

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

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

(10)

FI/EP4065582 T3

(12)

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

- (45) Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning - **25.05.2025**
Translation available to the public
- (97) Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för
det europeiska patentet - Date of grant of European patent **19.02.2025**
- (51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -
International patent classification
C07D 487/04 (2006 . 01)
A61K 31/5365 (2006 . 01)
A61P 35/00 (2006 . 01)
- (96) Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan - **EP20828454.7**
European patent application
- (22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date **25.11.2020**
- (97) Patenttihakemuksen julkiseksitulosopäivä - Patentansökans
publiceringsdag - Patent application available to the public **05.10.2022**
- (86) Kansainvälinen hakemus - Internationell **25.11.2020 PCT/US2020062197**
ansökan - International application
- (30) Etuoikeus - Prioritet - Priority
26.11.2019 US US201962940481 P

(73)

Haltija - Innehavare - Holder

1• Ikena Oncology, Inc., 645 Summer Street Suite 101 , Boston, Massachusetts 02210 , (US)

(72)

Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1• CASTRO, Alfredo C., c/o Ikena Oncology, Inc. 50 Northern Avenue , Boston, Massachusetts 02210 , (US)

2• NOLAN, III, James Martin, c/o Ikena Oncology, Inc. 50 Northern Avenue , Boston, Massachusetts 02210 , (US)

3• BETHUNE, Sarah Jean, c/o Avista Pharma Solutions, Inc., d/b/a Cambrex 3501 Tricenter Blvd. Suite C , Durham, North Carolina 27713 , (US)

4• FOLBERTH, Corinne Marie, c/o Avista Pharma Solutions, Inc., d/b/a Cambrex 3501 Tricenter Blvd. Suite C , Durham, North Carolina 27713 ,
(US)

(74)

Asiamies - Ombud - Agent

Budde Schou A/S, Dronningens Tværgade 30 , 1302 Copenhagen K , (DK)

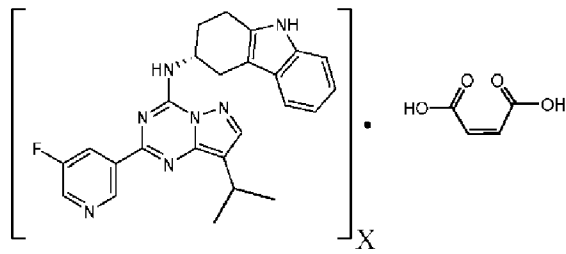
(54)

Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

POLYMORFISIA KARBATSOLIJOHDANNAISIA JA NIIDEN KÄYTTÖTAPOJA
POLYMORPHIC CARBAZOLE DERIVATIVES AND USES THEREOF

Patenttivaatimukset

1. Yhdisteen **2** kiinteä muoto:



2

jossa $1 \leq x \leq 2$, ja jolloin mainittu yhdiste on kiteinen.

2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, jossa mainittu yhdiste on kiteinen kiinteä aine, jossa ei ole olennaisesti lainkaan amorfista yhdistettä **2**.

3. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, jolloin mainitussa yhdisteessä ei ole olennaisesti lainkaan epäpuhtauksia.

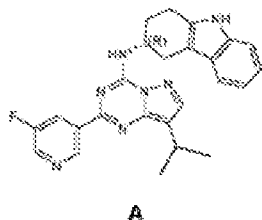
4. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, jonka XRPD:ssä on yksi tai useampi piikki, joka on valittu piikeistä, joiden asema on 5,3, 11,3 ja 16,0 2-theeta-astetta $\pm 0,2$ astetta.

5. Patenttivaatimuksen 4 mukainen yhdiste, jonka XRPD:ssä on vähintään kaksi piikkiä, jotka on valittu piikeistä, joiden asema on 5,3, 11,3 ja 16,0 2-theeta-astetta $\pm 0,2$ astetta.

6. Patenttivaatimuksen 5 mukainen yhdiste, jolloin mainittu yhdiste on muodossa A ja jossa x on 2.

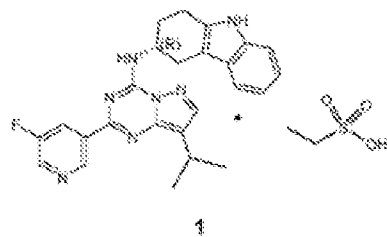
7. Yhdiste, joka valitaan seuraavista:

Yhdiste A



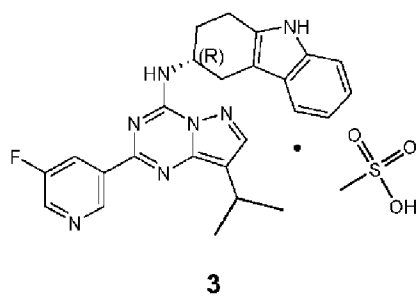
muodossa B tai muodossa C;

Yhdiste 1:



