



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 4125887 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/4365 (2006.01)
A61P 13/12 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

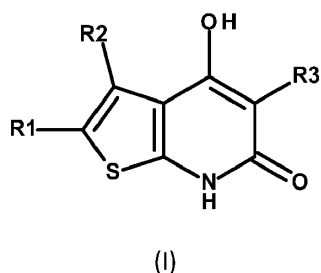
(45)	Translation Published	2024.05.06
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2024.02.07
(86)	European Application Nr.	21715913.6
(86)	European Filing Date	2021.04.02
(87)	The European Application's Publication Date	2023.02.08
(30)	Priority	2020.04.02, EP, 20167687
(84)	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	Poxel, Immeuble le Sunway 259/261 Avenue Jean Jaures, 69007 Lyon, Frankrike
(72)	Inventor	BOLZE, Sébastien, 382, chemin des Dorriers, 01600 MASSIEUX, Frankrike FOUQUERAY, Pascale, Sonnhalde 6, 5643 SINS, Sveits HALLAKOU-BOZEC, Sophie, 63ter rue des Hautes Bièvres, 92160 ANTONY, Frankrike
(74)	Agent or Attorney	RWS, Europa House, Chiltern Park, Chiltern Hill, SL99FG CHALFONT ST PETER, Storbritannia

(54)	Title	USE OF A THIENOPYRIDONE DERIVATIVE IN THE TREATMENT OF AUTOSOMAL DOMINANT POLYCYSTIC KIDNEY DISEASE (ADPKD)
(56)	References Cited:	WO-A1-2014/001554 WO-A1-2017/011917 WO-A1-2020/099678 WOUTER N. LEONHARD ET AL: "Salsalate, but not metformin or canagliflozin, slows kidney cyst growth in an adult-onset mouse model of polycystic kidney disease", EBIOMEDICINE, vol. 47, 1 September 2019 (2019-09-01), pages 436-445, XP055725203, ISSN: 2352-3964, DOI: 10.1016/j.ebiom.2019.08.041 cited in the application Anonymous: "Poxel - Corporate Presentation", , 1 January 2021 (2021-01-01), pages 1-57, XP055806712, Retrieved from the Internet: URL:http://docs.publicnow.com/viewDoc.asp? filename=162996\EXT\770CCE7FFEA78BB077D515 2ACF6141EB595F13B1_EB6389C01E39084E69636BF_AA6902A607FB4E3EE.PDF [retrieved on 2021-05-21]

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. Tienopyridonderivat av formel (I):



5 hvori:

R1 representerer et hydrogenatom eller et halogenatom,

R2 representerer en indanyl- eller tetralinylgruppe, substituert eller ikke med én eller flere grupper valgt fra halogenatomer, alkylgrupper, hydroksy, alkoksygrupper, amino, mono-

10 alkylaminokarbonylgrupper, karboksamid-, cyano-, alkylsulfonyl- og trifluormetylgrupper,

R3 representerer en arylgruppe, substituert eller ikke med ett eller flere atomer eller grupper valgt fra halogenatomer, alkylgrupper, hydroksy, alkoksygrupper, aralkyloksygrupper, amino, mono- eller di-alkylaminogru-

15 cyano-, alkylsulfonyl- og trifluormetylgrupper,

eller dens farmasøytisk akseptable salter og/eller solvater,

eller en farmasøytisk sammensetning omfattende det samme,

for anvendelse i behandlingen av autosomal dominerende polycystisk nyresykdom (ADPKD).

20

2. Tienopyridonderivatet av formel (I) eller en farmasøytisk sammensetning omfattende det samme for anvendelse ifølge krav 1, hvori tienopyridonderivatet administreres én eller to ganger daglig i en daglig dose på 0,5 mg til 3000 mg for en menneskelig pasient, fortrinnsvis fra 20 mg til 1000 mg, mer foretrukket fra 60 mg til 500

25

mg.

3. Tienopyridonderivatet av formel (I) eller en farmasøytisk sammensetning omfattende det samme for anvendelse ifølge krav 1 eller 2, hvori tienopyridonderivatet eller den farmasøytiske sammensetningen er effektiv for å forebygge eller begrense

30

cystevest eller redusere cystevolum.

