

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

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

(10) **FI/EP4139309 T3**
(12) **EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS**
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION

- (45) Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning - Translation available to the public **04.03.2025**
- (97) Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för det europeiska patentet - Date of grant of European patent **29.01.2025**
- (51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering - International patent classification
C07D 487/04 (2006 . 01)
C07D 519/00 (2006 . 01)
A61P 35/00 (2006 . 01)
A61K 31/519 (2006 . 01)
- (96) Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan - European patent application **EP21716218.9**
- (22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date **07.04.2021**
- (97) Patenttihakemuksen julkiseksitulosopäivä - Patentansökans publiceringsdag - Patent application available to the public **01.03.2023**
- (86) Kansainvälinen hakemus - Internationell ansökan - International application **07.04.2021 PCT/EP2021059015**
- (30) Etuoikeus - Prioritet - Priority
24.04.2020 EP EP20171221

(73) Haltija - Innehavare - Holder

1• Boehringer Ingelheim International GmbH, Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, (DE)

(72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor

- 1• WILDING, Birgit**, Boehringer Ingelheim International GmbH, Corporate Patents, Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, (DE)
2• BOESE, Dietrich, Boehringer Ingelheim International GmbH, Corporate Patents, Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, (DE)
3• ENGELHARDT, Harald, Boehringer Ingelheim International GmbH, Corporate Patents, Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, (DE)
4• FUCHS, Julian, Boehringer Ingelheim International GmbH, Corporate Patents, Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, (DE)
5• NEUMUELLER, Ralph, Boehringer Ingelheim International GmbH, Corporate Patents, Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, (DE)
6• PETRONCZKI, Mark, Boehringer Ingelheim International GmbH, Corporate Patents, Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, (DE)
7• SCHARN, Dirk, Boehringer Ingelheim International GmbH, Corporate Patents, Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, (DE)
8• TREU, Matthias, Boehringer Ingelheim International GmbH, Corporate Patents, Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, (DE)

(74) Asiamies - Ombud - Agent

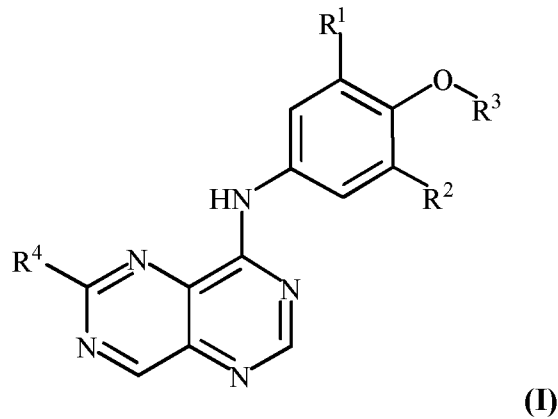
Leitzinger Oy, c/o Spaces Mannerheiminaukio 1A, 00100 Helsinki, (FI)

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

[1,3]DIATSINO[5,4-d]PYRIMIDIINEJÄ HER2:N ESTÄJINÄ
[1,3]DIAZINO[5,4-D]PYRIMIDINES AS HER2 INHIBITORS

PATENTTIVAATIMUKSET

1. Kaavan (I) mukainen yhdiste tai sen suola,



5

jossa

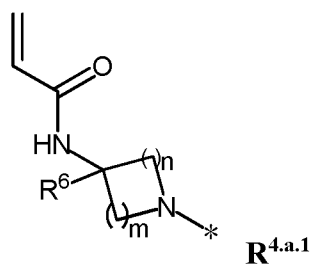
R¹ valitaan ryhmästä, joka koostuu vedystä, ryhmistä -CH₃, -CCH₃, -OCH₃ ja halogeenista;

10 **R²** on vety tai or halogeeni;

R³ valitaan ryhmästä, joka koostuu kaavoista (i.1), (i.2), (i.3) ja (i.4);

