



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3347002 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/185 (2006.01)
A61K 31/205 (2006.01)
A61P 25/28 (2006.01)
C07C 309/02 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2023.08.28
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.06.07
(86)	European Application Nr.	16845181.3
(86)	European Filing Date	2016.09.09
(87)	The European Application's Publication Date	2018.07.18
(30)	Priority	2015.09.10, US, 201562216404 P 2016.02.02, US, 201662290287 P 2016.03.01, US, 201662302027 P 2016.07.22, US, 201662365809 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
	Designated Extension States:	BA ; ME
(73)	Proprietor	Alzheon, Inc., 111 Speen Street Suite 306, Framingham, MA 01701, USA
(72)	Inventor	ABUSHAKRA, Susan, c/o Alzheon Inc. 111 Speen Street Suite 306, Framingham, Massachusetts 01701, USA POWER, Aidan, c/o Alzheon Inc. 111 Speen Street Suite 306, Framingham, Massachusetts 01701, USA 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 YU, Jeremy, 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
(74)	Agent or Attorney	RWS, Europa House, Chiltern Park, Chiltern Hill, SL99FG CHALFONT ST PETER, Storbritannia

(54)	Title	TREATMENT OF ALZHEIMER'S DISEASE IN A PARTICULAR PATIENT POPULATION
(56)	References Cited:	US-A1- 2014 328 856, US-A1- 2014 220 122, US-A1- 2012 071 468, WO-A2-2015/143447 CALTAGIRONE CARLO ET AL: "The potential protective effect of tramiprosate (homotaurine) against Alzheimer's disease: a review", AGING CLINICAL AND EXPERIMENTAL RESEARCH

GERMANY DEC 2012, AGING CLINICAL AND EXPERIMENTAL RESEARCH GERMANY DEC 2012, AGING CLINICAL AND EXPERIMENTAL RESEARCH GERMANY DEC 2012, vol. 24, no. 6, 1 December 2012 (2012-12-01), pages 580-587, XP009511863, ISSN: 1720-8319, DOI: 10.3275/8585

PAUL S. AISEN ET AL: "Tramiprosate in mild-to-moderate Alzheimer's disease - a randomized, double-blind, placebo-controlled, multi-centre study (the Alphase Study)", ARCHIVES OF MEDICAL SCIENCE, vol. 1, 1 January 2011 (2011-01-01), pages 102-111, XP055568799, ISSN: 1734-1922, DOI: 10.5114/aoms.2011.20612

ABUSHAKRA SUSAN ET AL: "Tramiprosate, an oral amyloid anti-aggregation agent, shows robust cognitive efficacy in APOE4/4 homozygous ad patients: efficacy and safety analyses from two Phase 3 trials", NEUROBIOLOGY OF AGING, vol. 39, March 2016 (2016-03), page S22, XP029452728, ISSN: 0197-4580, DOI: 10.1016/J.NEUROBIOLAGING.2016.01.099

SLEEGERS ET AL.: 'The pursuit of susceptibility genes for Alzheimer's disease: progress and prospects' TRENDS IN GENETICS vol. 26, no. 2., pages 84 - 93, XP026877959

S. Abushakra ET AL: "Clinical Benefits of Tramiprosate in Alzheimer's Disease Are Associated with Higher Number of APOE4 Alleles: The "APOE4 Gene-Dose Effect"", J Prev Alz Dis, 1 January 2016 (2016-01-01), pages 219-228, XP055568838, DOI: 10.14283/jpad.2016.115
Retrieved from the Internet: URL:<http://www.jpreventionalzheimer.com/al-l-issues.html?article=240>

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. Farmasøytisk sammensetning omfattende tramiprosat, valyl-3-amino-1-propansulfonsyre, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av Alzheimers sykdom hos et individ som
5 (i) er APOE4/4-homozygot og
(ii) har en baseline Mini-mental undersøkelsesscore (MMSE-score) på ≥ 22 , innen seksti dager før første administrering av sammensetningen;
hvor fremgangsmåten omfatter administrering av 150 mg BID tramiprosat, 265 mg BID
10 av valyl-3-amino-1-propansulfonsyre, eller en ekvivalent mengde av et farmasøytisk akseptabelt salt derav.
2. Farmasøytisk sammensetning omfattende valyl-3-amino-1-propansulfonsyre eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse i behandlingen av Alzheimers sykdom hos et individ som
15 (i) er APOE4/4-homozygot, og
(ii) har en baseline MMSE-score på 18–26 innen seksti dager før den første administreringen av sammensetningen.
- 20 3. Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 2, hvor individet har en baseline MMSE-score på 22–26.
4. Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 2 eller krav 3, hvor den farmasøytiske sammensetningen leverer en dose av tramiprosat i et område på
25 100 mg–150 mg/dose.
5. Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 4, hvor den farmasøytiske sammensetningen omfatter mellom 260 og 270 mg valyl-3-amino-1-propansulfonsyre eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.
30
6. Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 5, hvor sammensetningen omfatter 265 mg valyl-3-amino-1-propansulfonsyre, og hvor sammensetningen formuleres som en øyeblikkelig frigjøring, oral tablett eller kapsel.
- 35 7. Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 2–6, hvor den farmasøytiske sammensetningen administreres to ganger daglig.

8. Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–7, hvori individet er 85 år eller yngre.

5 9. Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–8, hvori behandlingen reduserer kognitiv nedgang hos individet.

10. Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–9, hvori baseline MMSE-en ble oppnådd innen tretti dager før den første administreringen av sammensetningen.

10

11. Fremgangsmåte for å fastslå et individs egnethet for behandling med 150 mg BID tramiprosat eller 265 mg BID valyl-3-amino-1-propansulfonsyre, omfattende å fastslå APOE4-statusen til individet og alvorlighetsgraden av individets Alzheimers sykdom, hvori hvis individet er APOE4/4-homozygot og har en baseline Mini-mental undersøkelsesscore på ≥ 22 , individet fastslås å være egnet for behandling.

15

12. Fremgangsmåte for å fastslå et individs egnethet for behandling med valyl-3-amino-1-propansulfonsyre, omfattende å fastslå APOE4-statusen til individet og alvorlighetsgraden av individets Alzheimers sykdom, hvori hvis individet er APOE4/4-homozygot og har en baseline-MMSE-score på 18–26, fastslås individet å være egnet for behandling.

20

13. Fremgangsmåten ifølge krav 12, hvori individet fastslås å være egnet for behandling dersom individet har en baseline MMSE-score på 22–26.