

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

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

(10)

FI/EP3862003 T3

(12)

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

(45)

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

28.12.2023

(97)

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

25.10.2023

(51)

Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -
International patent classification

A61K 31/7034 (2006 . 01)

A61K 31/198 (2006 . 01)

A61K 31/351 (2006 . 01)

A61K 31/401 (2006 . 01)

A61K 38/28 (2006 . 01)

A61K 9/08 (2006 . 01)

A61P 25/00 (2006 . 01)

A61P 29/00 (2006 . 01)

A61P 43/00 (2006 . 01)

A61P 3/00 (2006 . 01)

A61P 3/10 (2006 . 01)

A61P 5/50 (2006 . 01)

A61P 9/10 (2006 . 01)

(96)

Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan -
European patent application

EP21155065.2

(22)

Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date

15.12.2014

(97)

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

11.08.2021

(30)

Etuoikeus - Prioritet - Priority

17.12.2013 EP EP13197821

01.10.2014 EP EP14187228

(73)

Haltija - Innehavare - Holder

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

(72)

Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1• REICHE, Daniela, Birte, Boehringer Ingelheim International GmbH, Corporate Patents Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, (DE)

2• HAAG-DIERGARTEN, Silke, Boehringer Ingelheim International GmbH, Corporate Patents Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, (DE)

3• HENNINGS, Leah, Jeanette, Boehringer Ingelheim Corporation 900 Ridgebury Road, Ridgefield, Connecticut, 06877-0368, (US)

4• KLEY, Saskia, Boehringer Ingelheim International GmbH, Corporate Patents Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, (DE)

5• TRAAS, Anna Michelle, Boehringer Ingelheim Corporation 900 Ridgebury Road, Ridgefield, Connecticut, 06877-0368, (US)

(74)

Asiamies - Ombud - Agent

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

(54)

Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

SGLT-2-ihibiittori käytettäväksi aineenvaihdutahäiriön hoidossa kissaeläimillä

AN SGLT-2 INHIBITOR FOR USE IN THE TREATMENT OF A METABOLIC DISORDER IN FELINE ANIMALS

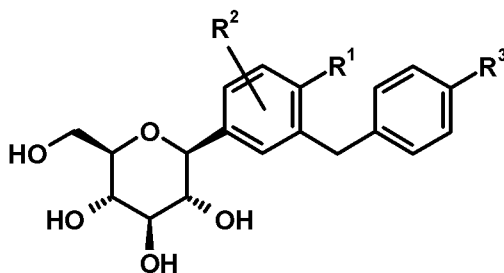
Patenttivaatimukset

1. Yksi tai useampi SGLT-2-inhibiittori tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä ki-
 demuoto käytettäväksi aineenvaihduntahäiriön hoidossa ja/tai ehkäisyssä
 5 kissaeläimellä, joka tarvitsee tällaista hoitoa ja/tai ehkäisyä, jolloin aineen-
 vaihduntahäiriö on yksi tai useampi valittu ryhmä, johon kuuluvat keto-
 asidoosi, esidiabetes, tyypin 1 tai tyypin 2 diabetes mellitus, insuliiniresis-
 tenssi, liikalihavuus, hyperglykemia, heikentynyt glukoositoleranssi, hyperin-
 sulinemia, dyslipidemia, dysadipokinemia, subkliininen tulehdus, systeeminen
 10 tulehdus, matala-asteinen systeeminen tulehdus, maksan lipidoosi, atero-
 skleroosi, haimatulehdus ja/tai oireyhtymä X (metabolinen oireyhtymä)
 ja/tai haiman beetasolujen toiminnan menetys ja jossa yhtä tai useampaa
 SGLT-2-estäjää tulee antaa annoksena 0,1–5,0 mg/kg ruumiinpainoa kohden
 päivässä.
2. Yksi tai useampi SGLT2-inhibiittori tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä ki-
 teinen muoto käytettäväksi patenttivaatimuksen 1 mukaisesti, jolloin aineen-
 vaihduntahäiriö on diabetes, edullisesti esidiabetes, tyypin 1 diabetes melli-
 tus tai tyypin 2 diabetes mellitus ja/tai diabetekseen liittyvät kliiniset tilat,
 20 edullisesti esidiabetes, diabetes mellitus tyyppi 1 tai diabetes mellitus tyyppi
 2, jolloin mainittu kliininen tila on yksi tai useampi tila, joka valitaan ke-
 toasidoosista, insuliiniresistenssistä, liikalihavuudesta, hyperglykemiasta, hei-
 kentyneestä glukoositoleranssista, hyperinsulinemiasta, dyslipidemiasta,
 dysadipokinemiasta, subkliinisestä tulehduksesta, systeemisestä tulehduksesta,
 25 matala-asteinen systeeminen tulehdus, maksan lipidoosi, ateroskleroosi,
 haimatulehdus, neuropatia ja/tai oireyhtymä X (metabolinen oireyhtymä)
 ja/tai haiman beetasolujen toiminnan menetys.
3. Yksi tai useampi SGLT2-inhibiittori tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä ki-
 teinen muoto käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksen 1–2 mukaisesti, jol-
 30 loin metabolisen häiriön remissio saavutetaan ja/tai ylläpidetään.
4. Yksi tai useampi SGLT2-inhibiittori tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä ki-
 teinen muoto käytettäväksi patenttivaatimuksen 2 mukaisesti, jolloin diabe-
 35 teksen hoito eliminoi omistajan havaitsemat oireet, jotka on edullisesti valittu