<p>(i.1)</p>	<p>(i.2)</p>
<p>(i.3)</p>	<p>(i.4)</p>

R^4 valitaan ryhmästä, joka koostuu ryhmistä $R^{4.a}$ ja $R^{4.b}$, joissa $R^{4.a}$ on $R^{4.a.1}$



jossa

5

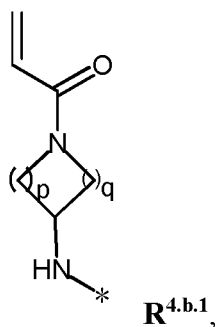
R^6 on -H tai $-CH_3$,

n on 1 tai 2;

m on 1 tai 2;

ja

10 $R^{4.b}$ on $R^{4.b.1}$



jossa

p on 1 tai 2;

15 q on 1 tai 2;

R^5 on -H tai $-CH_3$;

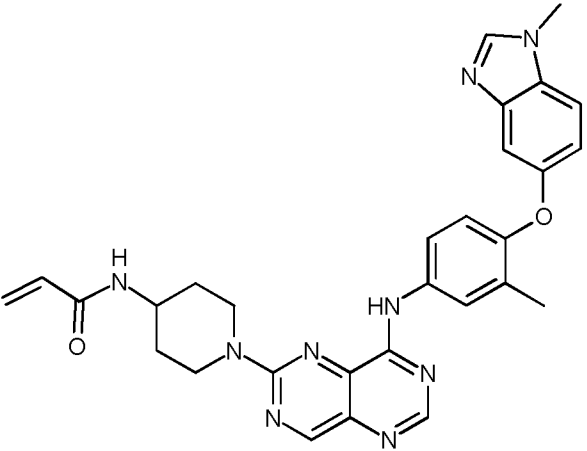
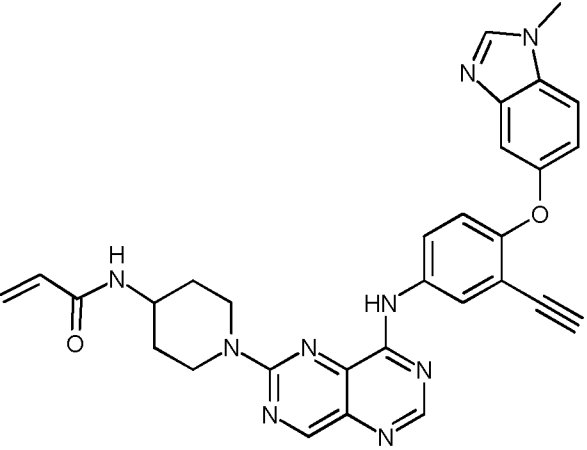
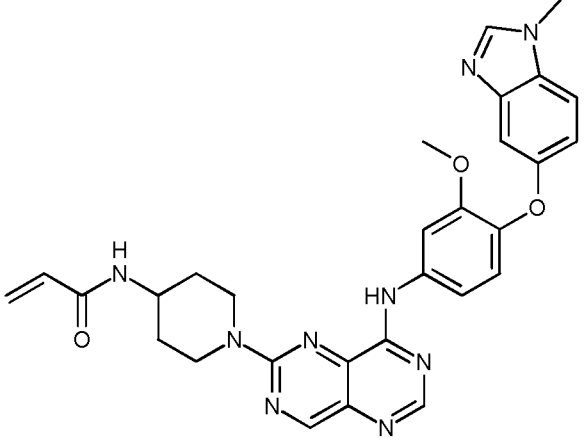
ja ainakin toinen ryhmistä R^1 ja R^2 ei ole vety.

