(12) **Translation of European patent specification**

(11) **NO/EP 2603600 B1**

(19) NO

NORWAY

(51) Int Cl.
C12P 21/06 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2019.04.29
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.11.21
(86)	European Application Nr.	11817162.8
(86)	European Filing Date	2011.08.13
(87)	The European Application's Publication Date	2013.06.19
(30)	Priority	2010.08.13, US, 373638 P 2010.08.13, US, 373701 P 2010.08.16, US, 374163 P
(84)	Designated Contracting States:	AL ; 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 ; RS ; SE ; SI ; SK ; SM ; TR
(73)	Proprietor	Aileron Therapeutics, Inc., 840 Memorial Drive, Cambridge, MA 02139, USA
(72)	Inventor	GUERLAVAIS, Vincent, 43 Kenilworth Road, Arlington MA 02476, USA KAWAHATA, Noriyuki, 79 Garnet Road, West Roxbury MA 02132, USA
(74)	Agent or Attorney	Nordic Patent Service A/S, Bredgade 30, 1260 KØBENHAVN K, Danmark

(54) Title **PEPTIDOMIMETIC MACROCYCLES**

(56) References Cited:

WO-A2-2009/126292, WO-A2-2010/033617, MICHAEL M MADDEN ET AL: "Synthesis of cell-permeable stapled peptide dual inhibitors of the p53-Mdm2/Mdmx interactions via photoinduced cycloaddition", BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS, PERGAMON, AMSTERDAM, NL, vol. 21, no. 5, 3 January 2011 (2011-01-03), pages 1472-1475, XP028144508, ISSN: 0960-894X, DOI: 10.1016/J.BMCL.2011.01.004 [retrieved on 2011-01-07], FEDERICO BERNAL ET AL: "A Stapled p53 Helix Overcomes HDMX-Mediated Suppression of p53", CANCER CELL, vol. 18, no. 5, 1 November 2010 (2010-11-01), pages 411-422, XP055116246, ISSN: 1535-6108, DOI: 10.1016/j.ccr.2010.10.024, BERNAL F ET AL: "REACTIVATION OF THE P53 TUMOR SUPPRESSOR PATHWAY BY A STAPLED P53 PEPTIDE", JOURNAL OF THE AMERICAN CHEMICAL SOCIETY, ACS PUBLICATIONS, US, vol. 129, 7 February 2007 (2007-02-07), pages 2456-2457, XP008148468, ISSN: 0002-7863, DOI: 10.1021/A0693587

Patentkrav

1. Peptidomimetisk makrosyklisk ring som forstyrrer bindingen mellom p53 og HDM2 eller HDMX, og som har en aminosyresekvens minst 60 % identisk med:
Leu Thr Phe $\$_1$ Glu Tyr Trp Ala Gln Leu $\$_2$ Ala;
hvori $\$_1$, er en α,α-disubstituert aminosyre i R-konfigurasjonen, hvori en substituent er en metylgruppe og den andre substituenten er en bindeleddgruppe til $\$_2$; og hvori $\$_2$ er en α,α-disubstituert aminosyre i S-konfigurasjonen, hvori en substituent er en metylgruppe og den andre substituenten er bindeleddgruppen til $\$_1$; og hvori bindeleddgruppen, som starter med $\$_1$ er $-(CH_2)_6-CH=CH-(CH_2)_3-$.

2. Farmasøytisk sammensetning som omfatter den peptidomimetiske makrosykliske ringen ifølge krav 1.

3. Peptidomimetisk makrosyklisk ring ifølge krav 1 for anvendelse ved behandling av kreft hos et individ.

4. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 2 for anvendelse ved behandling av kreft hos et individ.