joukosta, joka koostuu letargiasta, polyuriasta, polydipsiasta, painon laskusta, polyfagia, joka ilmenee hoitamattomien eläinten hyperglykemian seurauksena.

5. Yksi tai useampi SGLT2-inhibiittori tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä kiteinen muoto käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksista 1–4 mukaisesti, jolloin yksi tai useampi SGLT-2-inhibiittori on valittu joukosta, joka koostuu seuraavista yhdisteistä tai niiden farmaseuttisesti hyväksyttävistä kiteisistä muodoista:

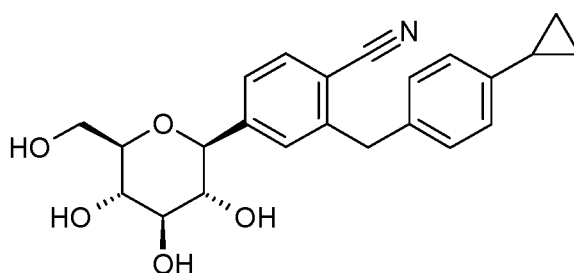
- (1) kaavan (1) mukainen glukopyranosyylisubstituoitu bentseenijohdannainen



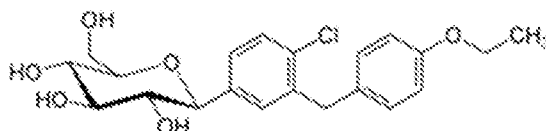
- jossa R¹ on syaani, Cl tai metyyli;
 R² on H, metyyli, metoksi tai hydroksyyli; ja
 R³ tarkoittaa syklopropyyliä, vetyä, fluoria, klooria, bromia, jodia, metyyliä, etyyliä, propyyliä, isopropyyliä, butyyliä, sek-butyylä, isobutyylä, tert-butyylä, 3-metyylibut-1-yyliä, syklobutyylä, syklopentyylä, sykloheksyyli, 1-hydroksi-syklopropyyli, 1-hydroksi-syklobutyylä, 1-hydroksi-syklopentyyli, 1-hydroksi-sykloheksyyli, etinyyli, etoksi, difluorimetyyli, trifluorimetyyli, pentafluorietyyli, 2-hydroksi-etyyli, hydroksimetyyli, 3-hydroksi-propyyli 2-hydroksi-2-metyyliprop-1-yyli, 3-hydroksi-3-metyylibut-1-yyli, 1-hydroksi-1-metyylietyyli, 2,2,2-trifluori-1-hydroksi- 1-metyylietyyli, 2,2,2-trifluori-1-hydroksi-1-trifluorimetyylietyyli, 2-metoksietyyli, 2-etoksietyyli, hydroksi, difluorimetyylioksi, trifluorimetyylioksi, 2-metyylioksietyylioksi, metyyliulfanyyli, metyyliulfinyyli, metyyliulfonyyli, etyyliulfinyyli, etyyliulfonyyli, trimetyylisilyyli, (R)-

