

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

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

(10)

EP/EP3154594 T3

(12)

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

(45)

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

07.08.2023

(97)

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

19.07.2023

(51)

Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -
International patent classification

A61K 47/54 (2017 . 01)

A61K 47/64 (2017 . 01)

A61K 31/337 (2006 . 01)

A61K 31/4155 (2006 . 01)

A61K 31/4375 (2006 . 01)

A61K 31/4545 (2006 . 01)

A61K 31/517 (2006 . 01)

A61K 31/519 (2006 . 01)

A61K 31/69 (2006 . 01)

A61K 31/704 (2006 . 01)

A61K 31/7068 (2006 . 01)

A61P 29/00 (2006 . 01)

A61P 35/00 (2006 . 01)

(96)

Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan -
European patent application

EP15807049.0

Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date

(97)

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

19.04.2017

(86)

Kansainvälinen hakemus - Internationell
ansökan - International application

15.06.2015 PCT/US2015035798

(30)

Etuoiikeus - Prioritet - Priority

13.06.2014 US US201462011989 P

16.09.2014 US US201462051033 P

(73)

Haltija - Innehavare - Holder

1• Bach Biosciences, LLC, 31 Echo Landing , Moultonborough, NH 03254 , (US)

(72)

Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1• BACHOVCHIN, William, W., 75 Cambridge Parkway Apt. E609 , Cambridge, MA 02142 , (US)

2• LAI, Hung-sen, 11 Seten Circle , Andover, MA 01810 , (US)

3• SANFORD, David, G., 52 Hopkins Street , Reading, MA 01867 , (US)

4• POPLAWSKI, Sarah, E., 107 Beech Street Unit 3 , Belmont, MA 02478 , (US)

5• WU, Wengen, 28 Ninth Street 508 , Medford, MA 02155 , (US)

(74)

Asiamies - Ombud - Agent

Patentia Oy, Vakkatie 26c , 00430 Helsinki , (FI)

(54)

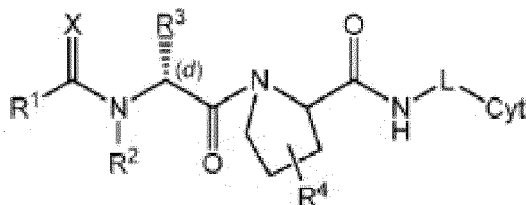
Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

FAP-AKTIVOITUJA TERAPEUTTISIA AINEITA JA NIIHIN LIITTYVIÄ KÄYTTÖJÄ

FAP-ACTIVATED THERAPEUTIC AGENTS, AND USES RELATED THERETO

PATENTTIVAATIMUKSET

1. Aihiolääke, jota edustaa yleiskaava



5 tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, missä:

R¹ on (C₁-C₁₀)alkyyli, (C₁-C₁₀)alkoksi, (C₁-C₁₀)alkyyli-C(O)-(C₁-C₁₀)alkyyli, (C₃-C₈)sykloalkyyli, (C₃-C₈)sykloalkyyli-(C₁-C₁₀)alkyyli, aryyli, aryyli(C₁-C₁₀)alkyyli, heteroaryyli, tai heteroaryyli(C₁-C₁₀)alkyyli, jolloin mikä tahansa R¹ on valinnaisesti substituoitu yhdellä tai useammalla substituentilla, jotka on valittu
10 itsenäisesti ryhmästä, jonka muodostavat halogeeni, hydroksi, karboksylaatti, syaani, amino, nitro ja tio (-SH);

R² on H tai (C₁-C₆)alkyyli;

R³ on (C₁-C₆)alkyyli;

R⁴ puuttuu tai on (C₁-C₆)alkyyli, -OH, -NH₂, tai yksi tai kaksi halogeenia;