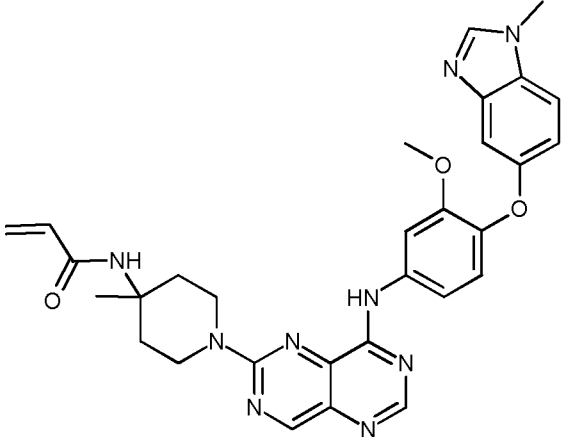
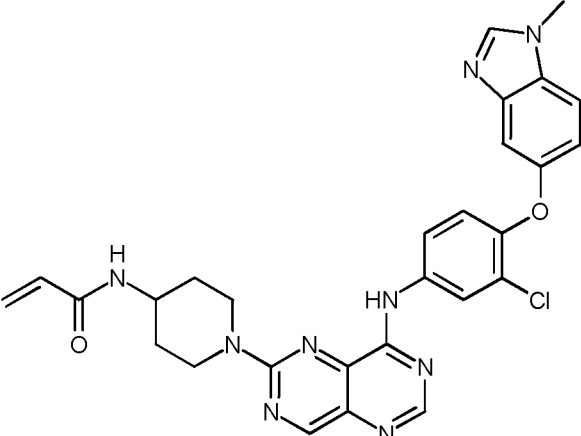
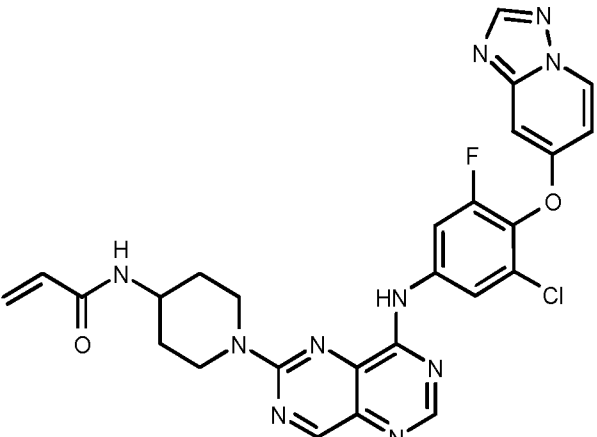
20

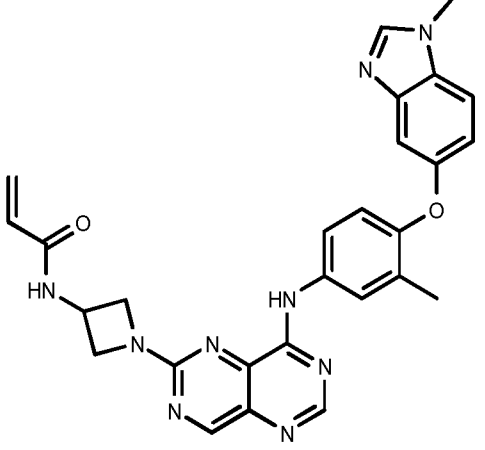
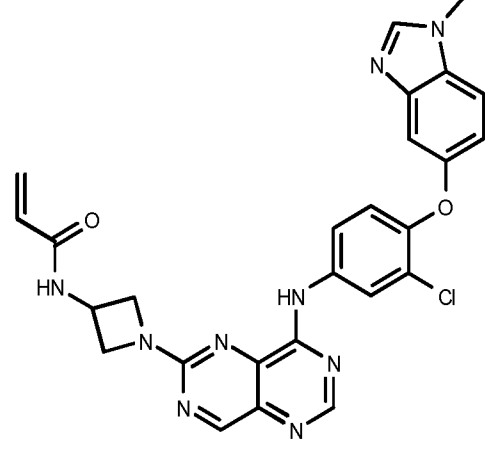
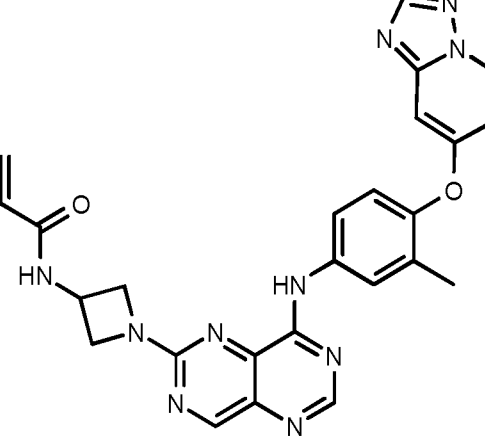
2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste tai sen suola, jossa