tetrahydrofuran-3-yylioksi tai (S)-tetrahydrofuran-3-yylioksi tai syaani,
tai sen johdannainen, jossa yksi tai useampi β -D-glukopyranosyyli-ryhmän hydroksyyli-ryhmä on asyloitu ryhmillä, jotka on valittu (C_{1-18} -alkyyli)karbonyylistä, (C_{1-18} -alkyyli)oksikarbonyylistä, fenyylikarbonyylistä ja fenyyli-(C_{1-3} -alkyyli)-karbonyyli;

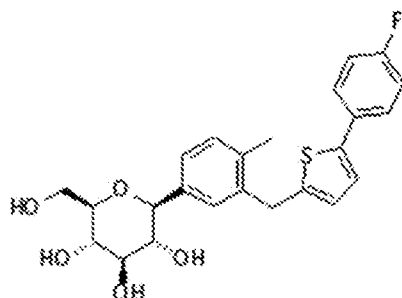
- (2) 1-syano-2-(4-syklopropyylibentsyyli)-4-(p-D-glukopyranoosi-1-yyli)bentseeni, esitetty kaavalla (2):



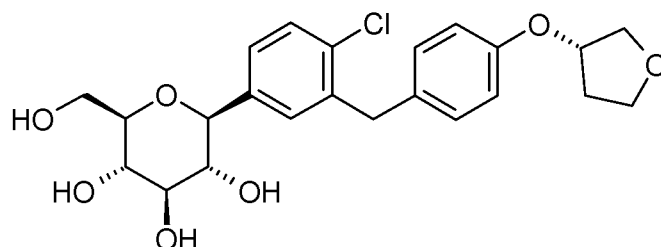
- (3) Dapagliflotsiini, esitetty kaavalla (3):



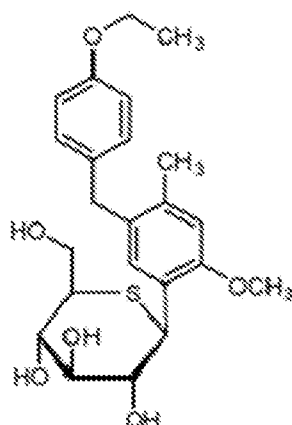
- (4) Kanagliflotsiini, esitetty kaavalla (4):



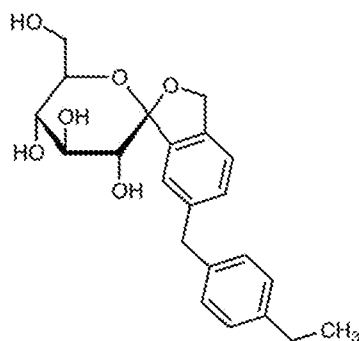
- (5) Empagliflotsiini, esitetty kaavalla (5):



(6) Luseogliflotsiini, esitetty kaavalla (6):

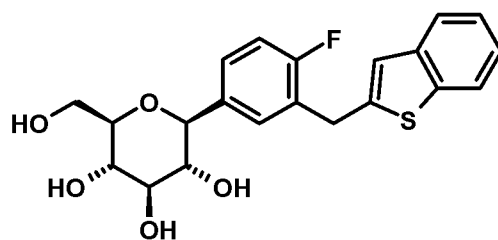


(7) Tofogliflotsiini, esitetty kaavalla (7):



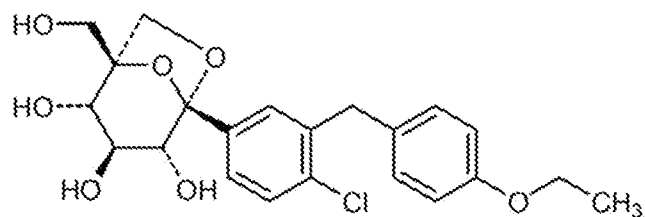
5

(8) Ipragliflotsiini, esitetty kaavalla (8):

