

(19)



SUOMI - FINLAND  
(FI)

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

(10)

**FI/EP3638673 T3**

(12)

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

(45)

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

**13.09.2024**

(97)

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

**17.07.2024**

(51)

Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -  
International patent classification

**C07D 471/04** ( 2006 . 01 )

**A61K 31/445** ( 2006 . 01 )

**A61K 31/4985** ( 2006 . 01 )

**C07D 211/46** ( 2006 . 01 )

**A61K 45/06** ( 2006 . 01 )

**A61P 9/00** ( 2006 . 01 )

**A61P 25/16** ( 2006 . 01 )

**C07D 487/04** ( 2006 . 01 )

(96)

Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan -  
European patent application

**EP18818829.6**

(22)

Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date

**15.06.2018**

(97)

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

**22.04.2020**

(86)

Kansainvälinen hakemus - Internationell  
ansökan - International application

**15.06.2018 PCT/US2018037687**

(30)

Etuoikeus - Prioritet - Priority

15.06.2017 US US201762520430 P

28.11.2017 US US201762591247 P

29.03.2018 US US201862649856 P

16.05.2018 US US201862672261 P

(73)

Haltija - Innehavare - Holder

**1• Takeda Pharmaceutical Company Limited , 1-1 Doshomachi 4-chome Chuo-ku , Osaka-shi, Osaka 541-0045 , (JP)**

(72)

Keksijä - Uppfinnare - Inventor

**1• BROWN, Jason W. , c/o Takeda California Inc. 9625 Towne Centre Drive , San Diego, CA 92121 , (US)**

**2• HITCHCOCK, Stephen , c/o Takeda California Inc. 9625 Towne Centre Drive , San Diego, CA 92121 , (US)**

**3• HOPKINS, Maria , c/o Takeda California Inc. 9625 Towne Centre Drive , San Diego, CA 92121 , (US)**

**4• KIKUCHI, Shota , 5820 Nancy Ridge Drive , San Diego, CA 92121 , (US)**

**5• MONENSCHNEIN, Holger , c/o Takeda California Inc. 9625 Towne Centre Drive , San Diego, CA 92121 , (US)**

**6• REICHARD, Holly , c/o Takeda California Inc. 9625 Towne Centre Drive , San Diego, CA 92121 , (US)**

**7• SCHLEICHER, Kristin , c/o Takeda California Inc. 9625 Towne Centre Drive , San Diego, CA 92121 , (US)**

**8• SUN, Huikai , c/o Takeda California Inc. 9625 Towne Centre Drive , San Diego, CA 92121 , (US)**

**9• MACKLIN, Todd , Three Bryant Park 1095 Avenue of the Americas , New York, NY 10036-6797 , (US)**

(74)

Asiamies - Ombud - Agent

**Cosmovici Intellectual Property , 11 Boulevard Sébastopol , 75001 Paris , (FR)**

(54)

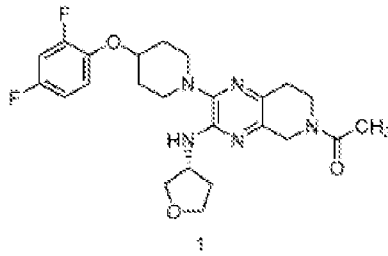
Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

**GPR6:N TETRAHYDROPYRIDOPYRATSIIINIMODULAATTORIT**

**TETRAHYDROPYRIDOPYRAZINE MODULATORS OF GPR6**

## Patenttivaatimukset

1. Kaavan 1 mukainen yhdiste,



5

tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste tai farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, jolla on enantiomeerinen puhtaus:

10

- (a) yhtä suuri tai suurempi kuin 20 % enantiomeeriylimäärä (ee); ja/tai
- (b) yhtä suuri tai suurempi kuin 40 % ee; ja/tai
- (c) yhtä suuri tai suurempi kuin 60 % ee; ja/tai
- (d) yhtä suuri tai suurempi kuin 80 % ee; ja/tai
- (e) yhtä suuri tai suurempi kuin 90 % ee; ja/tai
- (f) yhtä suuri tai suurempi kuin 98 % ee; ja/tai
- (g) yhtä suuri tai suurempi kuin 99 % ee; ja/tai
- (h) yhtä suuri kuin 100 % ee.

15

20

3. Patenttivaatimuksen 1 tai 2 mukainen yhdiste tai farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, jolloin yhdiste on vapaassa muodossa. Yhdiste tai farmaseuttisesti hyväksyttävä suola patenttivaatimuksen 1 tai 2 mukaisesti, jossa yhdiste on vapaassa muodossa.

