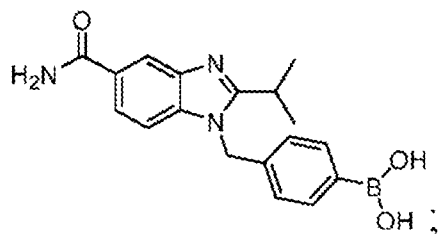
; tai

sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

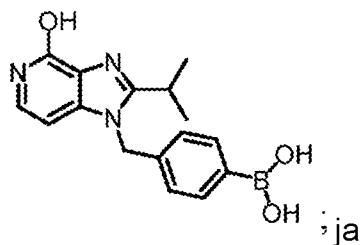
3. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, joka valitaan seuraavista:

EP3952995

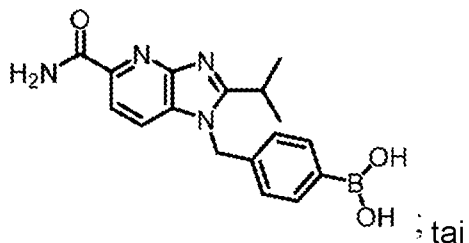
seuraavan rakenteen mukainen 4-((5-karbamoyyli-2-isopropyyli-1,3-bentsodiatsol-1-yyli)metyyli)fenyyliboorihappo:



5 seuraavan rakenteen mukainen 4-((4-hydroksi-2-isopropyyli-imidatso[4,5-c]pyridin-1-yyli)metyyli)fenyyliboorihappo:



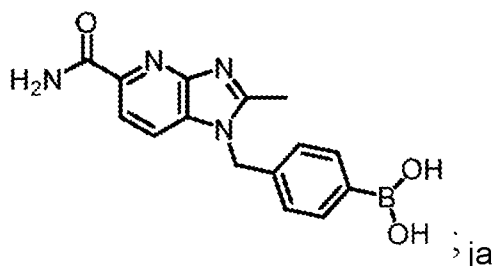
seuraavan rakenteen mukainen 4-((5-karbamoyyli-2-isopropyyli-imidatso[4,5-b]pyridin-1-yyli)metyyli)fenyyliboorihappo:



10 sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

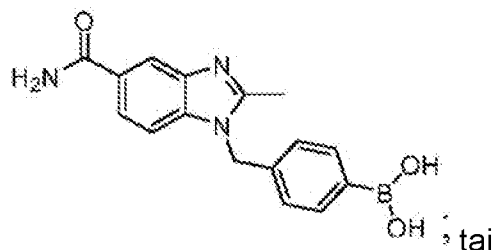
4. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, joka valitaan seuraavista:

seuraavan rakenteen mukainen (4-((5-karbamoyyli-2-metyyli-1H-imidatso[4,5-b]pyridin-1-yyli)metyyli)fenyyli)boorihappo:



EP3952995

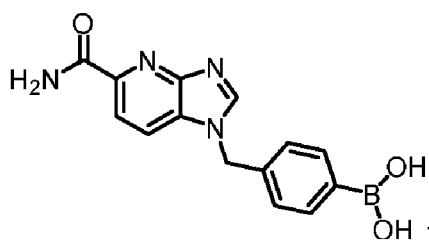
seuraavan rakenteen mukainen 4-((5-karbamoyyli-2-metyyli-1H-bentso[d]imidatsol-1-yyli)metyyli)fenyyli)boorihappo:



sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

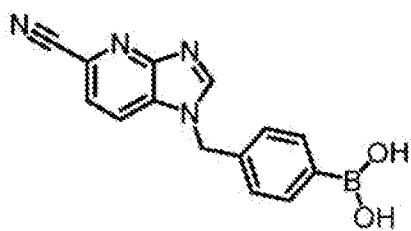
5 **5.** Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, joka valitaan seuraavista:

seuraavan rakenteen mukainen 4-((5-karbamoyyliimidatso[4,5-b]pyridin-1-yyli)metyyli)fenyyliboorihappo:



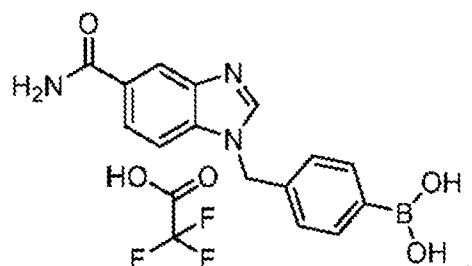
tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola;

10 seuraavan rakenteen mukainen 4-((5-syanoimidatso[4,5-b]pyridin-1-yyli)metyyli)fenyyliboorihappo:



tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola; ja

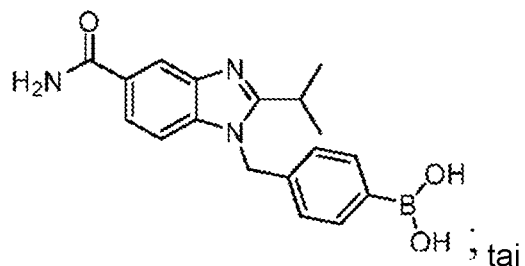
4-((5-karbamoyyli-1,3-bentsodiatsol-1-yyli)metyyli)fenyyliboorihappotrifluorietikkahapposuola



