

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

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

(10)

FI/EP3242666 T3

(12)

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

(45)

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

16.12.2024

(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 31/473 (2006 . 01)
A61P 37/00 (2006 . 01)
A61P 29/00 (2006 . 01)

(96)

Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan -
European patent application

EP16700936.4

(22)

Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date

06.01.2016

(97)

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

15.11.2017

(86)

Kansainvälinen hakemus - Internationell
ansökan - International application

06.01.2016 PCT/US2016012289

(30)

Etuoikeus - Prioritet - Priority

06.01.2015 US US201562100362 P

11.05.2015 US US201562159550 P

(73)

Haltija - Innehavare - Holder

1• Arena Pharmaceuticals, Inc., 66 Hudson Boulevard East, New York, NY 10001-2192, (US)

(72)

Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1• GLICKLICH, Alan, 6502 Avenida Manana, La Jolla, California 92037, (US)

2• KAM, Maria Matilde Sanchez, 6331 River Downs Road, Alexandria, Virginia 22312, (US)

3• SHANAHAN, William R., 4948 Rancho Viejo Drive, Del Mar, California 92014, (US)

(74)

Asiamies - Ombud - Agent

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

(54)

Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

MENETELMIÄ S1P1-RESEPTORIIN LIITTYVIEN SAIRAUKSIEN HOITAMISEKSI

COMPOUND FOR USE IN TREATING CONDITIONS RELATED TO THE S1P1 RECEPTOR

PATENTTIVAATIMUKSET

1. Yhdiste, joka on (R)-2-(7-(4-syklopentyyli-3-(trifluorimetyyli)bentsyylioksi)-1,2,3,4-tetrahydro-
5 sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, hydraatti tai solvaatti,

käytettäväksi menetelmässä sfingosiini-1-fosfaatti-alatyypin 1 (S1P₁) -reseptoriin liittyvän häiriön hoitamiseksi,
10 hoidon käsittäessä standardiannoksen yhdistettä 1 tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävää suolaa, hydraattia tai solvaattia antamisen sitä tarvitsevalle yksilölle,
jossa mainittu standardiannos on määränä, joka
15 vastaa 1,5 - 2,5 mg:aa yhdistettä 1,
jossa yksilö on aikuinen ja
jossa sfingosiini-1-fosfaatti-alatyypin 1 (S1P₁) -reseptoriin liittyvä häiriö valitaan mikrobi-infektioista tai -sairaudesta, virusinfektioista tai -sairaudesta, lymfosyyttien välittämästä sairaudesta tai häiriöstä, autoimmuunisairaudesta tai -häiriöstä, inflammatorisesta sairaudesta tai häiriöstä, ankyloivasta spondyliitista, biliaarikirroosista, syövästä,
20 psoriaasista, psoriaattisesta nivel tulehduksesta, nivelreumasta, Crohnin taudista, siirännäisen hyljinnästä, multippeliskleroosista, systeemisestä lupus erythematosuksesta, inflammatorisesta suolistosairaudesta, ulseratiivisesta koliitista, tyypin I diabeteksesta,
25 kohonneeseen verenpaineeseen liittyvästä nefropatiasta, glomeruloskleroosista, sydänlihaksen iskemia-reperfuusio vauriosta ja aknesta.

35 2. Yhdiste, joka on (R)-2-(7-(4-syklopentyyli-3-(trifluorimetyyli)bentsyylioksi)-1,2,3,4-tetrahydro-
rosyklopenta[b]indol-3-yyli)etikkahappo (yhdiste 1) tai

sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, hydraatti tai solvaatti,

käytettäväksi menetelmässä inflammatorisen suolistosairauden hoitamiseksi,
5 hoidon käsittäessä standardiannoksen yhdistettä 1 tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävää suolaa, hydraattia tai solvaattia antamisen kerran vuorokaudessa sitä tarvitsevalle yksilölle,

10 jossa mainittu standardimäärä on määränä, joka vastaa 0,5 - 2,5 mg:aa yhdistettä 1, ja jossa yksilö on aikuinen.

3. Yhdiste käytettäväksi patenttivaatimuksen 2 mukaisesti, jossa inflammatorinen suolistosairaus on
15 ulseratiivinen koliitti.