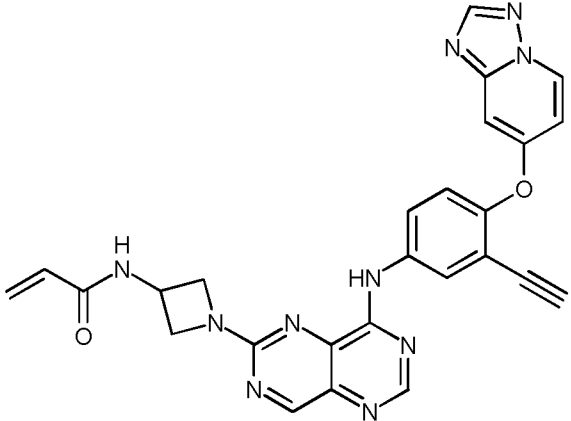
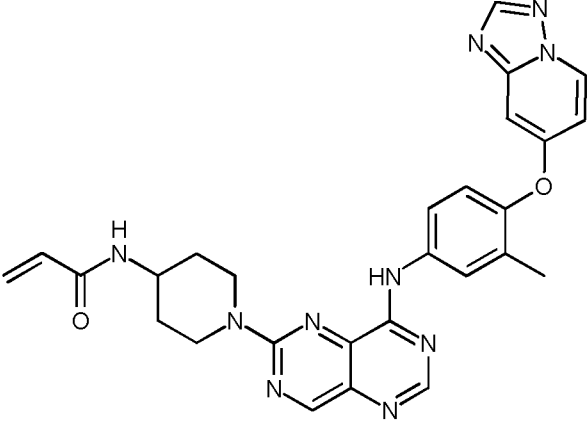
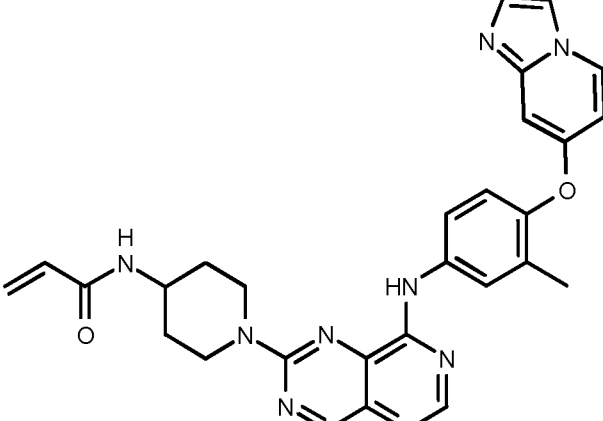
R^1 valitaan ryhmästä, joka koostuu ryhmistä $-CH_3$, $-CCH_3$, $-OCH_3$ ja halogeenista.