4. Farmaseuttinen koostumus, joka sisältää:

25

- (a) yhdiste tai farmaseuttisesti hyväksyttävä suola, sellaisena kuin se on määritelty jossakin patenttivaatimuksista 1-3; ja
- (b) farmaseuttisesti hyväksyttävä apuaine.

30

5. Patenttivaatimuksen 4 mukainen farmaseuttinen koostumus käytettäväksi:

- (a) lääkkeenä; ja/tai
- (b) sairauden, häiriön tai tilan hoidossa; ja/tai
- (c) sairauden, häiriön tai tilan hoidossa, joka on valittu ryhmästä, joka koostuu seuraavista: Parkinsonin tauti, levodopan aiheuttamat dyskinesiat, Huntingtonin tauti, huumeriippuvuus, syömishäiriöt, kognitiiviset häiriöt, skitsofrenia, kaksisuuntainen mielialahäiriö, epilepsia, Alzheimerin tauti, ahdistus ja masennus; ja/tai
- (d) Parkinsonin taudin hoidossa; ja/tai
- (e) Parkinsonin taudin hoidossa potilaalle, jossa hoito parantaa potilaan motorisia oireita.

35

40

6. Patenttivaatimuksen 4 mukainen farmaseuttinen koostumus tai patenttivaatimuksen 5 mukainen farmaseuttinen koostumus käytettäväksi, jossa yhdiste tai farmaseuttisesti hyväksyttävä suola soveltuu seuraaviin tarkoituksiin;

45

- (a) annettavaksi annoksena välillä 0,5 mg/kg - 5,0 mg/kg; ja/tai
- (b) annostelu suun kautta.

EP 3 638 673 B1

7. Yhdiste tai farmaseuttisesti hyväksyttävä suola jonkin patenttivaatimuksen 1-3 mukaisesti, jossa yhdiste tai farmaseuttisesti hyväksyttävä suola on tarkoitettu käytettäväksi:

- 5 (a) lääkkeenä; ja/tai  
(b) sairauden, häiriön tai tilan hoidossa; ja/tai  
(c) sairauden, häiriön tai tilan hoidossa, joka on valittu ryhmästä, joka koostuu seuraavista: Parkinsonin tauti, levodopan aiheuttamat dyskinesiat, Huntingtonin tauti, huumeriippuvuus, syömishäiriöt, kognitiiviset häiriöt, skitsofrenia, kaksisuuntainen mielialahäiriö, epilepsia, Alzheimerin tauti, ahdistus ja masennus; ja/tai  
10 (d) Parkinsonin taudin hoidossa; ja/tai  
(e) Parkinsonin taudin hoidossa potilaalle, jossa hoito parantaa potilaan motorisia oireita.

8. Yhdiste tai farmaseuttisesti hyväksyttävä suola käytettäväksi patenttivaatimuksen 7 mukaisesti, jolloin yhdiste tai farmaseuttisesti hyväksyttävä suola on mukautettu:

- (a) annettavaksi annoksena välillä 0,5 mg/kg - 5,0 mg/kg; ja/tai  
(b) annostelu suun kautta.

9. Yhdiste, joka sisältää jonkin patenttivaatimuksen 4-6 mukaisen farmaseuttisen koostumuksen ja vähintään yhden farmakologisesti aktiivisen lisäaineen.

10. Patenttivaatimuksen 9 mukainen yhdiste, jossa yhdiste soveltuu farmaseuttisen koostumuksen ja vähintään yhden muun farmakologisesti aktiivisen aineen antamiseen samanaikaisesti, peräkkäin tai erikseen.

11. Pakkaus, joka sisältää jonkin patenttivaatimuksen 4-6 mukaisen farmaseuttisen koostumuksen ja farmaseuttisen koostumuksen, joka sisältää vähintään yhden farmakologisesti aktiivisen lisäaineen.