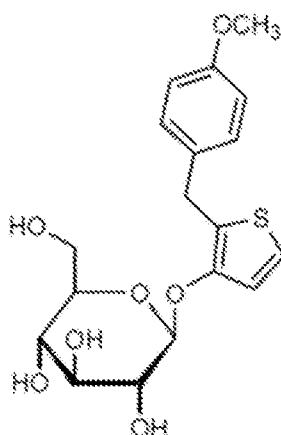


10

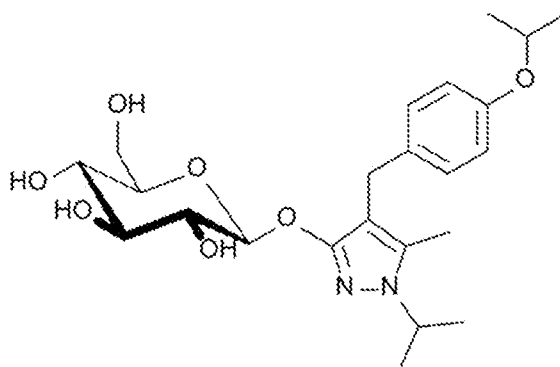
(9) Ertugliflotsiini, esitetty kaavalla (9):



(10) Atigliflotsiini, esitetty kaavalla (10):

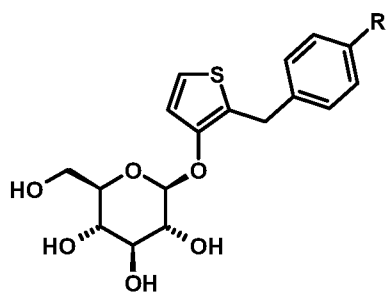


(11) Remogliflotsiini, esitetty kaavalla (11):



5

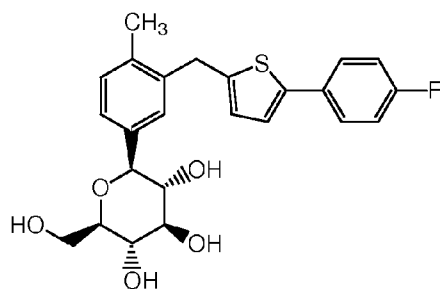
(12) kaavan (12) mukainen tiofeenijohdannainen



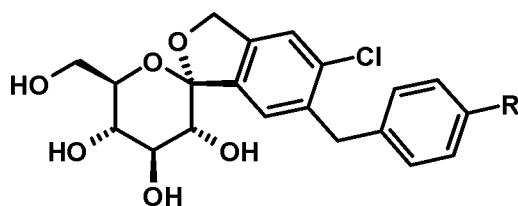
jossa R on metoksi tai trifluorimetoksi;

(13) 1-(β -D-glukopyranosyyli)-4-metyyli-3-[5-(4-fluorifenyyli)-2-tienyyli-metyyli]bentseeni;
esitetty kaavalla (13);

10

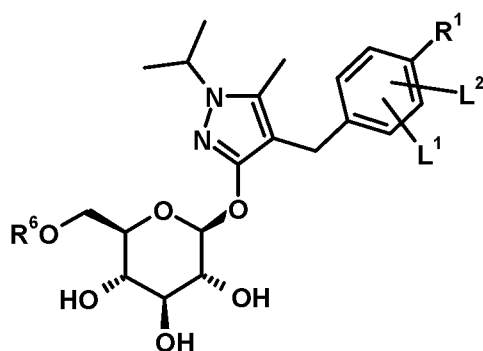


(14) kaavan (14) mukainen spiroketaalijohdannainen:



5 jossa R on metoksi, trifluorimetoksi, etoksi, etyyli, isopropyli tai tert. butyyli;