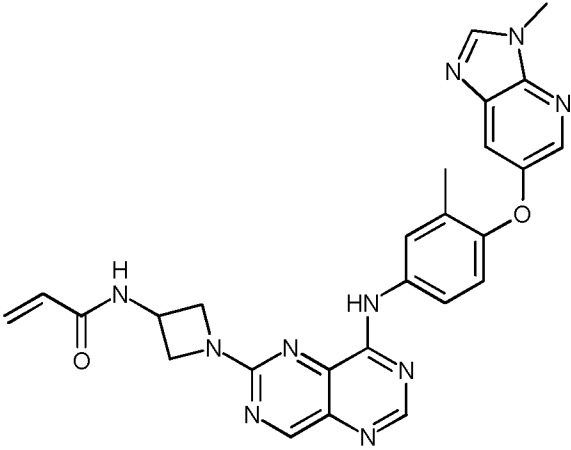
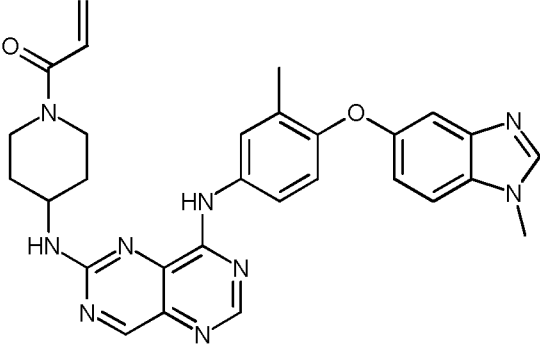
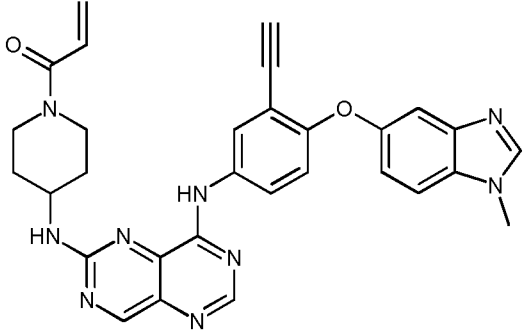
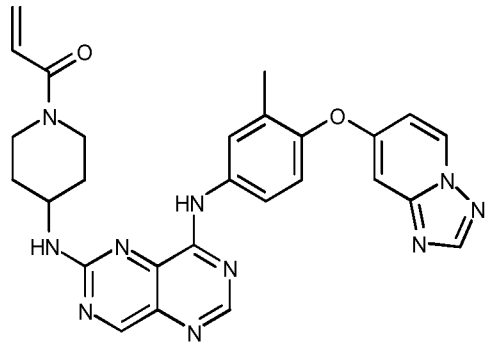
3. Patenttivaatimuksen 1 tai 2 mukainen yhdiste tai sen suola, jossa R^1 on $-CH_3$.
- 5 4. Patenttivaatimuksen 1 tai 2 mukainen yhdiste tai sen suola, jossa R^1 on $-CCH$.
5. Patenttivaatimuksen 1 tai 2 mukainen yhdiste tai sen suola, jossa R^1 on $-OCH_3$.
- 10 6. Patenttivaatimuksen 1 tai 2 mukainen yhdiste tai sen suola, jossa R^1 on kloori.
7. Patenttivaatimuksen 1 tai 2 mukainen yhdiste tai sen suola, jossa R^1 on fluori.
- 15 8. Patenttivaatimuksista 1-7 yhden tai useamman mukainen yhdiste tai sen suola, jossa R^2 on vety.
- 20 9. Patenttivaatimuksista 1-7 yhden tai useamman mukainen yhdiste tai sen suola, jossa R^2 on kloori.
10. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola valittuna ryhmistä, joka koostuu esimerkeistä I-01 - I-19:

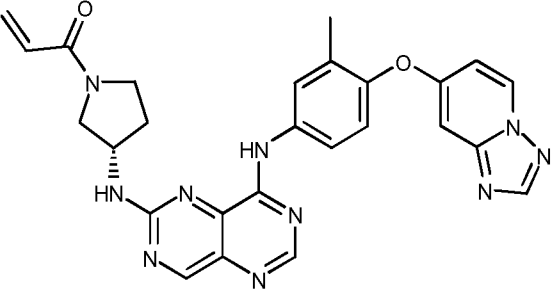
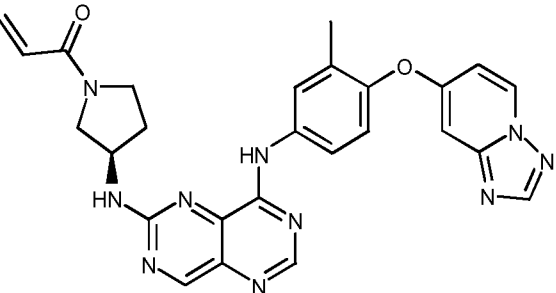
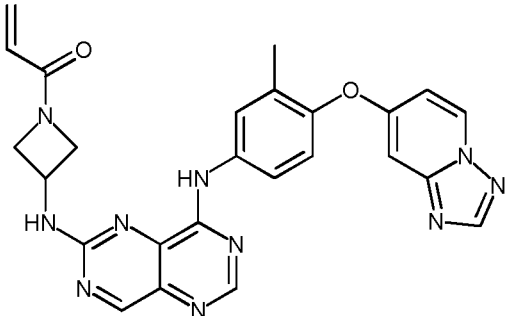
Esimerkki	Rakenne
I-01	 <chem>CC1=CC=C(C=C1)C(=O)N[C@@H]2CCN(C2)c3nc4nc5nc6c(nc34)nc5Nc7cc(C)c(Oc8cc9c(nc8)N)cc9</chem>
I-02	 <chem>CC1=CC=C(C=C1)C(=O)N[C@@H]2CCN(C2)c3nc4nc5nc6c(nc34)nc5Nc7cc(C#C)c(Oc8cc9c(nc8)N)cc9</chem>
I-03	 <chem>CC1=CC=C(C=C1)C(=O)N[C@@H]2CCN(C2)c3nc4nc5nc6c(nc34)nc5Nc7cc(OC)c(Oc8cc9c(nc8)N)cc9</chem>