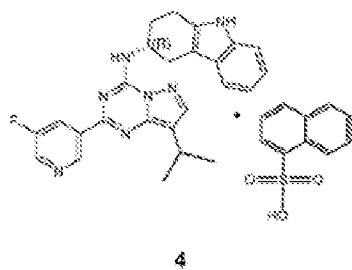
muodossa A tai muodossa B;

Yhdiste 3:



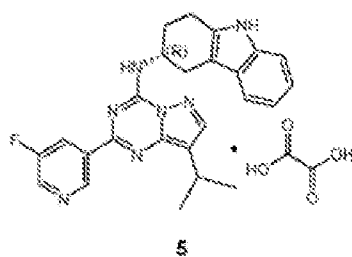
muodossa A tai muodossa B;

Yhdiste 4:



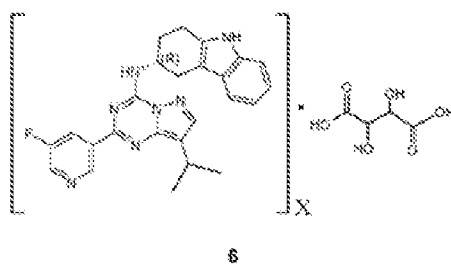
muodossa A;

Yhdiste 5:



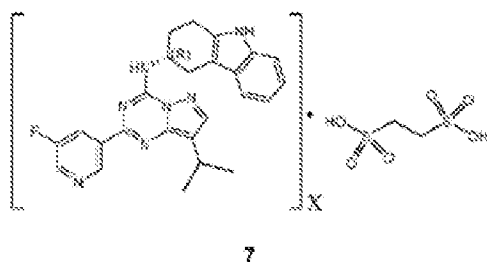
muodossa A;

Yhdiste 6:



muodossa A tai muodossa B, jossa $1 \leq x \leq 2$; tai

Yhdiste 7:



muodossa A, jossa $1 \leq x \leq 2$,
jolloin

yhdisteen A muoto B on **tunnettu siitä, että** sillä on röntgenjauhediffraktiokuviossaan yksi tai useampi piikki, joka on valittu piikeistä, jotka ovat 9,5, 9,8 ja 14,7 2-theeta-asteen $\pm 0,2$ asteen asemassa;

yhdisteen A muoto C on **tunnettu siitä, että** sillä on röntgenjauhediffraktiokuviossaan yksi tai useampi piikki, joka on valittu piikeistä, jotka ovat 6,02, 8,61 ja 10,29 2-theeta-asteen $\pm 0,2$ asteen asemassa;

yhdisteen 1 muoto A on **tunnettu siitä, että** sillä on röntgenjauhediffraktiokuviossaan yksi tai useampi piikki, joka on valittu piikeistä, jotka ovat 5,8, 11,6 ja 18,8 2-theeta-asteen $\pm 0,2$ asteen asemassa;

yhdisteen 1 muoto B on **tunnettu siitä, että** sillä on röntgenjauhediffraktiokuviossaan yksi tai useampi piikki, joka on valittu piikeistä, jotka ovat 5,6, 11,2 ja 16,9 2-theeta-asteen $\pm 0,2$ asteen asemassa;

yhdisteen 3 muoto A on **tunnettu siitä, että** sillä on röntgenjauhediffraktiokuviossaan yksi tai useampi piikki, joka on valittu piikeistä, jotka ovat 5,6, 11,2 ja 16,9 2-theeta-asteen $\pm 0,2$ asteen asemassa;

yhdisteen 3 muoto B on **tunnettu siitä, että** sillä on röntgenjauhediffraktiokuviossaan yksi tai useampi piikki, joka on valittu piikeistä, jotka ovat 6,0, 12,1 ja 18,1 2-theeta-asteen $\pm 0,2$ asteen asemassa;

yhdisteen 4 muoto A on **tunnettu siitä, että** sillä on röntgenjauhediffraktiokuviossaan yksi tai useampi piikki, joka on valittu piikeistä, jotka ovat 7,5, 8,4 ja 20,1 2-theeta-asteen $\pm 0,2$ asteen asemassa;

yhdisteen 5 muoto A on **tunnettu siitä, että** sillä on röntgenjauhediffraktiokuviossaan yksi tai useampi piikki, joka on valittu piikeistä, jotka ovat 6,4, 7,1 ja 12,7 2-theeta-asteen $\pm 0,2$ asteen asemassa;

yhdisteen 6 muoto A on **tunnettu siitä, että** sillä on röntgenjauhediffraktiokuviossaan yksi tai useampi piikki, joka on valittu piikeistä, jotka ovat 5,5, 11,1 ja 18,9 2-theeta-asteen $\pm 0,2$ asteen asemassa;

yhdisteen 6 muoto B on **tunnettu siitä, että** sillä on röntgenjauhediffraktiokuviossaan yksi tai useampi piikki, joka on valittu piikeistä, jotka ovat 6,2, 6,8 ja 13,5 2-theeta-asteen $\pm 0,2$ asteen asemassa;

yhdisteen 7 muoto A on **tunnettu siitä, että** sillä on röntgenjauhediffraktiokuviossaan yksi tai useampi piikki, joka on valittu piikeistä, jotka ovat 6,6, 10,4 ja 13,2 2-theta-asteen $\pm 0,2$ asteen asemassa.

