



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3215158 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/5377 (2006.01)
A61K 31/44 (2006.01)
A61K 31/506 (2006.01)
A61K 45/06 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2019.09.30
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.05.08
(86)	European Application Nr.	15795318.3
(86)	European Filing Date	2015.11.06
(87)	The European Application's Publication Date	2017.09.13
(30)	Priority	2014.11.07, US, 201462077127 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	AI Therapeutics, Inc., 530 Old Whitfield Street, Guilford, CT 06437, USA
(72)	Inventor	BEEHARRY, Neil, 530 Old Whitfield Street, Guilford, CT 06437, USA GAYLE, Sophia, 530 Old Whitfield Street, Guilford, CT 06437, USA LANDRETTE, Sean, 530 Old Whitfield Street, Guilford, CT 06437, USA BECKETT, Paul, 530 Old Whitfield Street, Guilford, CT 06437, USA CONRAD, Chris, 530 Old Whitfield Street, Guilford, CT 06437, USA XU, Tian, 530 Old Whitfield Street, Guilford, CT 06437, USA ROTHBERG, Jonathan, M., 530 Old Whitfield Street, Guilford, CT 06437, USA LICHENSTEIN, Henri, 530 Old Whitfield Street, Guilford, CT 06437, USA
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

(54) Title **APILIMOD FOR USE IN THE TREATMENT OF RENAL CANCER**

(56) References
Cited:

WO-A1-2015/112888
WO-A2-2006/128129
XINMING CAI ET AL: "PIKfyve, a Class III PI Kinase, Is the Target of the Small Molecular IL-12/IL-23 Inhibitor Apilimod and a Player in Toll-like Receptor Signaling", CHEMISTRY AND BIOLOGY., vol. 20, no. 7, 1 July 2013 (2013-07-01), pages 912-921, XP55236360, GB ISSN: 1074-5521, DOI: 10.1016/j.chembiol.2013.05.010
ANNE-MARIE BAIRD ET AL: "IL-23R is Epigenetically Regulated and Modulated by Chemotherapy in Non-Small Cell Lung Cancer", FRONTIERS IN ONCOLOGY, vol. 3, 1 January 2013 (2013-01-01), XP055236206, CH ISSN: 2234-943X, DOI: 10.3389/fonc.2013.00162

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

- 5 **1.** Sammensetning omfattende en terapeutisk effektiv mengde apilimod eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av nyrekreft hos et individ med nyrekreft.
- 2.** Sammensetningen for anvendelsen ifølge krav 1, hvori apilimodet er apilimoddimesylat.
- 10 **3.** Sammensetningen for anvendelsen ifølge krav 1 eller 2, hvori fremgangsmåten ytterligere omfatter administrering av minst ett ytterligere aktivt middel, eventuelt hvori det minst ene ytterligere aktive middelet er et terapeutisk middel eller et ikke-terapeutisk middel eller en kombinasjon av et terapeutisk middel og et ikke-terapeutisk middel.
- 15 **4.** Sammensetningen for anvendelsen ifølge krav 3, hvori det minst ene ytterlige aktive middelet er et terapeutisk middel valgt fra gruppen bestående av en proteinkinaseinhibitor, en PD-1/PDL-1-vei-inhibitor, en kontrollpunktinhibitor, et platinabasert anti-neoplastisk middel, en topoisomeraseinhibitor, en nukleosidmetabolismeinhibitor, et alkylende middel, et interkalerende middel, et tubulinbindende middel og kombinasjoner derav.
- 20 **5.** Sammensetningen for anvendelsen ifølge krav 4, hvori det terapeutiske middelet er en proteinkinaseinhibitor, eventuelt hvori proteinkinaseinhibitoren er pazopanib eller sorafenib eller en kombinasjon derav.
- 25 **6.** Sammensetning for anvendelsen ifølge krav 4, hvori det terapeutiske middelet er en PD-1/PDL-1-vei-inhibitor, eventuelt hvori det terapeutiske middelet er valgt fra pembrolizumab (Keytruda), avelumab, atezolizumab (MPDL3280A), nivolumab (BMS-936558), pidilizumab (MK-3475), MSB0010718C og MEDI4736.
- 30 **7.** Sammensetningen for anvendelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 2-6, hvori fremgangsmåten ytterligere omfatter administrering av et ikke-terapeutisk middel valgt for å lindre én eller flere bivirkninger av apilimodet.
- 35 **8.** Sammensetningen for anvendelsen ifølge krav 3, hvori det minst ene ytterligere aktive middelet er et ikke-terapeutisk middel.

- 5 **9.** Sammensetningen for anvendelsen ifølge krav 7 eller 8, hvori det ikke-terapeutiske middelet er a) valgt fra gruppen bestående av ondansetron, granisetron, dolasetron og palonosetron eller
b) valgt fra gruppen bestående av pindolol og risperidon.
- 10 **10.** Sammensetningen for anvendelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-9, hvori den terapeutisk effektive mengden av apilimod eller apilimoddimesylat er den mengden som er effektiv til å inhibere PIKfyve-kinaseaktivitet i kreftcellene til individet.
- 15 **11.** Sammensetningen for anvendelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-10, hvori nyrekreften er refraktær mot standard behandling eller er metastatisk.
- 15 **12.** Sammensetningen for anvendelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-11, hvori nyrekreften er valgt fra klarcellet nyrekarsinom, et overgangscellekarsinom, Wilms tumor (nefroblastom), nyresarkom og godartede (ikke-cancerøse) nyretumorer, nyreadenom, onkocytom og angiomyolipom.
- 20 **13.** Sammensetningen for anvendelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-12, hvori sammensetningen er i en form som er egnet for oral eller intravenøs administrering.
- 25 **14.** Apilimod eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse i en fremgangsmåte for å inhibere proliferasjonen av nyrekreftceller hos et individ, der fremgangsmåten omfatter å bringe kreftcellen i kontakt med en mengde av apilimodet eller det farmasøytisk akseptable saltet derav, som er effektiv til å inhibere proliferasjon av cellen.
- 30 **15.** Apilimod eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse i en fremgangsmåte for å inhibere overlevelsen av en nyrekreftcelle hos et individ, der fremgangsmåten omfatter å bringe kreftcellen i kontakt med en mengde av apilimodet, eller det farmasøytisk akseptable saltet derav, som er effektiv til å inhibere PIKfyve-kinaseaktivitet i kreftcellen.