Esimerkki	Rakenne
I-04	
I-05	
I-06	

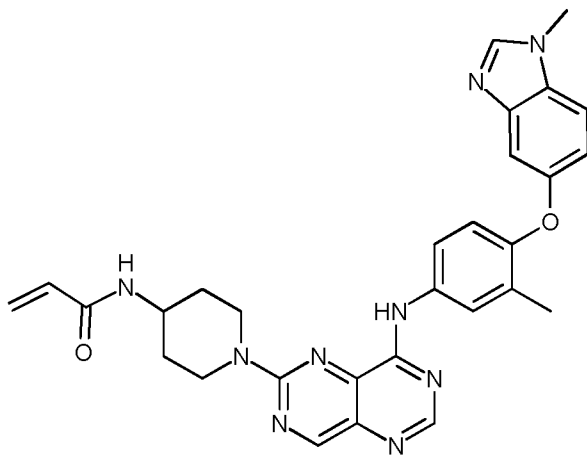
Esimerkki	Rakenne
I-07	 <chem>CC1=CC=C(NC1=NC2=NC=NC=C2N3C=NC=CN3)C(=O)C=CNC4C=CC=C(C)N4OC5=CC=C(NC5=NC6=CC=CC=C6N6C)C</chem>
I-08	 <chem>CC1=CC=C(NC1=NC2=NC=NC=C2N3C=NC=CN3)C(=O)C=CNC4C=CC=C(N4)OC5=CC=C(NC5=NC6=CC=CC=C6N6C)C</chem>
I-09	 <chem>CC1=CC=C(NC1=NC2=NC=NC=C2N3C=NC=CN3)C(=O)C=CNC4C=CC=C(C)N4OC5=CC=C(NC5=NN=CN5)C</chem>