8. Farmaseuttisesti hyväksyttävä koostumus, joka käsittää jonkin patenttivaatimuksen 1–7 mukaista yhdistettä ja farmaseuttisesti hyväksyttävää kantoainetta, apuainetta tai vehikkeliä.

9. Menetelmä AHR:n estämiseksi biologisessa näytteessä, jolloin menetelmä käsittää biologisen näytteen saattamisen kosketuksiin jonkin patenttivaatimuksen 1–7 mukaisen yhdisteen tai sen koostumuksen kanssa.

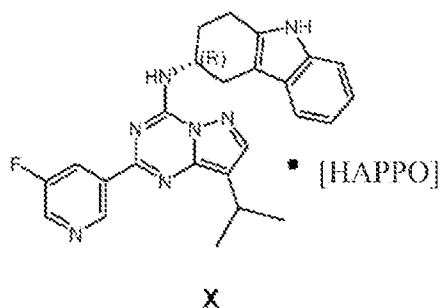
10. Jonkin patenttivaatimuksen 1–7 mukainen yhdiste tai sen koostumus käytettäväksi menetelmässä AHR-välitteisen häiriön hoitamiseksi sitä tarvitsevilla potilaalla.

11. Patenttivaatimuksen 10 mukaisesti käytettävä yhdiste tai koostumus, jolloin AHR:n välittämä sairaus on syöpä tai tulehdushäiriö.

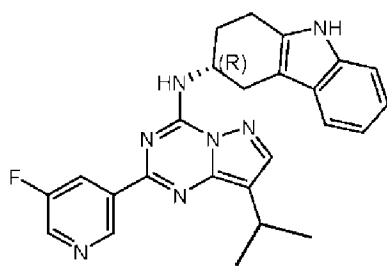
12. Patenttivaatimuksen 10 tai 11 mukaisesti käytettävä yhdiste tai koostumus, jolloin yhdiste tai sen koostumus annetaan suun kautta, jolloin valinnaisesti yhdistettä tai sen koostumusta annetaan 0,01–100 mg potilaan painokiloa kohti.

13. Jonkin patenttivaatimuksen 10–12 mukaisesti käytettävä yhdiste tai koostumus, joka käsittää lisäksi muun terapeuttisen aineen antamisen potilaalle.

14. Menetelmä sellaisen suolayhdisteen valmistamiseksi, jolla on kaava **X**:



jolloin se käsittää vaiheet, joissa yhdistetään **A**:



A

hapon ja valinnaisesti liuottimen kanssa olosuhteissa, joissa muodostuu kaavan **X** mukaista suolayhdistettä, jolloin

(a) sopiva happo on metaanisulfonihappo, joka muodostaa siten yhdisteen **A** mesylaattisuolan, ja mainittu mesylaattisuola kiteytetään patenttivaatimuksen 7 mukaisen muodon A tai muodon B muodostamiseksi

(b) sopiva happo on etaanisulfonihappo, joka muodostaa siten yhdisteen **A** esylaattisuolan, ja mainittu esylaattisuola kiteytetään patenttivaatimuksen 7 mukaisen muodon A tai muodon B muodostamiseksi

(c) sopiva happo on naftaleenisulfonihappo, joka muodostaa siten yhdisteen **A** napsylaattisuolan, ja mainittu napsylaattisuola kiteytetään patenttivaatimuksen 7 mukaisen muodon A muodostamiseksi

(d) sopiva happo on viinihappo, joka muodostaa siten yhdisteen **A** tartraattisuolan, ja mainittu tartraattisuola kiteytetään patenttivaatimuksen 7 mukaisen muodon A tai muodon B muodostamiseksi

(e) sopiva happo on oksaalihappo, joka muodostaa siten yhdisteen **A** oksalaattisuolan, ja mainittu oksalaattisuola kiteytetään patenttivaatimuksen 7 mukaisen muodon A muodostamiseksi

(f) sopiva happo on etaanidisulfonihappo, joka muodostaa siten yhdisteen **A** edisylaattisuolan, ja mainittu edisylaattisuola kiteytetään patenttivaatimuksen 7 mukaisen muodon A muodostamiseksi; tai

(g) sopiva happo on maleiinihappo, joka muodostaa siten yhdisteen **A** maleaattisuolan, ja mainittu maleaattisuola kiteytetään patenttivaatimuksen 6 mukaisen muodon A muodostamiseksi.