(15) kaavan (15) mukainen pyratsoli-O-glukosidijohdannainen



10 jossa

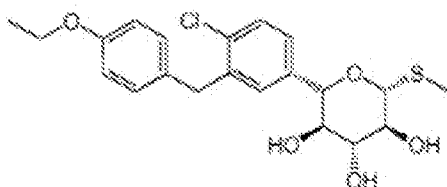
R¹ tarkoittaa C₁₋₃-alkoksia,

L₁, L₂ ovat toisistaan riippumatta H tai F,

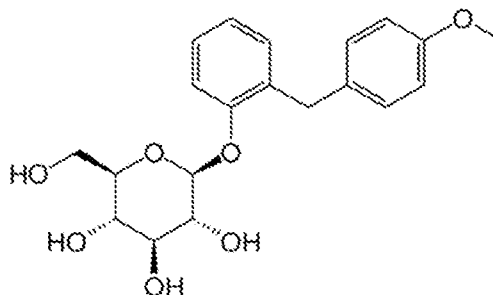
R⁶ on H, (C₁₋₃-alkyyli)karbonyyli, (C₁₋₆-alkyyli)oksikarbonyyli, fenyylioksikarbonyyli, bentsyylioksikarbonyyli tai bentsyylikarbonyyli;

15

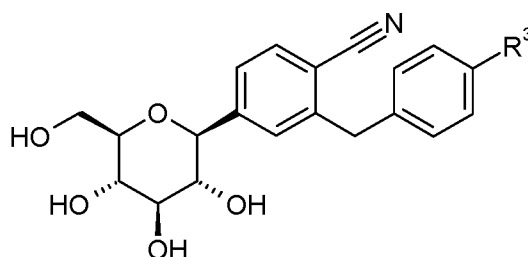
(16) kaavan (16) mukainen yhdiste:



- (17) Sergliflotsiini, jota edustaa kaava (17):



- (18) yhdiste, jota edustaa kaava (18):

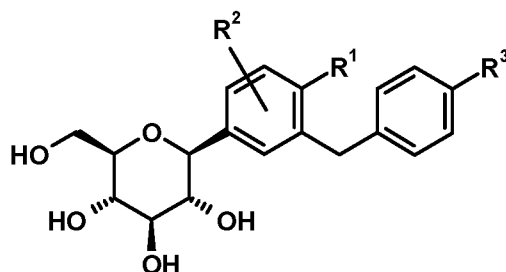


jossa:

R³ on valittu joukosta syklopropyyli, etyyli, etinyyli, etoksi, (*R*)-tetrahydrofuran-3-yylioksi tai (*S*)-tetrahydrofuran-3-yylioksi.

6. Yksi tai useampi SGLT2-inhibiittori tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä ki-demuoto käytettäväksi patenttivaatimuksen 5 mukaisesti, jolloin yksi tai use-ampi SGLT-2-inhibiittori on valittu joukosta, joka koostuu seuraavista yhdis-teistä tai niiden farmaseuttisesti hyväksyttävistä kiteisistä muodoista:

- (1) kaavan (1) mukainen glukopyranosyyლისubstituoitu bentseenijohdan-nainen



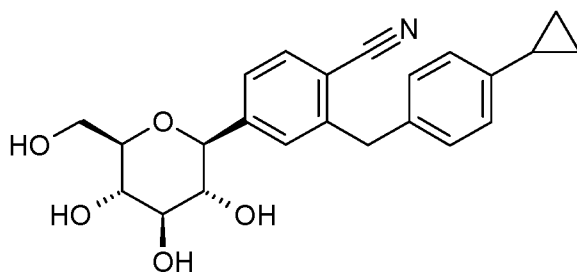
jossa R¹ on syaani, Cl tai metyyli;