4. Tienopyridonderivatet av formel (I) for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvori minst én av de følgende betingelsene er oppfylt og fortrinnsvis alle av dem:

- R1 representerer et halogenatom, spesielt et kloratom,
- 5 • R2 er usubstituert eller substituert med 1 eller 2 substituenten som inkluderer minst én hydroksygruppe,
- R2 er en tetralinylgruppe,
- R3 representerer en fenylgruppe, som er usubstituert eller substituert med 1 eller 2 substituenten,
- 10 • forbindelsen av formel (I) er i form av et salt, fortrinnsvis et natrium- eller kaliumsalt, mer foretrukket et kaliumsalt,
- forbindelsen av formel (I) er i form av et solvat, fortrinnsvis et hydrat, mer foretrukket et monohydrat.

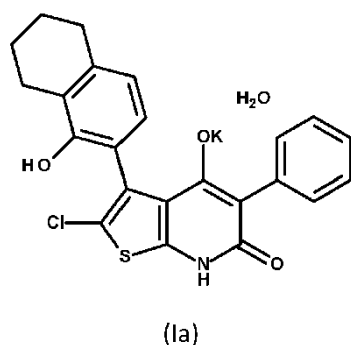
15 5. Tienopyridonderivatet av formel (I) for anvendelse ifølge krav 4, hvori minst én av de følgende betingelsene er oppfylt og fortrinnsvis alle av dem:

- R1 representerer et halogenatom, spesielt et kloratom,
- R2 er substituert med 1 eller 2 substituenten som inkluderer minst én hydroksygruppe,
- R2 er en tetralinylgruppe,
- 20 • R3 representerer en fenylgruppe, som er usubstituert,
- forbindelsen av formel (I) er i form av et salt, fortrinnsvis et natrium- eller kaliumsalt, mer foretrukket et kaliumsalt,
- forbindelsen av formel (I) er i form av et solvat, fortrinnsvis et hydrat, mer foretrukket et monohydrat.

25

6. Tienopyridonderivatet av formel (I) for anvendelse ifølge krav 5, som er valgt fra 2-klor-4-hydroksy-3-(5-hydroksytetralin-6-yl)-5-fenyl-7H-tieno[2,3-b]pyridin-6-on og et farmasøytisk akseptabelt salt og/eller solvat derav.

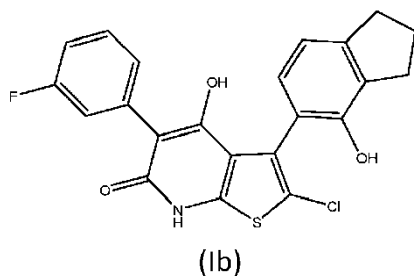
30 7. Tienopyridonderivatet av formel (I) for anvendelse ifølge krav 6, som er monohydratkaliumsaltet av 2-klor-4-hydroksy-3-(5-hydroksytetralin-6-yl)-5-fenyl-7H-tieno[2,3-b]pyridin-6-on som har formel (Ia):



8. Tienopyridonderivatet av formel (I) for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvori minst én av de følgende betingelsene er oppfylt og fortrinnsvis alle av dem:

- R1 representerer et halogenatom, spesielt et kloratom,
- R2 er substituert med 1 eller 2 substituerter som inkluderer minst én hydroksygruppe,
- R2 er en indanylgruppe,
- R3 representerer en fenylgruppe, som er usubstituert eller substituert med 1 eller 2 substituerter.

9. Tienopyridonderivatet av formel (I) for anvendelse ifølge krav 8, som er 2-klor-5-(4-fluorfenyl)-4-hydroksy-3-indan-5-yl-7H-tieno[2,3-b]pyridin-6-on som har formel (Ib):



10. Tienopyridonderivatet av formel (I) for anvendelse ifølge krav 8, som er 2-klor-4-hydroksy-3-indan-5-yl-5-fenyl-7H-tieno[2,3-b]pyridin-6-on som har formel (Ic):