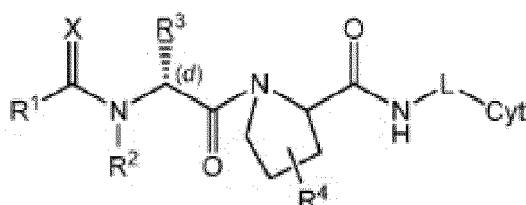
15 X on O tai S;

Cyt' on antrasykliiniosa; ja

L on sidos tai -N(H)-L on itsestään immolatiivinen linkkeri, joka metaboloituu FAP:n katkaisun jälkeen vapauttaen antrasykliiniosan,

jolloin aihiolääke on muunnettu selektiivisesti aktiiviseksi antrasykliiniksi FAP⁺
20 stroomasolujen avulla.

2. Aihiolääke, jota edustaa yleiskaava



tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, missä:

R^1 on heteroaryyli, joka on mahdollisesti substituoitu yhdellä tai useammalla substituentilla, jotka on valittu itsenäisesti ryhmästä, jonka muodostavat halogeeni, hydroksi, karboksylaatti, syaani, amino, nitro ja tio (-SH);

R^2 on H tai (C_1 - C_6)alkyyli;

5 R^3 on metyyli;

R^4 puuttuu;

X on O;

Cyt' on antrasykliiniosa; ja

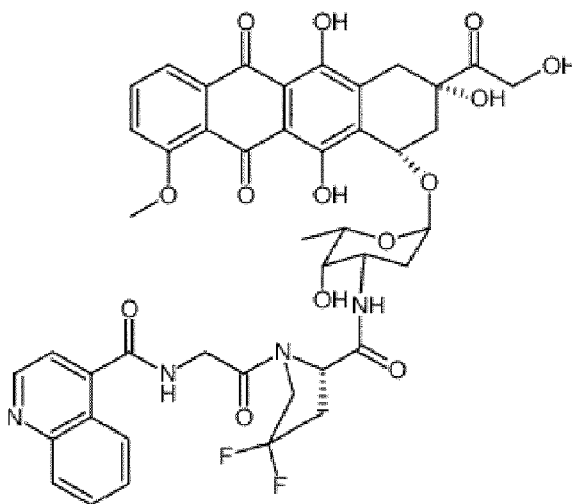
L on sidos tai -N(H)-L on itsestään immolatiivinen linkkeri, joka metaboloituu

10 FAP:n katkaisun jälkeen vapauttaen antrasykliiniosan,

jolloin aihiolääke on muunnettu selektiivisesti aktiiviseksi antrasykliiniksi FAP⁺ stroomasolujen avulla.

3. Jonkin patenttivaatimuksista 1 tai 2 mukainen aihiolääke, jolloin L on
15 itsestään immolatiivinen linkkeri, joka käsittää heterosyklin, jolloin valinnaisesti itsestään immolatiivinen linkkeri on valittu ryhmästä, jonka muodostavat His-Ala, p-aminobentsyylioksikarbonyyli (PABC) ja 2,4-bis(hydroksimetyyli)aniliini.

4. Aihiolääke, jota edustaa kaava:



6. Patenttivaatimuksen 5 mukainen aihiolääke, jolla on seuraava rakenne:



5 6. Patenttivaatimuksen 5 mukainen aihiolääke, jolla on seuraava rakenne:

7. Farmaseuttinen koostumus, joka sisältää jonkin edellisistä patenttivaatimuksista mukaista aihiolääkettä tai sen farmaseuttisesti

hyväksyttävää suolaa; ja farmaseuttisesti hyväksyttävää kantajaa.

8. Jonkin patenttivaatimuksista 1-6 mukainen yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola käytettäväksi menetelmässä, jolla hoidetaan sairautta, jolle on tunnusomaista fibroblastiaktivaatioproteiinin (FAP) lisääntyminen.

9. Yhdiste käytettäväksi patenttivaatimuksen 8 mukaisesti, jolloin häiriö, jolle on tunnusomaista FAP:n lisääntyminen, on valittu ryhmästä, jonka muodostavat syöpä, fibroosi ja tulehdus.