R² on H, metyyli, metoksi tai hydroksyyli; ja

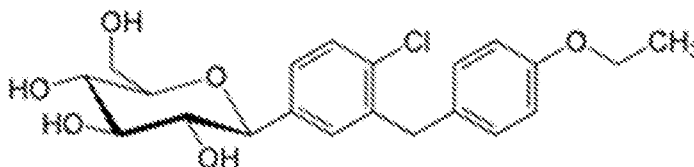
R³ tarkoittaa syklopropyyliä, vetyä, fluoria, klooria, bromia, jodia, metyyliä, etyyliä, propyyliä, isopropyyliä, butyyliä, sek-butyliä,

isobutyylä, tert-butyylä, 3-metyylibut-1-yyliä, syklobutyylä, syklopentyylä, sykloheksyyli, 1-hydroksi-syklopropyyli, 1-hydroksi-syklobutyylä, 1-hydroksi-syklopentyylä, 1-hydroksi-sykloheksyyli, etinyyli, etoksi, difluorimetyyli, trifluorimetyyli, pentafluorietyyli, 2-hydroksi-etyyli, hydroksimetyyli, 3-hydroksi-propyyli 2-hydroksi-2-metyyliprop-1-yyli, 3-hydroksi-3-metyylibut-1-yyli, 1-hydroksi-1-metyylietyyli, 2,2,2-trifluori-1-hydroksi- 1-metyylietyyli, 2,2,2-trifluori-1-hydroksi-1-trifluorimetyylietyyli, 2-metoksietyyli, 2-etoksietyyli, hydroksi, difluorimetyylioksi, trifluorimetyylioksi, 2-metyylioksietyylioksi, metyyliulfanyyli, metyyliulfinyyli, metyyliulfonyyli, etyyliulfinyyli, etyyliulfonyyli, trimetyylisilyyli, (*R*)-tetrahydrofuran-3-yylioksi tai (*S*)-tetrahydrofuran-3-yylioksi tai syaani, tai sen johdannainen, jossa yksi tai useampi β -D-glukopyranosyyli-ryhmän hydroksyyli-ryhmä on asyloitu ryhmällä, jotka on valittu (C_{1-18} -alkyyli)karbonyylistä, (C_{1-18} -alkyyli)oksikarbonyylistä, fenyylikarbonyylistä ja fenyyli-(C_{1-3} -alkyyli)-karbonyyli;

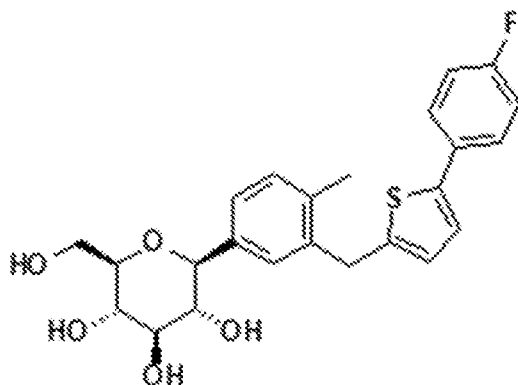
- (2) 1-syaani-2-(4-syklopropyylibentsyyli)-4-(p-D-glukopyranos-1-yyli)bentseeni, esitetty kaavalla (2):



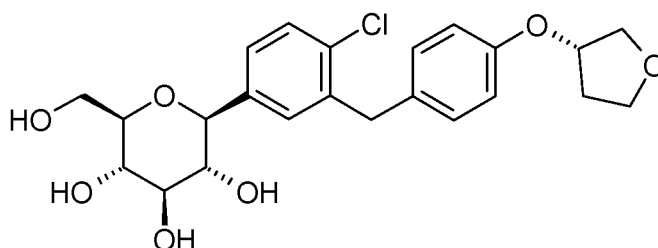
- (3) Dapagliflotsiini, esitetty kaavalla (3):



- (4) Kanagliflotsiini, esitetty kaavalla (4):

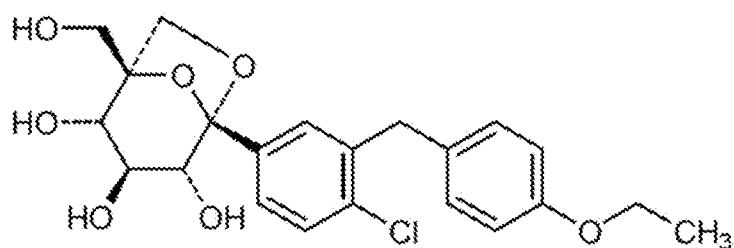


- (5) Empagliflotsiini, esitetty kaavalla (5):

