

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

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

(10)

FI/EP3733187 T3

(12)

**EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION**

(45)

Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning -
Translation available to the public

18.12.2024

(97)

Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för
det europeiska patentet - Date of grant of European patent

16.10.2024

(51)

Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -
International patent classification
A61K 31/519 (2006 . 01)
A61K 31/52 (2006 . 01)
C07D 491/16 (2006 . 01)
C07D 491/12 (2006 . 01)
C07D 491/18 (2006 . 01)
C07D 498/18 (2006 . 01)
A61P 35/00 (2006 . 01)

(96)

Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan -
European patent application

EP20181616.2

(22)

Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date

20.07.2016

(97)

Patenttihakemuksen julkiseksitulosopäivä - Patentansökans
publiceringsdag - Patent application available to the public

04.11.2020

(30)

Etuoikeus - Prioritet - Priority

21.07.2015 US US201562195081 P

02.03.2016 US US201662302231 P

(73)

Haltija - Innehavare - Holder

1• Turning Point Therapeutics, Inc., Route 206 and Province Line Road , Princeton, NJ 08543 , (US)

(72)

Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1• CUI, Jingrong Jean , 10628 Science Center Drive, Ste. 200 , San Diego, CA California 92121 , (US)

2• LI, Yishan , 10628 Science Center Drive Ste. 200 , San Diego, CA California 92121 , (US)

3• ROGERS, Evan W. , 10628 Science Center Drive Ste. 200 , San Diego, CA California 92121 , (US)

4• ZHAI, Dayong , 10628 Science Center Drive Ste. 200 , San Diego, CA California 92121 , (US)

5• DENG, Wei , 10628 Science Center Drive Ste. 200 , San Diego, CA California 92121 , (US)

6• HUANG, Zhongdong , 10628 Science Center Drive Ste. 200 , San Diego, CA California 92121 , (US)

(74)

Asiamies - Ombud - Agent

Papula Oy , P.O.Box 981 , 00101 Helsinki , (FI)

(54)

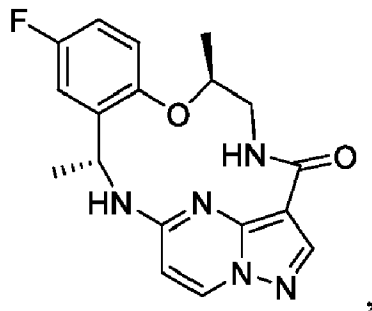
Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

KIRAALINEN DIARYYLIMAKROSYKLI JA SEN KÄYTTÖ SYÖVÄN HOIDOSSA

CHIRAL DIARYL MACROCYCLE AND USE THEREOF IN THE TREATMENT OF CANCER

PATENTTIVAATIMUKSET

1. Yhdiste (7*S*,13*R*)-11-fluoro-7,13-dimetyyli-6,7,13,14-tetrahydro-1,15-etenopyratsolo[4,3-*f*][1,4,8,10]bentsoksatriatsasyklotridesin-4(5*H*)-oni, jolla on kaava



tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, käytettäväksi potilaan syövän hoidossa, jossa syöpää välittää

- (i) geneettisesti muunnettu ALK, joka on EML4-ALK-fuusioproteiini, jolla on vähintään yksi mutaatio, joka on valittu ryhmästä, joka koostuu seuraavista: L1196M, G1202R, D1203R, L1152P/R, F1174C/L/V, C1156Y, I1171N, G1123S, S1206Y, G1269S/A ja I151T-insertio; tai
- (ii) geneettisesti muunnettu ALK, joka on TPR-ALK-fuusioproteiini, jolla on L1196M-pistemutaatio; tai
- (iii) geneettisesti muunnettu ALK, jolla on yksi tai useampi pistemutaatio, joka on valittu ryhmästä, joka koostuu seuraavista: R1050H, F1174C/I/L/S/V, F1245C/I/L/V, R1275L/Q, T1151M, M1166R, I1170N, I1170S, I1171N, I1183T, L1196M, A1200V, L1204F, L1240V, D1270G, Y1278S, R1192P, G1128A, G1286R ja T1343I; tai
- (iv) LMNA-TRKA-fuusioproteiini; tai
- (v) QKI-TRKB- tai ETV6-TRKB-fuusioproteiini; tai
- (vi) ETV6-TRKC-fuusioproteiini.