Esimerkki	Rakenne
I-10	
I-11	
I-12	

Esimerkki	Rakenne
I-13	
I-14	
I-15	
I-16	

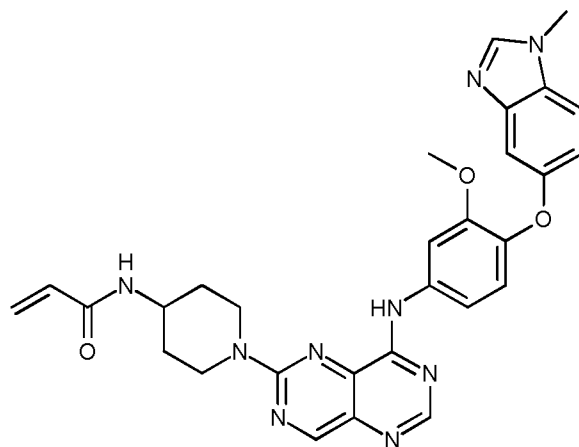
Esimerkki	Rakenne
I-17	
I-18	
I-19	

11. Patenttivaatimuksen 1, 2, 3 tai 8 mukainen yhdiste, jolla on seuraava rakenne:



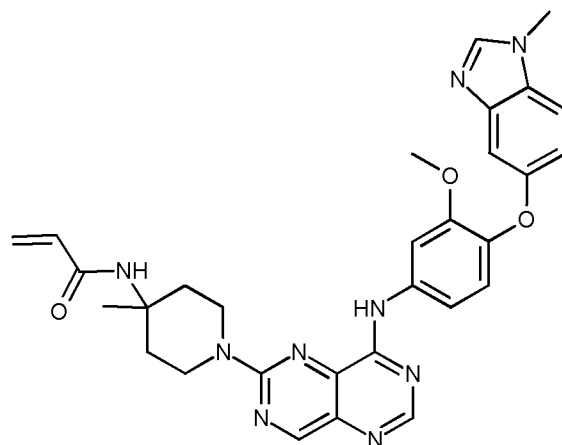
I-01.

12. Patenttivaatimuksen 1, 2, 5 tai 8 mukainen yhdiste, jolla on seuraava rakenne:



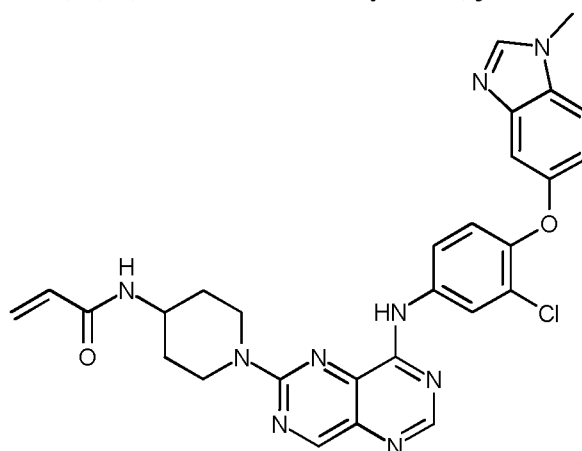
I-03.

5 13. Patenttivaatimuksen 1, 2, 5 tai 8 mukainen yhdiste, jolla on seuraava rakenne:



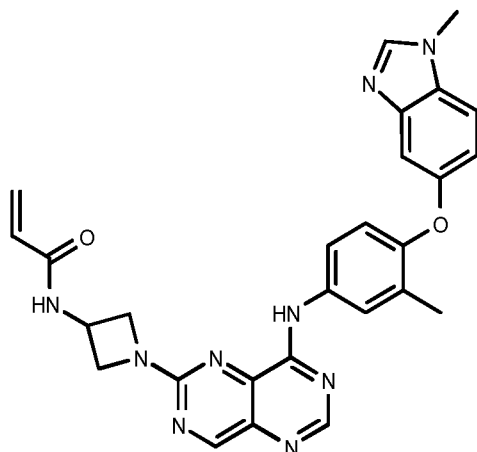
I-04.

14. Patenttivaatimuksen 1, 2, 6, 8 tai 9 mukainen yhdiste, jolla on seuraava rakenne:



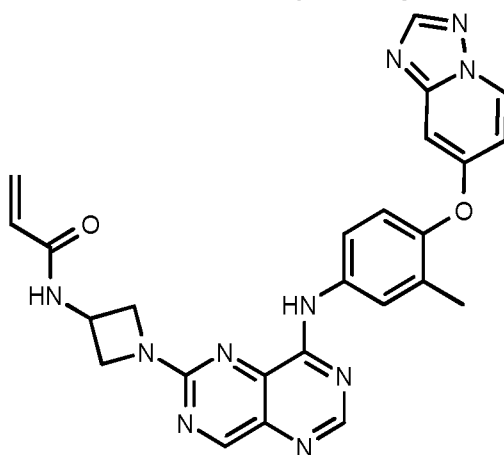
I-05.

15. Patenttivaatimuksen 1, 2, 3 tai 8 mukainen yhdiste, jolla on seuraava rakenne:



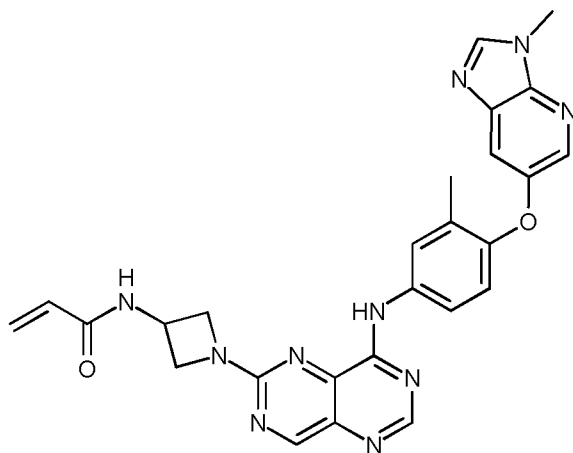
I-07.

