

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

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

- (10) **FI/EP3999506 T3**
- (12) **EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION**
- (45) Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning - **08.04.2025**
Translation available to the public
- (97) Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för **15.01.2025**
det europeiska patentet - Date of grant of European patent
- (51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -
International patent classification
C07D 471/04 (2006 . 01)
C07D 401/12 (2006 . 01)
A61K 31/4375 (2006 . 01)
A61P 35/00 (2006 . 01)
- (96) Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan - **EP20743121.4**
European patent application
- (22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date **17.07.2020**
- (97) Patenttihakemuksen julkiseksitulospäivä - Patentansökans **25.05.2022**
publiceringsdag - Patent application available to the public
- (86) Kansainvälinen hakemus - Internationell **17.07.2020 PCT/EP2020070306**
ansökan - International application
- (30) Etuoikeus - Prioritet - Priority
19.07.2019 US US201962876065 P

(73) Haltija - Innehavare - Holder
1• Astrazeneca AB, 151 85 Södertälje, (SE)

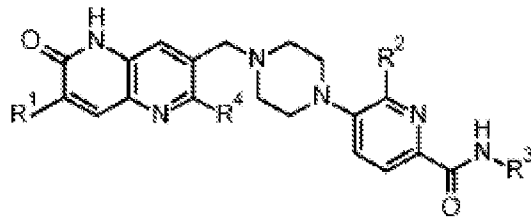
(72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor
1• PACKER, Martin, John, AstraZeneca R&D Alderley Alderley Park, Macclesfield Cheshire SK10 4TG, (GB)
2• JOHANNES, Jeffrey, Wallace, AstraZeneca Pharmaceuticals LP 1800 Concord Pike, PO Box 15437, Wilmington, Delaware 19850-5437, (US)
3• HANDE, Sudhir, Mahadeo, AstraZeneca Pharmaceuticals LP 1800 Concord Pike, PO Box 15437, Wilmington, Delaware 19850-5437, (US)
4• DEGORCE, Sebastien, Louis, AstraZeneca Pharmaceuticals LP 1800 Concord Pike, PO Box 15437, Wilmington, Delaware 19850-5437, (US)

(74) Asiamies - Ombud - Agent
Papula Oy, P.O.Box 981, 00101 Helsinki, (FI)

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention
PARP1-INHIBITTOREITA
PARP1 INHIBITORS

PATENTTIVAATIMUKSET

1. Yhdiste, jolla on kaava (Ia)



(Ia)

jossa

5 R¹ on C₁₋₄-alkyyli,
 R² valitaan H:stä, halogeenista, C₁₋₄-alkyy-
 listä ja C₁₋₄-fluorialkyylistä,
 R³ on H tai C₁₋₄-alkyyli ja
 R⁴ on H;

10 tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

 2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste tai
 sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, jossa R² vali-
 taan difluorimetyylistä, trifluorimetyylistä tai metyy-
 listä.

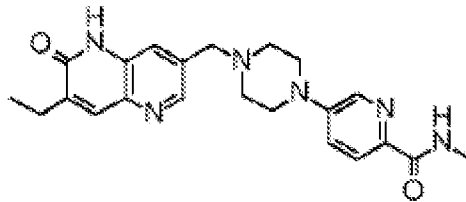
15 3. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste tai
 sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, jossa R² on H
 tai halogeeni.

 4. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste tai
 sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, jossa R¹ on
 20 etyyli, R² valitaan H:stä, kloorista ja fluorista ja R³
 on metyyli.

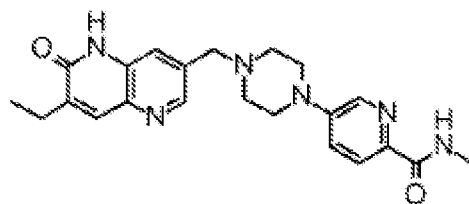
 5. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste tai
 sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, joka valitaan:
 25 5-[4-[(7-etyyli-6-okso-5H-1,5-naftyridin-3-
 yyli)metyyli]piperatsin-1-yyli]-N-metyylipy-
 ridiini-2-karboksamidista,
 5-[4-[(7-etyyli-6-okso-5H-1,5-naftyridin-3-
 yyli)metyyli]piperatsin-1-yyli]-6-fluori-N-
 metyylipyridiini-2-karboksamidista,

6-kloori-5-[4-[(7-etyyli-6-okso-5H-1,5-naftyridin-3-yyli)metyyli]piperatsin-1-yyli]-N-metyylipyridiini-2-karboksamidista ja
 5-[(4-[(7-etyyli-6-okso-5H-1,5-naftyridin-3-yyli)metyyli]piperatsin-1-yyli)pyridiini-2-karboksamidista.

6. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, jossa yhdiste on 5-[(4-[(7-etyyli-6-okso-5H-1,5-naftyridin-3-yyli)metyyli]piperatsin-1-yyli)-N-metyylipyridiini-2-karboksamidi, jolla on rakenne:



7. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, jossa yhdiste on 5-[(4-[(7-etyyli-6-okso-5H-1,5-naftyridin-3-yyli)metyyli]piperatsin-1-yyli)-N-metyylipyridiini-2-karboksamidi, jolla on rakenne:



20

8. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, joka valitaan:
 6-(difluorimetyyli)-5-[(4-[(7-etyyli-6-okso-5H-1,5-naftyridin-3-yyli)metyyli]piperatsin-1-yyli)-N-metyylipyridiini-2-karboksamidista,
 5-[(4-[(7-etyyli-6-okso-5H-1,5-naftyridin-3-yyli)metyyli]piperatsin-1-yyli)-N-metyyli-

25

6(trifluorimetyyli)pyridiini-2-karboksami-
dista,
5-[4-[(7-etyyli-6-okso-5H-1,5-naftyridin-3-
yyli)metyyli]piperatsin-1-yyli]-N,6-dimetyy-
5 lipyridiini-2-karboksamidista ja
N-etyyli-5-[4-[(7-etyyli-6-okso-5H-1,5-naf-
tyridin-3-yyli)metyyli]piperatsin-1-yyli]py-
ridiini-2-karboksamidista.

9. Farmaseuttinen koostumus, joka käsittää
10 jonkin patenttivaatimuksista 1 - 8 mukaista yhdistettä
tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävää suolaa ja vähin-
tään yhtä farmaseuttisesti hyväksyttävää laimenninta,
täyteainetta tai inerttiä kantajaa.

10. Jonkin patenttivaatimuksista 1 - 8 mukai-
15 nen yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola
käytettäväksi lääkkeenä.

11. Jonkin patenttivaatimuksista 1 - 8 mukai-
nen yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola
käytettäväksi syövän hoidossa syöpäpotilaalla.

20 12. Yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyt-
tävä suola käytettäväksi patenttivaatimuksen 11 mukai-
sesti, jossa mainittu syöpä on puutteellinen HR-riippu-
vaisen DNA:n DSB-korjausreitin suhteen.

25 13. Yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyt-
tävä suola käytettäväksi patenttivaatimuksen 11 mukai-
sesti, jossa mainittu syöpä käsittää yhden tai useampia
syöpäsoluja, joiden kyky korjata DNA:n DSB HR:lla on
vähentynyt tai lakannut verrattuna normaaleihin solui-
hin.

30 14. Yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyt-
tävä suola käytettäväksi patenttivaatimuksen 11 tai 12
mukaisesti, jossa mainittu syöpä käsittää yhden tai use-
ampia syöpäsoluja, joilla on BRCA1- tai BRCA2-puutteinen
fenotyyppi.

35 15. Yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyt-
tävä suola käytettäväksi patenttivaatimuksen 14

mukaisesti, jossa mainittu syöpä käsittää yhden tai useampia syöpäsoluja, jotka ovat BRCA1- tai BRCA2-puutteisia.

5 16. Yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksista 12 - 15 mukaisesti, jossa mainittu potilas on heterotsygoottinen mutaation suhteen geenissä, joka koodaa HR-riippuvaisen DNA:n DSB-korjausreitin komponenttia.

10 17. Yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola käytettäväksi patenttivaatimuksen 16 mukaisesti, jossa mainittu potilas on heterotsygoottinen mutaation suhteen BRCA1:ssä ja/tai BRCA2:ssa.

15 18. Yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksista 11 - 17 mukaisesti, jossa syöpä valitaan rinta-, munasarja-, haima-, eturauhas-, hematologisesta, gastrointestinaalisesta ja keuhkosyövästä.