

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

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

(10) **FI/EP3851447 T3**
(12) **EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS**
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION

(45) Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning - **15.11.2023**
Translation available to the public

(97) Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för **06.09.2023**
det europeiska patentet - Date of grant of European patent

(51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -
International patent classification

C07K 5/062 (2006 . 01)

C07K 5/068 (2006 . 01)

C07K 5/083 (2006 . 01)

C07C 309/15 (2006 . 01)

C07D 207/16 (2006 . 01)

C07D 209/20 (2006 . 01)

C07D 217/24 (2006 . 01)

C07D 233/64 (2006 . 01)

C07D 291/02 (2006 . 01)

C07D 333/24 (2006 . 01)

C12P 11/00 (2006 . 01)

A61K 47/54 (2017 . 01)

A61K 47/64 (2017 . 01)

C07H 7/02 (2006 . 01)

(96) Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan - **EP21160988.8**
European patent application

(22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date **12.10.2007**

(97) Patenttihakemuksen julkiseksitulospäivä - Patentansökans **21.07.2021**
publiceringsdag - Patent application available to the public

(30) Etuoikeus - Prioritet - Priority

12.10.2006 US US851039 P

12.04.2007 US US911459 P

(73) Haltija - Innehavare - Holder

1 • Bellus Health Inc. , 275 Armand-Frappier Boulevard , Laval, QC H7V 4A7 , (CA)

(72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1 • Kong, Xianqi , 12 Papillon Street , Dollard-des Ormeaux, Québec H9B 3J7 , (CA)

2 • Atfani, Mohamed , 4121 Boul. Notre-Dame, Apt. 302 , Laval, Québec H7W 1T2 , (CA)

3 • Bachand, Benoit , 2129 John McCurdy , St-Laurent, Québec H4R 3H8 , (CA)

4 • Bouzide, Abderrahim , 410 62e Avenue, Apt. 303 , Laval, Québec H7V 2G7 , (CA)

5 • Ciblat, Stephane , 325 du St-Sacrement, Apt. 403 , Montreal, Québec H2Y 1Y1 , (CA)

6 • Levesque, Sophie , 8290 rue du Labour , Mirabel, Québec J7N 1V3 , (CA)

7 • Migneault, David , 4545 Hurtubise , Laval, Québec H7T 2T6 , (CA)

8 • Valade, Isabelle , 320 rue des Cerisiers , Ste Marthe sur le Lac, Québec J0N 1P0 , (CA)

9 • Wu, Xinfu , 442 rue de Saint-Servan , Laval, Québec H7X 4B4 , (CA)

10 • Delorme, Daniel , 793 rue Charbonneau , St-Lazare, Québec J7T 2B2 , (CA)

(74) Asiamies - Ombud - Agent

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

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

MENETELMIÄ, YHDISTEITÄ, KOOSTUMUKSIA JA VEHIKKEITÄ 3-AMINO-1-PROPAANISULFONIHAPON VAPAUTTAMISEKSI
METHODS, COMPOUNDS, COMPOSITIONS AND VEHICLES FOR DELIVERING 3-AMINO-1-PROPANESULFONIC ACID

PATENTTIVAATIMUKSET

1. Yhdiste, jolla on kaava V-A, tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola tai solvaatti:

5



(V-A)

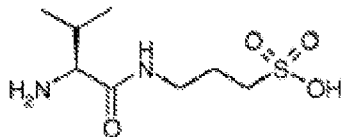
jolloin aa^x on aminohappotähde, joka on va-
littu valiinista, proliinista, lysiinistä, leusiinis-
10 ta, metioniinista, D-metioniinista, seriinistä, ala-
niinista, D-alaniinista, glysiinistä, isoleusiinista,
histidiinista, aminoisovoihaposta, fenyyli-
glysiinistä, tryptofaanista, tyrosiinista, O-bentsyyli-
seriinistä, O-bentsyyli-
15 O-bentsyyli-
glutamiinista ja γ-aminovoihaposta; ja

jolloin yksi tai useampi vetyatomi on korvat-
tu deuteriumilla.