4. Yhdiste, joka on (R)-2-(7-(4-syklopentyyli-3-(trifluorimetyyli)bentsyylioksi)-1,2,3,4-tetrahydro-
rosyklopenta[b]indol-3-yyli)etikkahappo (yhdiste 1) tai
20 sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, hydraatti tai solvaatti,

käytettäväksi menetelmässä sfingosiini-1-fosfaatti-alatyypin 1 (S1P₁)-reseptoriin liittyvän häiriön hoitamiseksi,
hoidon käsittäessä standardiannoksen yhdistettä 1 tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävää
25 suolaa, hydraattia tai solvaattia antamisen kerran vuorokaudessa sitä tarvitsevalle yksilölle, jossa mainittu standardiannos on määränä, joka vastaa 0,5 - 2,5 mg:aa yhdistettä
30 1,

jossa yksilö on aikuinen,
jossa yksilö oli osoittanut riittämätöntä vastetta, vasteen menettämistä tai intoleranssia vähintään yhtä ainetta, joka valitaan oraalisista
35 5-aminosalisylaateista, kortikosteroideista, immunosuppressoreista, TNF α -antagonisteista ja integriiniantagonisteista,

kohtaan tai jossa sitä tarvitseva yksilö on paastonnut yksilö ja
jossa sfingosiini-1-fosfaatti-alatyypin 1 (S1P₁) -reseptoriin liittyvä häiriö valitaan
5 mikrobi-infektioista tai -sairaudesta, virusinfektioista tai -sairaudesta, lymfosyyttien välittämästä sairaudesta tai häiriöstä, autoimmuunisairaudesta tai -häiriöstä, inflammatorisesta sairaudesta tai häiriöstä, ankyloivasta
10 spondyliitista, biliaarikirroosista, syövästä, psoriaasista, psoriaattisesta nivel tulehduksesta, nivelreumasta, Crohnin taudista, siirännäisen hyljinnästä, multippeliskleroosista, systeemisestä lupus erythematosuksesta, inflammatorisesta suolistosairaudesta, ulseratiivisesta koliitista, tyypin I diabeteksestä,
15 kohonneeseen verenpaineeseen liittyvästä nefropatiasta, glomeruloskleroosista, sydänlihaksen iskemia-reperfuusio vauriosta ja aknesta.

5. Yhdiste käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksista 2 - 4 mukaisesti,
jossa standardiannos on määränä, joka vastaa 1 mg:aa yhdistettä 1.

25 6. Yhdiste käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksista 2 - 4 mukaisesti,
jossa standardiannos on määränä, joka vastaa 2 mg:aa yhdistettä 1.

7. Yhdiste käytettäväksi jonkin edeltävistä
30 patenttivaatimuksista mukaisesti,
jossa hoito käsittää lisäksi hättätapahtumien monitoroinnin yhdisteen 1 tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävän suolan, hydraatin tai solvaatin antamisen aikana ja valinnaisesti yhdisteen 1 tai sen farmaseuttisesti
35 hyväksyttävän suolan, hydraatin tai solvaatin antamisen keskeyttämisen tai lopettamisen.

8. Yhdiste käytettäväksi jonkin edeltävistä patenttivaatimuksista mukaisesti, jossa hoito käsittää lisäksi syketiheyden monitoroinnin antamisen aikana, keuhkojen toiminnan monitoroinnin antamisen aikana tai maksan toiminnan monitoroinnin antamisen aikana.

9. Yhdiste käytettäväksi jonkin edeltävistä patenttivaatimuksista mukaisesti, jossa yhdiste 1 tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, hydraatti tai solvaatti annetaan oraalisesti.

10. Yhdiste käytettäväksi jonkin edeltävistä patenttivaatimuksista mukaisesti, jossa yhdiste 1 tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, hydraatti tai solvaatti formuloidaan kapseliksi tai tabletksi, joka sopii oraalisesti annettavaksi.

11. Yhdiste käytettäväksi jonkin edeltävistä patenttivaatimuksista mukaisesti, jossa yhdiste 1 tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, hydraatti tai solvaatti valitaan:
yhdisteestä 1;
yhdisteen 1 kalsiumsuolasta; ja
yhdisteen 1 L-arginiinisulasta.

12. Yhdiste käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksista 1 - 10 mukaisesti, jossa yhdiste 1 tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, hydraatti tai solvaatti on yhdisteen 1 L-arginiinisuola.

13. Yhdiste käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksista 1 - 10 mukaisesti, jossa yhdiste 1 tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, hydraatti tai solvaatti on yhdisteen 1 L-arginiinisulatan vedetön, solvatoimaton kiteinen muoto.

14. Yhdiste käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksista 1 - 10 mukaisesti, jossa yhdiste 1 tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, hydraatti tai solvaatti on yhdisteen 1 vedetön, solvatoimaton kiteinen muoto.

