



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3119911 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

A61K 38/05 (2006.01)

A61P 25/00 (2006.01)

C07D 233/54 (2006.01)

C12Q 1/68 (2018.01)

Norwegian Industrial Property Office

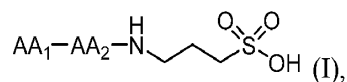
(45)	Translation Published	2023.11.06
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.08.09
(86)	European Application Nr.	15764560.7
(86)	European Filing Date	2015.03.23
(87)	The European Application's Publication Date	2017.01.25
(30)	Priority	2014.03.21, US, 201461968595 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	Alzheon, Inc., 111 Speen Street Suite 306, Framingham, MA 01701, USA
(72)	Inventor	TOLAR, Martin, c/o ALZHEON INC. 111 Speen Street Suite 306, Framingham, Massachusetts 01701, USA HEY, John, c/o ALZHEON INC. 111 Speen Street Suite 306, Framingham, Massachusetts 01701, USA KOCIS, Petr, c/o ALZHEON INC. 111 Speen Street Suite 306, Framingham, Massachusetts 01701, USA YU, Jeremy, c/o ALZHEON INC. 111 Speen Street Suite 306, Framingham, Massachusetts 01701, USA
(74)	Agent or Attorney	RWS, Europa House, Chiltern Park, Chiltern Hill, SL99FG CHALFONT ST PETER, Storbritannia

(54)	Title	COMPOUNDS FOR USE IN TREATING ALZHEIMER'S DISEASE IN APOE4+/+ PATIENTS
(56)	References Cited:	WO-A1-94/09155 WO-A2-2012/006329 US-A1- 2006 079 578 US-A1- 2008 146 642 US-A1- 2010 113 591 DATABASE MEDLINE [Online] US NATIONAL LIBRARY OF MEDICINE (NLM), BETHESDA, MD, US; December 2012 (2012-12), CALTAGIRONE CARLO ET AL: "The potential protective effect of tramiprosate (homotaurine) against Alzheimer's disease: a review.", XP002775161, Database accession no. NLM22961121 & AGING CLINICAL AND EXPERIMENTAL RESEARCH DEC 2012, vol. 24, no. 6, December 2012 (2012-12), pages 580-587, ISSN: 1720-8319 CALTAGIRONE CARLO ET AL: "The potential protective effect of tramiprosate (homotaurine) against Alzheimer's disease: a review.", AGING CLINICAL AND EXPERIMENTAL RESEARCH DEC 2012, vol. 24, no. 6, December 2012 (2012-12), pages 580-587, ISSN: 1720-8319

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/>

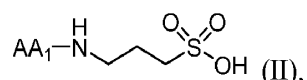
Patentkrav

1. Forbindelse valgt fra
en forbindelse av formel I:



og

en forbindelse av formel II:

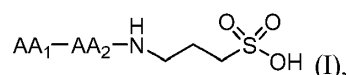


hvor i hver av AA_1 og AA_2 er en uavhengig valgt aminosyre;

for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av Alzheimers sykdom i en underpopulasjon av pasienter som bærer to kopier av et ApoE4-allel.

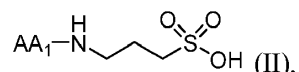
2. Forbindelse valgt fra:
tramiprosat,

en forbindelse av formel I:



og

en forbindelse av formel II:



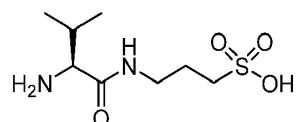
hvor i hver av AA_1 og AA_2 er en uavhengig valgt aminosyre,

for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av Alzheimers sykdom, hvor i fremgangsmåten omfatter:

(a) å identifisere om en pasient er en ApoE4 +/+ pasient, hvor i en ApoE4 +/+ pasient er en pasient som bærer to kopier av et ApoE4-allel; og

(b) å administrere forbindelsen bare hvis pasienten er en ApoE4 +/+ pasient.

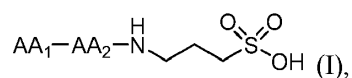
3. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 2, hvor i forbindelsen har formelen:



4. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av Alzheimers sykdom i en underpopulasjon av pasienter som bærer to kopier av et ApoE4-

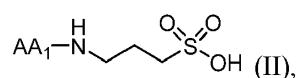
alle, hvori sammensetningen omfatter en farmasøytisk akseptabel bærer og en forbindelse valgt fra

en forbindelse av formel I:



5 og

en forbindelse av formel II:

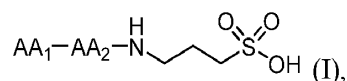


hvori hver av AA₁ og AA₂ er en uavhengig valgt aminosyre, og hvori den farmasøytiske sammensetningen er en oral doseringsform.

10

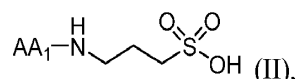
5. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av Alzheimers sykdom, hvori sammensetningen omfatter en farmasøytisk akseptabel bærer og en forbindelse valgt fra tramiprosat,

15 en forbindelse av formel I:



og

en forbindelse av formel II:



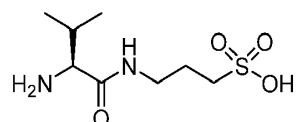
20 hvori hver av AA₁ og AA₂ er en uavhengig valgt aminosyre, og hvori den farmasøytiske sammensetningen er en oral doseringsform.

hvori fremgangsmåten omfatter:

(a) å identifisere om en pasient er en ApoE4 +/+ pasient, hvori en ApoE4 +/+ pasient er en pasient som bærer to kopier av et ApoE4-allel; og

25 (b) å administrere forbindelsen bare hvis pasienten er en ApoE4 +/+ pasient.

6. Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 4 eller krav 5, hvori forbindelsen har formelen:



30

7. Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 4–6, hvori den orale doseringsformen er valgt fra tabletter, pastiller, vandige eller

oljeaktige suspensjoner, granuler, pulvere, emulsjoner, kapsler, siruper, eliksirer, matvarer og matblandinger.

8. Forbindelsen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–3 eller den
5 farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 4–
7, hvori behandlingen av Alzheimers sykdom er reduksjonen av kognitiv nedgang
forbundet med Alzheimers sykdom.
9. Forbindelsen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–3 eller den
10 farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 4–
7, hvori behandlingsfremgangsmåten omfatter trinnet med genotyping av en pasient som
skal behandles før administrering av forbindelsen for å bestemme om pasienten har to
kopier av ApoE4-allelet.