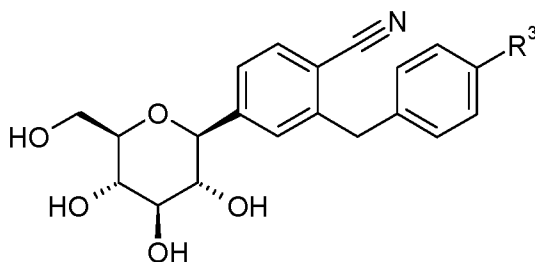


5

- (9) Ertugliflotsiini, esitetty kaavalla (9):



- (18) yhdiste, esitetty kaavalla (18):



jossa:

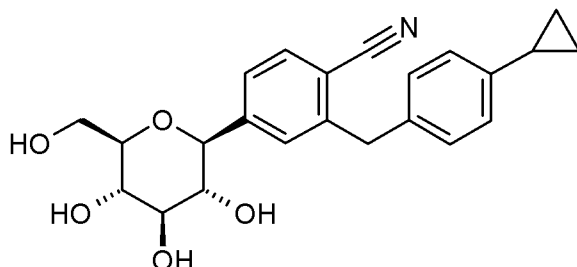
10

R³ on valittu joukosta syklopropyyli, etyyli, etinyyli, etoksi, (*R*)-tetrahydrofuran-3-yylioksi tai (*S*)-tetrahydrofuran-3-yylioksi.

7. Yksi tai useampi SGLT2-inhibiittori tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä ki-demuoto käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksista 5-6 mukaisesti, jolloin

yksi tai useampi SGLT-2-inhibiittori tai farmaseuttisesti hyväksyttävä kide-
muoto on:

- (2) 1-syaani-2-(4-syklopropyylibentsyyli)-4-(p-D-glukopyranos-1-
yyli)bentseeni, esitetty kaavalla (2):



5

8. Yksi tai useampi SGLT2-inhibiittori tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä ki-
demuoto käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksen 1–7 mukaisesti, jolloin
kissaeläin on lihava.

10

9. Yksi tai useampi SGLT2-inhibiittori tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä ki-
demuoto käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksen 1–8 mukaisesti, jolloin
kissaeläin kärsii diabeteksesta, edullisesti esidiabeteksesta tai tyypin 2 diabe-
tes mellituksesta.

15

10. Yksi tai useampi SGLT2-inhibiittori tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä ki-
teinen muoto käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksen 1–9 mukaisesti, jol-
loin kissaeläin on kissa.

20

11. Yksi tai useampi SGLT2-inhibiittori tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä ki-
demuoto käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksista 1–10 mukaisesti, jolloin
sen farmaseuttisesti hyväksyttävä kide- tai kiteinen muoto on kiteinen kompleksi yhden tai
useamman SGLT2-estäjän tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävän muodon ja
yhden tai useamman aminohapon, edullisesti proliinin, edullisemmin L-
proliinin välillä.

25

12. Yksi tai useampi SGLT2-inhibiittori tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä ki-
demuoto käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksen 1–11 mukaisesti, jolloin
yksi tai useampi SGLT-2-inhibiittori on tarkoitettu annettavaksi oraalisesti tai
parenteraalisesti, edullisesti oraalisesti.

30

13. Yksi tai useampi SGLT2-inhibiittori tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä kide-
muoto käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksen 1–12 mukaisesti, jolloin
yksi tai useampi SGLT-2-inhibiittori annetaan vain kerran päivässä.
- 5
14. Yksi tai useampi SGLT2-inhibiittori tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä ki-
demuoto käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksista 1–13 mukaisesti, jolloin
yksi tai useampi SGLT-2-inhibiittori annetaan yhdistelmänä insuliinin kanssa.
- 10
15. Farmaseuttinen koostumus, joka sisältää yhtä tai useampaa SGLT2-
inhibiittoria tai sen farmaseuttisesti hyväksyttäviä kide-
muotoja vaikuttavina
aineosina jonkin patenttivaatimuksen 1–14 mukaisesti käytettäväksi jonkin
patenttivaatimuksen 1–14 mukaisesti.