12. Patenttivaatimuksen 9 tai 10 mukainen yhdiste tai patenttivaatimuksen 11 mukainen pakkaus, jossa farmakologisesti aktiivinen lisäaine on:

- 35 (a) valittu ryhmästä, joka koostuu seuraavista: levodopa, DOPA-dekarboksylaasin estäjä, dopamiiniagonisti, antikolinerginen aine, B-selektiivinen monoamiinioksidaasin estäjä ja katekoli-O-metyylitransferraasin estäjä; ja/tai  
(b) amantadiini; ja/tai  
(c) levodopa yhdessä DOPA-dekarboksylaasin estäjän kanssa; ja/tai  
40 (d) valittu ryhmästä, joka koostuu seuraavista: karbidopa, benseratsidi, metyylidopa, a-difluorimetyyli-DOPA, 3',4',5,7-tetrahydroksi-8-metoksi-isoflavoni, apomorfiinihydrokloridi, bromokriptiini, rotigotiini, pramipex- ole, ropiniroli, triheksifenidyli, bentsotropiinimesylaatti, safinamidi, selegiliini, rasagiliini, entakaponi ja tol- kaponi; ja/tai  
(e) valittu ryhmästä, joka koostuu seuraavista: beetasekretaasin estäjät, gammasekretaasin estäjät, HMG-CoA-reduktaasin estäjät ja ei-steroidiset tulehduskipulääkkeet (NSAID); ja/tai  
45 (f) valittu ryhmästä, joka koostuu seuraavista: apatsoni, aspiriini, selloksibi, diklofenaakki (misoprostolin kanssa tai ilman), diflunisali, etodolaakki, fenoprofeeni, flurbiprofeeni, ibuprofeeni, indometasiini, ketoprofeeni, meklofenamaattinatrium, mefenamiinihappo, meloksikaami, nabumetoni, naprokseeni, oksaprotsiini, fenyylibutatsoni, piroksikaami, koliini- ja magnesiumsalisylaattit, salsalaatti ja sulindaakki; ja/tai  
50 (g) valittu ryhmästä, joka koostuu seuraavista: donepetsiili, rivastigmiini, memantiini ja galantamiini; ja/tai  
55 (h) valittu ryhmästä, joka koostuu seuraavista: rauhoittavat lääkkeet, nukahtamislääkkeet, anksiolyytit, antipsykoottit ja rauhoittavat lääkkeet; ja/tai

## EP 3 638 673 B1

- 5 (i) valittu ryhmästä, joka koostuu seuraavista: amitriptyliini, amoksapiini, aripipratsoli, asenapiini, bupropioni, klooridiatsepoksidi, sitalopraami, klooripromatsiini, klotsapiini, desipramiini, desvenlafaksiini, doksepiini, duloksetiini, eskit- alopraami, fluoksetiini, flufenatsiini, haloperidoli, iloperidoni, imipramiini, isokarboksatsidi, lamotrigiini, levomil- nacipraani, lurasidoni, mirtatsapiini, nefatsodoni, nortriptyliini, olantsapiini, paliperidoni, paroksetiini, perfenatsiini, fenelsiini, protriptyliini, ketiapiini, risperidoni, safinamidi, selegiliini, sertraliini, tranyylysyypromiini, tratsodoni, trimipramiini, venlafaksiini, vilatsodoni, vortiooksetiini ja ziprasidoni; ja/tai
- 10 (j) valittu ryhmästä, joka koostuu seuraavista: alpratsolaami, klordiatsepoksidi, klobatsepaami, klonatsepaami, kloratsepaatti, diatsepaami, estatsolaami, fluratsepaami, loratsepaami, midatsolaami, oksatsepaami, pratsepaami, kvasepaami, tematsepaami ja triatsolaami, hydroksitsiini, eszopikloni, zaleploni, zolpidemi, tsopikloni ja buspironi; ja/tai
- 15 (k) valittu ryhmästä, joka koostuu seuraavista: asetatsolamidi, karbamatsepiini, klobatsaami, klonatsepaami, eslikarbatsepiiniasetaatti, etosuksimidi, gabapentiini, lakosamidi, lamotrigiini, levetirasetaami, nitratsepaami, okskarbatsepiini, perampaneeli, pirasetami, fenobarbitaali, fenytoiini, pregabaliini, primidoni, retigabiini, rufinamidi, natriumvalproaatti, stiripentoli, tiagabiini, topiramaatti, vigabatriini ja zonisamidi.
- 20 13. Annosmuoto, joka sisältää yhdisteen tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävän suolan jonkin patenttivaatimuksen 1-3 mukaisesti ja farmaseuttisesti hyväksyttävän apuaineen, jossa annosmuoto on sovitettu yhdisteen tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävän suolan antamiseen suun kautta.
- 25 14. Patenttivaatimuksen 13 mukainen annosmuoto, jossa yhdisteen tai farmaseuttisesti hyväksyttävän suolan annos on välillä 0,5 mg/kg - 5,0 mg/kg.