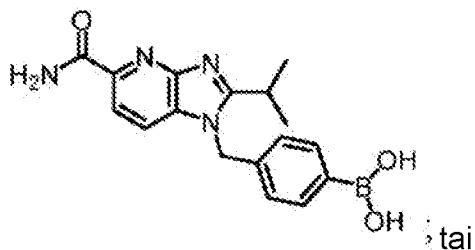
EP3952995

6. Patenttivaatimuksen 1 tai 3 mukainen yhdiste, joka valitaan seuraavista:

seuraavan rakenteen mukainen 4-((5-karbamoyyli-2-isopropyyli-1,3-bentsodiatso-1-yyli)metyyli)fenyyliboorihappo:



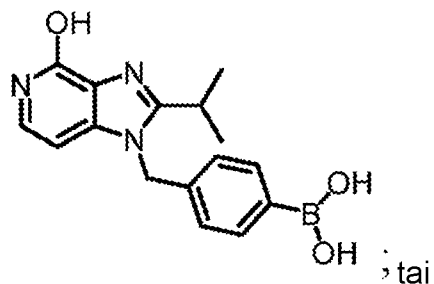
5 seuraavan rakenteen mukainen 4-((5-karbamoyyli-2-isopropyyli-imidatso[4,5-b]pyridin-1-yyli)metyyli)fenyyliboorihappo:



sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

7. Patenttivaatimuksen 1 tai 3 mukainen yhdiste, joka valitaan seuraavista:

10 seuraavan rakenteen mukainen 4-((4-hydroksi-2-isopropyyli-imidatso[4,5-c]pyridin-1-yyli)metyyli)fenyyliboorihappo:

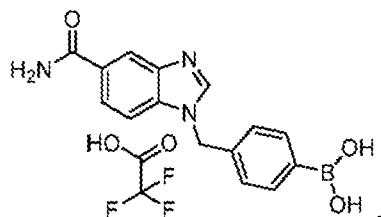


sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

8. Patenttivaatimuksen 1 tai 5 mukainen yhdiste, joka valitaan seuraavista:

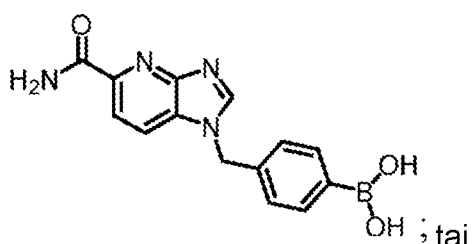
15 4-((5-karbamoyyli-1,3-bentsodiatso-1-yyli)metyyli)fenyyliboorihappotrifluorietikkahapposuola

EP3952995



9. Patenttivaatimuksen 1 tai 5 mukainen yhdiste, joka valitaan seuraavista:

seuraavan rakenteen mukainen 4-((5-karbamoyyliimidatso[4,5-b]pyridin-1-yyli)metyyli)fenyyliboorihappo:



5

sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

10. Farmaseuttinen koostumus, joka käsittää jonkin patenttivaatimuksen 1–9 mukaista yhdistettä tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävää suolaa ja farmaseuttisesti hyväksyttävää apuainetta.

10 11. Jonkin patenttivaatimuksen 1–9 mukainen yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola tai patenttivaatimuksen 10 mukainen farmaseuttinen koostumus käytettäväksi syövän, tulehdussairauden, aineenvaihduntasairauden tai virussairauden hoitomenetelmässä.

15 12. Yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola tai farmaseuttinen koostumus käytettäväksi patenttivaatimuksen 11 mukaisesti, jolloin menetelmä on syövän hoitoon.

20 13. Yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola tai farmaseuttinen koostumus käytettäväksi patenttivaatimuksen 12 mukaisesti, jolloin syöpä on hepatosellulaarikarsinooma, glioblastooma, melanooma, kives-, haima-, kilpirauhas- tai rintasyöpä.

14. Yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola tai farmaseuttinen koostumus käytettäväksi patenttivaatimuksen 12 tai 13 mukaisesti, jolloin yhdiste tai

EP3952995

sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola tai farmaseuttinen koostumus on annettavaksi vähintään yhden lisäsyöpälääkkeen kanssa.

5 **15.** Yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola tai farmaseuttinen koostumus käytettäväksi patenttivaatimuksen 14 mukaisesti, jolloin tämä vähintään yksi lisäsyöpälääke on immuunivasteen vapauttaja.

**16.** Yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola tai farmaseuttinen koostumus käytettäväksi patenttivaatimuksen 15 mukaisesti, jolloin immuunivasteen vapauttaja on monoklonaalinen anti-PD-1-vasta-aine tai monoklonaalinen anti-PDL1-vasta-aine.

10 **17.** Yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola tai farmaseuttinen koostumus käytettäväksi patenttivaatimuksen 16 mukaisesti, jolloin monoklonaalinen anti-PD-1-vasta-aine tai monoklonaalinen anti-PDL1-vasta-aine on nivolumabi, pembrolitsumabi, pidilitsumabi, atetsolitsumabi tai durvalumabi.