2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yh-
diste, jolloin aa^x on aminohappotähde, joka on valittu
20 valiinista, lysiinistä, metioniinista, seriinistä ja
O-bentsyyli-
seriinistä.

3. Patenttivaatimuksen 1 tai patentti-
vaatimuksen 2 mukainen yhdiste, jolloin yhdiste on:

25



30 ja jolloin yksi tai useampi vetyatomi on kor-
vattu deuteriumilla.

4. Farmaseuttinen koostumus, joka käsittää jonkin patenttivaatimuksista 1–3 mukaisen yhdisteen ja farmaseuttisesti hyväksyttävän kantajaineen.

5 5. Patenttivaatimuksen 4 mukainen farmaseuttinen koostumus, joka on formuloitu suun kautta annettavaksi.

6. Patenttivaatimuksen 5 mukainen farmaseuttinen koostumus, joka on kovan gelatiinikapselin, 10 pehmeän gelatiinikapselin, oblaattikapselin, pillerin, tabletin, imeskelytabletin, jauheen, rakeen, pelletin, lääkerakeen, liuoksen, vesipitoisen nestemäisen suspension, vedettömän nestemäisen suspension, nestemäisen öljy-vesi-emulsion, nestemäisen vesi-öljy-emulsion, 15 eliksiirin, siirapin tai pastillin muodossa.

7. Patenttivaatimuksen 6 mukainen farmaseuttinen koostumus, jolloin kova gelatiinikapseli, 20 pehmeä gelatiinikapseli, oblaattikapseli, pilleri, tabletti, imeskelytabletti, jauhe, rae, pelletti tai lääkerae on päällystämätön.

8. Patenttivaatimuksen 6 mukainen farmaseuttinen koostumus, jolloin kova gelatiinikapseli, 25 pehmeä gelatiinikapseli, oblaattikapseli, pilleri, tabletti, imeskelytabletti, jauhe, rae, pelletti tai lääkerae on päällystetty.

9. Patenttivaatimuksen 8 mukainen farmaseuttinen koostumus, jolloin kova gelatiinikapseli, 30 pehmeä gelatiinikapseli, oblaattikapseli, pilleri, tabletti, imeskelytabletti, jauhe, rae, pelletti tai lääkerae on päällystetty enteerisellä päällysteellä.

10. Jonkin patenttivaatimuksista 1–3 mukainen yhdiste tai jonkin patenttivaatimuksista 4–9 mukainen farmaseuttinen koostumus käytettäväksi sellaisen taudin tai tilan hoidossa tai ehkäisyssä, joka 35 on valittu Alzheimerin taudista, lievästä kognitiivisesta heikkenemisestä, Downin oireyhtymästä, perinnöll-

lisestä aivoverenvuodosta, johon liittyy hollantilais-
tyyppinen amyloidoosi, aivojen amyloidisuonisairaude-
ta, Parkinsonin taudista, degeneratiivisesta dementi-
asta, sekamuotoisesta verisuoni- ja rappeumaperäisestä
5 dementiasta, Parkinsonin tautiin liittyvästä dementi-
asta, dementiasta, johon liittyy etenevä supranuk-
leaarinen halvaantuminen, dementiasta, johon liittyy
kortikaalinen basaalinen rappeutumisen tai Alzheimerin
taudin tyyppiä olevasta diffuusista lewyngappaletau-
10 dista.

11. Yhdiste tai farmaseuttinen koostumus
käytettäväksi patenttivaatimuksen 10 mukaisesti, jol-
loin mainittu tauti tai tila on valittu Alzheimerin
taudista, lievästä kognitiivisesta heikkenemisestä,
15 aivojen amyloidisuonisairaudesta ja degeneratiivisesta
dementiasta.

12. Yhdiste tai farmaseuttinen koostumus
käytettäväksi patenttivaatimuksen 11 mukaisesti, jol-
loin mainittu tauti tai tila on Alzheimerin tauti.

20 13. Jonkin patenttivaatimuksista 1-3 mu-
kainen yhdiste käytettäväksi hermosolujen suojaamisen
tuottamisessa tuhoutumista vastaan kohteella, jolla on
amyloidi- β :aan liittyvä tauti.