5 16. Patenttivaatimuksen 1, 2, 3 tai 8 mukainen yhdiste, jolla on seuraava rakenne:



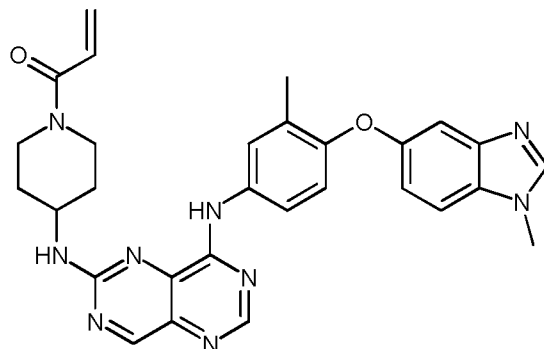
I-09.

17. Patenttivaatimuksen 1, 2, 3 tai 8 mukainen yhdiste, jolla on seuraava rakenne:



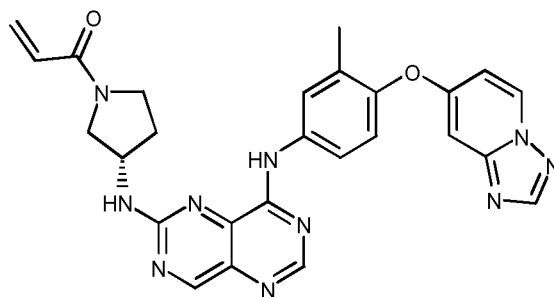
I-13.

18. Patenttivaatimuksen 1, 2, 3 tai 8 mukainen yhdiste, jolla on seuraava rakenne:



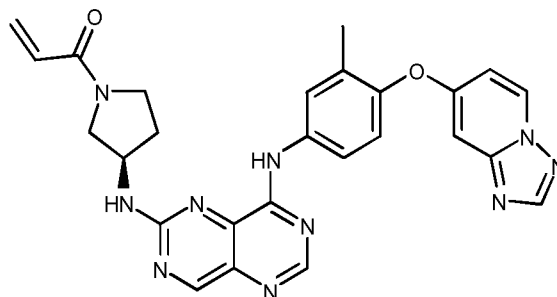
I-14.

19. Patenttivaatimuksen 1, 2, 3 tai 8 mukainen yhdiste, jolla on seuraava rakenne:



I-17.

20. Patenttivaatimuksen 1, 2, 3 tai 8 mukainen yhdiste, jolla on seuraava rakenne:



I-18.

10 21. Jossakin patenttivaatimuksista 10-20 määritellyn yhdisteen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

22. Farmaseuttinen koostumus, joka käsittää terapeuttisesti tehokkaan määrän ainakin yhtä jonkin patenttivaatimuksista 1-20 mukaista kaavan (I) mukaista yhdistettä tai sen
15 farmaseuttisesti hyväksyttävää suolaa ja yhtä tai useampaa farmaseuttisesti hyväksyttävää apuainetta.

23. Jonkin patenttivaatimuksista 1-20 mukainen yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola käytettäväksi lääkkeenä.

24. Jonkin patenttivaatimuksista 1-20 mukainen yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola käytettäväksi aivosyövän, rintasyövän, sappiteiden syövän, rakkosyövän, kohdunkaulasyövän, kolorektaalisyövän, endometriumsyövän, ihosyövän, ruokatorvikasvaimen, pään ja kaulan alueen kasvaimen, maha-suolikanavasyövän, sappirakkokasvaimen, munuaissyövän, maksasyövän, keuhkosyövän tai eturauhassyövän hoidossa.