2. Yhdiste käytettäväksi patenttivaatimuksen 1 mukaisesti, jossa geneettisesti muunnettu ALK on EML4-ALK-fuusioproteiini, jolla on vähintään yksi mutaatio, joka on valittu ryhmästä, joka koostuu seuraavista:

L1196M, G1202R, D1203R, L1152P/R, F1174C/L/V, C1156Y, I1171N, G1123S, S1206Y, G1269S/A ja 1151T-insertio.

3. Yhdiste käytettäväksi patenttivaatimuksen 1 mukaisesti, jossa geneettisesti muunnettu ALK on EML4-
5 ALK-fuusioproteiini, jolla on vähintään yksi mutaatio, joka on valittu ryhmästä, joka koostuu seuraavista: L1196M, G1202R, L1152P/R, F1174C/L, C1156Y, G1269S ja 1151T-insertio.

4. Yhdiste käytettäväksi patenttivaatimuksen 1
10 mukaisesti, jossa geneettisesti muunnettu ALK on TPR-ALK-fuusioproteiini, jolla on L1196M-pistemutaatio.

5. Yhdiste käytettäväksi patenttivaatimuksen 1 mukaisesti, jossa geneettisesti muunnetulla ALK:lla on yksi tai useampi pistemutaatio, joka on valittu ryhmästä,
15 joka koostuu seuraavista: R1050H, F1174C/I/L/S/V, F1245C/I/L/V, R1275L/Q, T1151M, M1166R, I1170N, I1170S, I1170N, I1171N, I1183T, L1196M, A1200V, L1204F, L1240V, D1270G, Y1278S, R1192P, G1128A, G1286R ja T1343I.

20 6. Yhdiste käytettäväksi patenttivaatimuksen 1 mukaisesti, jossa geneettisesti muunnetulla ALK:lla on yksi tai useampi pistemutaatio, joka on valittu ryhmästä, joka koostuu seuraavista: F1174S, R1275Q ja T1151M.

25 7. Yhdiste käytettäväksi patenttivaatimuksen 1 mukaisesti, jossa syöpää välittää LMNA-TRKA-fuusioproteiini.

8. Yhdiste käytettäväksi patenttivaatimuksen 1 mukaisesti, jossa syöpää välittää LMNA-TRKA-fuusioproteiini,
30 joka käsittää G595R-pistemutaation.

9. Yhdiste käytettäväksi patenttivaatimuksen 1 mukaisesti, jossa syöpää välittää QKI-TRKB- tai ETV6-TRKB-fuusioproteiini.

10. Yhdiste käytettäväksi patenttivaatimuksen
35 1 mukaisesti, jossa syöpää välittää ETV6-TRKB-fuusioproteiini.

11. Yhdiste käytettäväksi patenttivaatimuksen 1 mukaisesti, jossa syöpää välittää ETV6-TRKB-fuusio-proteiini, joka käsittää G639R-pistemutaation.

12. Yhdiste käytettäväksi patenttivaatimuksen 5 1 mukaisesti, jossa syöpää välittää ETV6-TRKC-fuusio-proteiini.

13. Yhdiste käytettäväksi patenttivaatimuksen 1 mukaisesti, jossa syöpää välittää ETV6-TRKC-fuusio-proteiini, joka käsittää G623R-pistemutaation.

10 14. Yhdiste käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksista 1-13 mukaisesti, jossa syöpä on valittu ryhmästä, joka koostuu anaplastisesta suurisoluisesta lymfoomasta (ALCL), ei-pienisoluisesta keuhkosyövästä (NSCLC), neuroblastoomasta, tulehduksellisesta myofibroblastisesta kasvaimesta, aikuisten munuaissolusyövästä, lasten munuaissolusyövästä, rintasyövästä, paksusuolen adenokarsinoomasta, glioblastoomasta, glioblastooma multiformesta ja anaplastisesta kilpirauhassyövästä.

20 15. Yhdiste käytettäväksi patenttivaatimuksen 14 mukaisesti, jossa syöpä on ei-pienisoluinen keuhkosyöpä (NSCLC).

16. Yhdiste käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksista 1-15 mukaisesti, jossa yhdisteellä on kaava:

