

(19)



SUOMI - FINLAND

(FI)

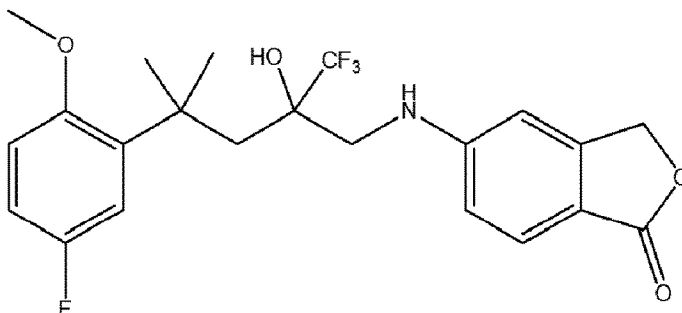
PATENTTI- JA REKISTERIHALLITUS
PATENT- OCH REGISTERSTYRELSEN
FINNISH PATENT AND REGISTRATION OFFICE

- (10) **FI/EP3700513 T3**
- (12) **EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION**
- (45) Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av
översättning - Translation available to the public **15.12.2022**
- (80) Eurooppapatentin myöntämispäivä -
Meddelandedatum för det europeiska patentet -
Date of grant of European patent **24.08.2022**
- (51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassifikation -
International patent classification
A61K 31/137 (2006.01)
A61K 31/365 (2006.01)
A61K 31/381 (2006.01)
A61K 31/343 (2006.01)
A61P 11/06 (2006.01)
A61P 17/00 (2006.01)
A61P 29/00 (2006.01)
A61P 17/06 (2006.01)
A61P 1/00 (2006.01)
C07D 307/88 (2006.01)
C07D 201/00 (2006.01)
- (86) Eurooppapatentihakemus - Europeisk patentansökan **EP18786823.7**
- European patent application
- (86) (22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date **23.10.2018**
- (87) Patentihakemuksen julkiseksitulosopäivä -
Patentansökans publiceringsdag -
Patent application available to the public **02.09.2020**
- (86) Kansainvälinen hakemus - **23.10.2018 PCT/EP2018079049**
Internationell ansökan - International
application
- (30) Etuoikeus - Prioritet - Priority
27.10.2017 US 201762578036 P 17.05.2018 EP 18305612

- (73) Haltija - Innehavare - Proprietor
1 • Association pour la recherche à l'IGBMC (ARI), 4 rue du Dr Albert Schweitzer, 67113 Blaesheim, RANSKA, (FR)
- (72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor
1 • CHAMBON, Pierre, 4 rue du Dr Albert Schweitzer, 67113 Blaesheim, RANSKA, (FR)
2 • HUA, Guoqiang, 4 rue Georges Laufenburger, 67400 Illkirch-Graffenstaden, RANSKA, (FR)
- (74) Asiamies - Ombud - Agent
Patentia Oy, Vakkatie 26c, 00430 Helsinki
- (54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention
**EI-STEROIDISET SELEKTIIVISET GLUKORTIKOIDIRESEPTORIN AGONISTIMODULAATTORIT (SEGRAMIT) JA NIIDEN
KÄYTTÖ**
Icke-steroida selektiva glukokortikoidreceptoragonistmodulatorer (segramer) och användningar därav
**NON-STEROIDAL SELECTIVE GLUCOCORTICOID RECEPTOR AGONISTIC MODULATORS (SEGRAMS) AND USES
THEREOF**
- (56) Viitejulkaisut - Anförda publikationer - References cited
US-A1- 2006 040 933, US-B1- 6 323 199

PATENTTIVAATIMUKSET

1. Koostumus, johon sisältyy yksi kaava 1:n **SE**lective **GL**ucocorticoid **RE**ceptor **AG**onistic **M**odulator :n (SEGRAM) enantiomeeri:



5

(Kaava 1 – CpdX)

tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola ja/tai solvaatti,

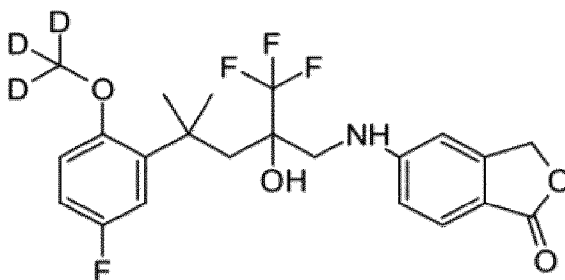
käytettäväksi tulehdushäiriön ennaltaehkäisyssä tai hoidossa sitä tarvitsevassa koh-
teessa,

10

jolloin tulehdushäiriö valitaan ryhmästä, jonka muodostavat atooppinen ihottuma,
kosketusihottuma, psoriaasi, aurinkoihottuma, ekseema, nokkosihottuma, vitiligo,
erythema nodosum, erythema multiforme, dermatomyosiitti, skleroderma, an-
gioedeema, punajäkälä, ihon nekrotisoiva venuliitti, hyönteisten pureman aiheuttama
ihotulehdus, nenän sidekalvotulehdus, tulehduksellinen suolistosairaus (IBD), Croh-
nin tauti, koliitti, allerginen sidekalvotulehdus ja haavainen koliitti; ja

15

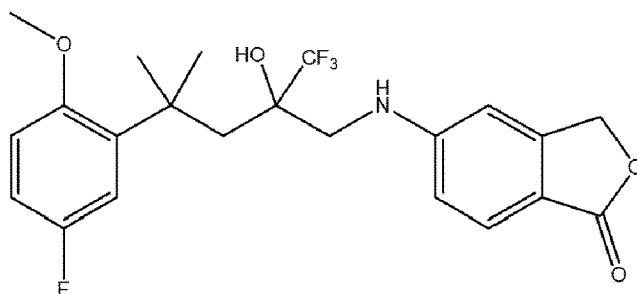
jolloin mainittu SEGRAM:n enantiomeeri vastaa toista eluointipiikkiä superkriitti-
sessä nestekromatografiassa (SFC) suoritettuna kaavan 1 [CpdX(eB)] mukaisen
SEGRAM:n raseemiselle seokselle tai kaavan 1 mukaisen deuteroidussa muodos-
saan olevan SEGRAM:n raseemiselle seokselle kaavan 2 [CpdX-D3(eB)] kanssa:



20

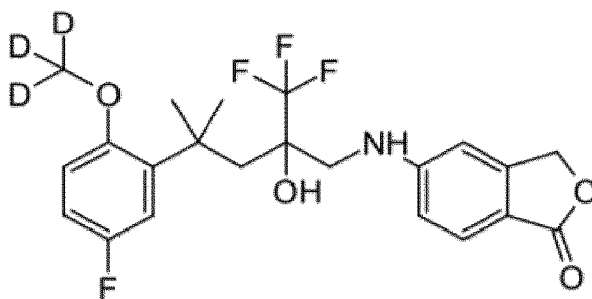
(Kaava 2 – CpdX-D3).

2. Koostumus, johon sisältyy yksi kaava 1:n **SE**lective **GL**ucocorticoid **RE**ceptor **AG**onistic **M**odulator :n (SEGRAM) enantiomeeri:



(Kaava 1 – CpdX)

- 5 tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola ja/tai solvaatti,
käytettäväksi tulehdushäiriön ennaltaehkäisyssä tai hoidossa sitä tarvitsevassa koh-
teessa,
jolloin tulehdushäiriö valitaan ryhmästä, jonka muodostavat atooppinen ihottuma,
kosketusihottuma, allerginen astma, psoriaasi, allerginen sidekalvotulehdus, nivel-
10 reuma, aurinkoihottuma, ekseema, nokkosihottuma, vitiligo, erythema nodosum,
erythema multiforme, dermatomyosiitti, skleroderma, angioedeema, punajäkälä,
ihon nekrotisoiva venuliitti, hyönteisten pureman aiheuttama ihotulehdus, allerginen
sinuiitti, allerginen riniitti, heinänuha, nenän sidekalvotulehdus, tulehduksellinen
suolistosairaus (IBD), Crohnin tauti, koliitti ja haavainen koliitti; ja
15 jolloin mainittu SEGRAM:n enantiomeeri vastaa ensimmäistä eluointipiikkiä su-
perkriittisessä nestekromatografiassa (SFC) suoritettuna kaavan 1 mukaisen deute-
roidussa muodossaan olevan SEGRAM:n raseemiselle seokselle kaavan 2 [CpdX-
D3(eA)] kanssa:



(Kaava 2 – CpdX-D3).

3. Koostumus käytettäväksi patenttivaatimuksen 1 tai 2 mukaisesti, jolloin mainittu SEGRAM:n enantiomeeri ei indusoi tai ei oleellisesti indusoi suoraa glukokorti-
koidireseptorin transaktivaatiofunktia eikä suoraa transrepressiofunktia, mutta

indusoi selektiivisesti epäsuoran sitoutumisella tapahtuvan glukokortikoidireseptorin transrepressiofunktion.

4. Koostumus käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksista 1–3 mukaisesti, jolloin mainittu SEGRAM:n enantiomeeri ei indusoi tai ei oleellisesti indusoi steroidaalisiin tulehduskipulääkkeisiin (SAIDit) liittyviä sivuvaikutuksia sitä annettaessa sitä tarvitsevalle kohteelle.
5. Koostumus käytettäväksi patenttivaatimuksen 4 mukaisesti, jossa SAIDeihin liittyvät sivuvaikutukset on valittu ryhmästä, jonka muodostavat ihoatrofia; osteoporoosi; kasvun hidastuminen; painon aleneminen; rasvamassan kasvu; rasvattoman massan väheneminen; kateenkorvan, pernan, munuaisen ja/tai lisämunuaisen apoptoosi; kortikosteronisynteesin estyminen; lisämunuaisloma; hyperglykemia; insuliiniresistenssi; hyperinsulinemia; metabolinen oireyhtymä, tyypin 2 diabetes; ja rasvamaksa.
6. Koostumus käytettäväksi patenttivaatimuksen 1 mukaisesti, jolloin tulehdushäiriö on valittu ryhmästä, jonka muodostavat atooppinen ihottuma, kosketusihottuma, psoriaasi, allerginen sidekalvotulehdus ja haavainen koliitti.
7. Koostumus käytettäväksi patenttivaatimuksen 2 mukaisesti, jolloin tulehdushäiriö on valittu ryhmästä, jonka muodostavat atooppinen ihottuma, kosketusihottuma, allerginen astma, psoriaasi, allerginen sidekalvotulehdus, nivelreuma ja haavainen koliitti.