15. Yhdiste käytettäväksi jonkin patenttivaa-
timuksista 1 ja 4 - 14 mukaisesti,
jossa standardiannos annetaan yksilölle koko hoidon
ajan.

5 16. Yhdiste käytettäväksi jonkin patenttivaa-
timuksista 1 ja 4 - 14 mukaisesti,
jossa hoito vähentää lymfosyyttien määrää yksilöllä vä-
hintään 40 %:lla.

10 17. Yhdiste käytettäväksi jonkin patenttivaa-
timuksista 1 ja 4 - 16 mukaisesti,
jossa sfingosiini-1-fosfaatti-alatyypin 1 (SP_1) -re-
septoriin liittyvä häiriö valitaan mikrobi-infektioista
tai -sairaudesta ja virusinfektioista tai -sairaudesta.

15 18. Yhdiste käytettäväksi jonkin patenttivaa-
timuksista 1 ja 4 - 16 mukaisesti,
jossa sfingosiini-1-fosfaatti-alatyypin 1 (SP_1) -re-
septoriin liittyvä häiriö on ankyloiva spondyliitti.

20 19. Yhdiste käytettäväksi jonkin patenttivaa-
timuksista 1 ja 4 - 16 mukaisesti,
jossa sfingosiini-1-fosfaatti-alatyypin 1 (SP_1) -re-
septoriin liittyvä häiriö on biliaarikirroosi.

25 20. Yhdiste käytettäväksi jonkin patenttivaa-
timuksista 1 ja 4 - 16 mukaisesti,
jossa sfingosiini-1-fosfaatti-alatyypin 1 (SP_1) -re-
septoriin liittyvä häiriö on psoriaasi.

30 21. Yhdiste käytettäväksi jonkin patenttivaa-
timuksista 1 ja 4 - 16 mukaisesti,
jossa sfingosiini-1-fosfaatti-alatyypin 1 (SP_1) -re-
septoriin liittyvä häiriö on psoriaattinen niveltuleh-
dus.

 22. Yhdiste käytettäväksi jonkin patenttivaa-
timuksista 1 ja 4 - 16 mukaisesti,
jossa sfingosiini-1-fosfaatti-alatyypin 1 (SP_1) -re-
septoriin liittyvä häiriö on nivelreuma.

35 23. Yhdiste käytettäväksi jonkin patenttivaa-
timuksista 1 ja 4 - 16 mukaisesti,

jossa sfingosiini-1-fosfaatti-alatyypin 1 (S1P₁) -reseptoriin liittyvä häiriö on Crohnin tauti.

24. Yhdiste käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksista 1 ja 4 - 16 mukaisesti,
 5 jossa sfingosiini-1-fosfaatti-alatyypin 1 (S1P₁) -reseptoriin liittyvä häiriö on multippeliskleroosi.

25. Yhdiste käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksista 1 ja 4 - 16 mukaisesti,
 jossa sfingosiini-1-fosfaatti-alatyypin 1 (S1P₁) -reseptoriin liittyvä häiriö on systeeminen lupus erythematosus.
 10

26. Yhdiste käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksista 1 ja 4 - 16 mukaisesti,
 jossa sfingosiini-1-fosfaatti-alatyypin 1 (S1P₁) -reseptoriin liittyvä häiriö on inflammatorinen suolistosairaus.
 15

27. Yhdiste käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksista 1 ja 4 - 16 mukaisesti,
 jossa sfingosiini-1-fosfaatti-alatyypin 1 (S1P₁) -reseptoriin liittyvä häiriö on ulseratiivinen koliitti.
 20

28. Yhdiste käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksista 1 ja 4 - 16 mukaisesti,
 jossa sfingosiini-1-fosfaatti-alatyypin 1 (S1P₁) -reseptoriin liittyvä häiriö on akne.

25 29. Yhdiste käytettäväksi patenttivaatimuksen 1 mukaisesti, jossa

yhdiste on yhdisteen 1 L-arginiinisuolo;
 standardiannos on määränä, joka vastaa 2 mg:aa yhdistettä 1; ja

30 sfingosiini-1-fosfaatti-alatyypin 1 (S1P₁) -reseptoriin liittyvä häiriö on inflammatorinen suolistosairaus.

30. Yhdiste käytettäväksi patenttivaatimuksen 1 mukaisesti, jossa

35 yhdiste on yhdisteen 1 L-arginiinisuolo;
 standardiannos on määränä, joka vastaa 2 mg:aa yhdistettä 1; ja

sfingosiini-1-fosfaatti-alatyypin 1 (S1P₁) -reseptoriin liittyvä häiriö on ulseratiivinen koliitti.