



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2315587 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/343 (2006.01)
A61K 31/4965 (2006.01)
A61K 31/506 (2006.01)
A61K 31/5575 (2006.01)
A61K 31/5578 (2006.01)
A61K 45/06 (2006.01)
A61P 9/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2018.03.05
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2017.10.25
(86)	European Application Nr.	09786912.7
(86)	European Filing Date	2009.08.12
(87)	The European Application's Publication Date	2011.05.04
(30)	Priority	2008.08.13, WO, PCT/IB08/053252
(84)	Designated Contracting States:	AT ; BE ; BG ; CH ; CY ; CZ ; DE ; DK ; EE ; ES ; FI ; FR ; GB ; GR ; HR ; HU ; IE ; IS ; IT ; LI ; LT ; LU ; LV ; MC ; MK ; MT ; NL ; NO ; PL ; PT ; RO ; SE ; SI ; SK ; SM ; TR
(73)	Proprietor	Actelion Pharmaceuticals Ltd., Gewerbestrasse 16, 4123 Allschwil, CH-Sveits
(72)	Inventor	CLOZEL, Martine, Winterhalde 3b, CH-4102 Binningen, CH-Sveits
(74)	Agent or Attorney	OSLO PATENTKONTOR AS, Postboks 7007 M, 0306 OSLO, Norge

(54)	Title	THERAPEUTIC COMPOSITIONS CONTAINING MACITENTAN
(56)	References Cited:	WO-A1-02/053557, WO-A1-2004/017993, SIDBARTA PATRICIA N ET AL: "Pharmacokinetics and pharmacodynamics of the endothelin-1 receptor antagonist act-064992 in healthy human subjects." JOURNAL OF CLINICAL PHARMACOLOGY, vol. 47, no. 9, September 2007 (2007 - 09), page 1202, XP008120182 & 36TH ANNUAL MEETING OF THE AMERICAN-COLLEGE-OF-CLINICAL-PHARMACOLOGY; SAN FRANCISCO, CA, USA; SEPTEMBER 09 -11, 2007 ISSN: 0091-2700, US-B2- 7 205 302, HOEPER M M ET AL: "New treatments for pulmonary arterial hypertension" AMERICAN JOURNAL OF RESPIRATORY AND CRITICAL CARE MEDICINE, AMERICAN LUNG ASSOCIATION, NEW YORK, NY, US, vol. 165, 1 May 2002 (2002-05-01), pages 1209-1216, XP002255303 ISSN: 1073-449X, WO-A2-2005/030187

Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters concerning the validity of the patent, language of the application/patent granted at the EPO will be used as the basis for the decision. The patent documents published by the EPO are available through Espacenet (<http://worldwide.espacenet.com>) or via the search engine on our website here: <https://search.patentstyret.no/>

Patentkrav

- 1.** Produkt inneholdende macitentan eller et farmasøytisk akseptabelt salt av denne forbindelsen, i kombinasjon med minst én forbindelse som har prostacyklinreseptor (IP) agonistegenskaper, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor
5 forbindelse som har prostacyklinreseptor (IP) agonistegenskaper er valgt fra iloprost og dens farmasøytisk akseptable salter, beraprost og dens farmasøytisk akseptable salter, 2-{4-[(5,6-difenylpyrazin-2-yl)(isopropyl)amino]butoksy}-N-(metylsulfonyl)acetamid og dets farmasøytisk akseptable salter, og {4-[(5,6-difenylpyrazin-2-yl)(isopropyl)amino]butoksy}eddiksyre og dens farmasøytisk
10 akseptable salter.
- 2.** Produkt ifølge krav 1, hvor forbindelsen som har prostacyklinreseptor (IP) agonistegenskaper er valgt fra 2-{4-[(5,6-difenylpyrazin-2-yl)(isopropyl)amino]-butoksy}-N-(metylsulfonyl)acetamid og dets farmasøytisk akseptable salter og {4-[(5,6-difenylpyrazin-2-yl)(isopropyl)amino]butoksy}eddiksyre og dens farmasøytisk
15 akseptable salter.
- 3.** Produkt ifølge krav 2, hvor forbindelsen som har prostacyklonreseptor (IP) agonistegenskaper er 2-{4-[(5,6-difenylpyrazin-2-yl)(isopropyl)amino]butoksy}-N-(metylsulfonyl)acetamid eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.
- 4.** Produkt inneholdende macitentan eller et farmasøytisk akseptabelt salt av
20 denne forbindelsen i kombinasjon med minst én forbindelse som har prostacyklinreseptor (IP) agonistegenskaper, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for terapeutisk anvendelse samtidig, separat eller over en tidsperiode for behandling av en sykdom hvor endotelin er involvert, valgt fra hypertensjon, pulmonal hypertensjon, diabetisk arteriopati, hjertesvikt, erektil dysfunksjon, angina pectoris
25 og pulmonal fibrose, hvor forbindelsen som har prostacyklinreseptor (IP) agonistegenskaper er valgt fra iloprost og dens farmasøytisk akseptable salter, beraprost og dens farmasøytisk akseptable salter, 2-{4-[(5,6-difenylpyrazin-2-yl)(isopropyl)amino]butoksy}-N-(metylsulfonyl)acetamid og dets farmasøytisk akseptable salter, og {4-[(5,6-difenylpyrazin-2-yl)(isopropyl)amino]butoksy}eddiksyre og dens
30 farmasøytisk akseptable salter.
- 5.** Produkt for anvendelse ifølge krav 4, hvor forbindelsen som har prostacyklinreseptor (IP) agonistegenskaper er valgt fra 2-{4-[(5,6-difenylpyrazin-2-yl)(isopropyl)amino]butoksy}-N-(metylsulfonyl)acetamid og dets farmasøytisk

akseptable salter, og {4-[(5,6-difenylpyrazin-2-yl)(isopropyl)amino]butoksy}-eddiksyre og dens farmasøytisk akseptable salter.

6. Produkt ifølge krav 5, hvor forbindelsen som har prostacyklinreseptor (IP) agonistegenskaper er 2-{4-[(5,6-difenylpyrazin-2-yl)(isopropyl)amino]butoksy}-N-(metylsulfonyl)acetamid eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

7. Produkt for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 4 til 6, hvor sykdommen er pulmonal hypertensjon.

8. Farmasøytisk sammensetning inneholdende, som aktiv bestanddel, macitentan, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, i kombinasjon med minst én forbindelse som har prostacyklinreseptor (IP) agonistegenskaper, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, så vel som en farmasøytisk akseptabel eksipient, hvor forbindelsen som har prostacyklinreseptor (IP) agonistegenskaper eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav er 2-{4-[(5,6-difenylpyrazin-2-yl)(isopropyl)amino]butoksy}-N-(metylsulfonyl)acetamid eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

9. Anvendelse av macitentan, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, i kombinasjon med minst én forbindelse som har prostacyklinreseptor (IP) agonistegenskaper, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for fremstilling av et medikament til behandling av en sykdom hvor endotelin er involvert, valgt fra hypertensjon, pulmonal hypertensjon, diabetisk arteriopati, hjertesvikt, erektil dysfunksjon, angina pectoris og pulmonal fibrose, hvor forbindelsen som har prostacyklinreseptor (IP) agonistegenskaper eller farmasøytisk akseptabelt salt derav er 2-{4-[(5,6-difenylpyrazin-2-yl)(isopropyl)amino]butoksy}-N-(metylsulfonyl)acetamid eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

10. Anvendelse ifølge krav 9, hvor sykdommen som skal behandles er pulmonal hypertensjon.