



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3452039 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/519 (2006.01)
A61P 17/14 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2024.10.07	
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2024.07.03	
(86)	European Application Nr.	17793380.1	
(86)	European Filing Date	2017.05.04	
(87)	The European Application's Publication Date	2019.03.13	
(30)	Priority	2016.05.04, US, 201662331827 P 2016.05.19, US, 201662338869 P 2016.11.07, US, 201662418774 P 2016.11.08, US, 201662419237 P	2016.12.14, US, 201662434404 P 2017.03.02, US, 201762466358 P 2017.05.01, US, 201762492758 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	Sun Pharmaceutical Industries, Inc., 2 Independence Way, Princeton, NJ 08540, USA	
(72)	Inventor	WAGNER, Amanda, T., c/o CoNCERT Pharmaceuticals, Inc. 65 Hayden Avenue Suite 3000N, Lexington MA 02421, USA CASSELLA, James, V., c/o CoNCERT Pharmaceuticals, Inc. 65 Hayden Avenue Suite 3000N, Lexington MA 02421, USA GRAHAM, Philip, B., c/o CoNCERT Pharmaceuticals, Inc. 65 Hayden Avenue Suite 3000N, Lexington MA 02421, USA BRAMAN, Virginia, c/o CoNCERT Pharmaceuticals, Inc. 65 Hayden Avenue Suite 3000N, Lexington MA 02421, USA UTTAMSINGH, Vinita, c/o CoNCERT Pharmaceuticals, Inc. 65 Hayden Avenue Suite 3000N, Lexington MA 02421, USA VON HEHN, Jana, c/o CoNCERT Pharmaceuticals, Inc. 65 Hayden Avenue Suite 3000N, Lexington MA 02421, USA HAMILTON, Colleen, E., c/o CoNCERT Pharmaceuticals, Inc. 65 Hayden Avenue Suite 3000N, Lexington MA 02421, USA	
(74)	Agent or Attorney	Nordic Patent Service A/S, Bredgade 30, 1260 KØBENHAVN K, Danmark	

(54) Title **TREATMENT OF HAIR LOSS DISORDERS WITH DEUTERATED JAK INHIBITORS**

(56) References
Cited: US-A1- 2015 239 896, WO-A2-2015/120110, WO-A2-2012/061537
HARRIS JOHN E ET AL: "Rapid skin repigmentation on oral ruxolitinib in a patient with coexistent vitiligo and alopecia areata (AA)", JOURNAL OF THE AMERICAN ACADEMY OF DERMATOLOGY, MOSBY, INC, US, vol. 74, no. 2, 11 December 2015 (2015-12-11), pages 370-371, XP029385860, ISSN: 0190-9622, DOI: 10.1016/J.JAAD.2015.09.073

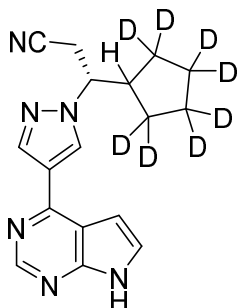
BRITTANY G. CRAIGLOW ET AL: "Topical Ruxolitinib for the Treatment of Alopecia Universalis", JAMA DERMATOLOGY, vol. 152, no. 4, 1 April 2016 (2016-04-01) , page 490, XP55642803, US ISSN: 2168-6068, DOI: 10.1001/jamadermatol.2015.4445
TUNG R: "The Development of Deuterium-Containing Drugs", INNOVATIONS IN PHARMACEUTICAL TECHNOLOGY, SAMEDAN LTD, GB, no. 32, 1 March 2010 (2010-03-01), pages 24-26, 28, XP009148260, ISSN: 1471-7204
LUZHOU XING ET AL: "Supplementary note for: Alopecia areata is driven by cytotoxic T lymphocytes and is reversed by JAK inhibition - supplementary note", NATURE MEDICINE, 17 August 2014 (2014-08-17), pages 1-124, XP055528486, New York ISSN: 1078-8956, DOI: 10.1038/nm.3645

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

Det søkes patent for:

- 5 1. Forbindelse representert av den følgende strukturelle formelen:



Forbindelse (I)

, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse i en

fremgangsmåte for behandling av en hårtapsforstyrrelse hos et menneskelig individ,

fremgangsmåten omfattende å administrere til individet ca. 16 mg/dag eller ca. 24 mg/dag av

forbindelsen (I) eller det farmasøytisk akseptable saltet derav,

- 10 hvori når en posisjon er betegnet spesifikt som «D» (deuterium), har denne posisjonen minst 90 % inkorporering av deuterium.

2. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 1, hvori når en posisjon er betegnet spesifikt som «D» (deuterium), har denne posisjonen minst 95 % inkorporering av deuterium.

- 15 3. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 2, hvori når en posisjon er betegnet spesifikt som «D» (deuterium), har denne posisjonen minst 97 % inkorporering av deuterium.

- 20 4. Forbindelsen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–3, hvori fremgangsmåten for behandling av en hårtapsforstyrrelse hos et menneskelig individ omfatter administrering til individet av forbindelsen (I) på ca. 16 mg/dag eller farmasøytisk akseptabelt salt derav.

- 25 5. Forbindelsen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–3, hvori fremgangsmåten for behandling av en hårtapsforstyrrelse hos et menneskelig individ omfatter administrering til individet av forbindelsen (I) på ca. 24 mg/dag eller farmasøytisk akseptabelt salt derav.

6. Forbindelsen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–5, hvori hårtapsforstyrrelsen er alopecia areata.

7. Forbindelsen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–4 og 6, hvori fremgangsmåten for behandling av en hårtapsforstyrrelse hos et menneskelig individ omfatter administrering til individet to ganger daglig av ca. 8 mg av forbindelse (I) eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.
- 5 8. Forbindelsen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–3, 5 og 6, hvori fremgangsmåten for behandling av en hårtapsforstyrrelse hos et menneskelig individ omfatter administrering til individet to ganger daglig på ca. 12 mg av forbindelse (I) eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.
- 10 9. Forbindelsen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–6, hvori forbindelsen administreres én gang daglig.
10. Forbindelsen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–6, hvori forbindelsen administreres to ganger daglig.
- 15 11. Forbindelsen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–10, hvori i forbindelse (I), er et hvilket som helst atom som ikke er betegnet som deuterium til stede ved sin naturlige isotopiske forekomst.
- 20 12. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 7, hvori forbindelse (I) administreres som ca. 10,5 mg av fosfatsaltet to ganger daglig.
13. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 8, hvori forbindelse (I) administreres som ca. 15,8 mg av fosfatsaltet to ganger daglig.
- 25 14. Forbindelsen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–13, hvori forbindelsen administreres oralt.
15. Forbindelsen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–14, hvori forbindelsen administreres i en farmasøytisk formulering som er en tablett.
- 30 16. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 15, hvori tablettene omfatter:
- (a) (i) ca. 5,2 vekt-% av forbindelse (I) fosfatsalt,
(ii) ca. 90,8 vekt-% mikrokrySTALLinsk cellulose,
35 (iii) ca. 2,5 vekt-% povidon,
(iv) ca. 0,5 vekt-% kolloidalt silisiumdioksid og
(v) ca. 1,0 vekt-% magnesiumstearat; eller

- (b) (i) ca. 5,3 vekt-% av forbindelse (I) fosfatsalt,
(ii) ca. 88,2 vekt-% mikrokrySTALLinsk cellulose,
(iii) ca. 5,0 vekt-% povidon,
(iv) ca. 0,5 vekt-% kolloidalt silisiumdioksid, og
5 (v) ca. 1,0 vekt-% magnesiumstearat; eller
- (c) (i) ca. 10,6 vekt-% av forbindelse (I) fosfatsalt,
(ii) ca. 82,9 vekt-% mikrokrySTALLinsk cellulose,
(iii) ca. 5,0 vekt-% povidon,
(iv) ca. 0,5 vekt-% kolloidalt silisiumdioksid og
10 (v) ca. 1,0 vekt-% magnesiumstearat.
17. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 16, hvori sammensetningen er en 200 mg tablett omfattende
- (a) ca. 10,6 mg,
15 (b) ca. 21,1 mg eller
(c) ca. 10,5 mg av forbindelse (I) fosfatsalt.