

(12) BREVET D'INVENTION

- (11) N° de publication : **MA 41481 B1**
- (43) Date de publication : **31.03.2022**
- (51) Cl. internationale :
**A61K 31/426; A61P 37/06;
A61P 1/04; A61P 11/02;
A61P 11/06; A61P 13/12;
A61P 17/00; A61P 17/06;
A61P 19/02; A61P 25/00;
A61P 27/02; A61P 3/10;
A61P 35/00; A61P 35/04;
A61P 1/00**
-
- (21) N° Dépôt :
41481
- (22) Date de Dépôt :
10.12.2015
- (30) Données de Priorité :
11.12.2014 WO PCT/EP2014/077469
- (86) Données relatives à la demande internationale selon le PCT:
PCT/EP2015/079208 10.12.2015
- (71) Demandeur(s) :
Actelion Pharmaceuticals Ltd, Gewerbestrasse 16 4123 Allschwil (CH)
- (72) Inventeur(s) :
DINGEMANSE, Jasper ; HOCH, Matthias ; KRAUSE, Andreas
- (74) Mandataire :
SABA & CO.,TMP
- (86) N° de dépôt auprès de l'organisme de validation: **EP15807916.0**
-
- (54) Titre : **RÉGIME POSOLOGIQUE POUR PONESIMOD, UN AGONISTE DU RÉCEPTEUR S1P1 SÉLECTIF**
- (57) Abrégé : La présente invention concerne un régime posologique pour la (R)-5-[3-chloro-4-(2,3-dihydroxy-propoxy)-benz[Z]ylidène]-2-([Z]-propylimino)-3-o-tolyl-thiazolidin-4-one.

REVENDICATIONS

1. (R)-5-[3-chloro-4-(2,3-dihydroxy-propoxy)-ben[Z]ylidène]-2-([Z]-propylimino)-3-o-tolyl-thiazolidin-4-one (Composé 1), ou un sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci, pour une utilisation dans le traitement d'une maladie ou d'un trouble associé à un système immunitaire activé, choisi dans le groupe constitué par : un rejet d'organes greffés tels qu'un rein, un foie, un cœur, un poumon, un pancréas, une cornée, et de la peau ; une réaction du greffon contre l'hôte ; les syndromes auto-immuns englobant la polyarthrite rhumatoïde, la sclérose en plaques, les maladies intestinales inflammatoires telles que la maladie de Crohn et la recto-colite hémorragique, le psoriasis, l'arthrite psoriasique, une thyroïdite telle que la thyroïdite de Hashimoto, et une uvéo-rétinite ; les maladies atopiques telles qu'une rhinite, une conjonctivite, et une dermite ; l'asthme ; le diabète de type I ; les maladies auto-immunes post-infectieuses, englobant le rhumatisme articulaire aigu et la glomérulonéphrite post-infectieuse ; les cancers solides ; et les métastases tumorales ; dans lequel, durant l'instauration du traitement, ou suite à une réinstauration du traitement après interruption du médicament, le Composé 1, ou un sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci, est destiné à être administré à un sujet humain par voie orale une fois par jour comme suit : 2 mg de Composé 1 les jours 1 et 2 ; 3 mg de Composé 1 les jours 3 et 4 ; 4 mg de Composé 1 les jours 5 et 6 ; 5 mg de Composé 1 le jour 7 ; 6 mg de Composé 1 le jour 8 ; 7 mg de Composé 1 le jour 9 ; 8 mg de Composé 1 le jour 10 ; et 9 mg de Composé 1 le jour 11 ; suivis par (a) une dose d'entretien de 10 mg de Composé 1 destinée à être administrée par voie orale une fois par jour à partir du jour 12 ; ou (b) 10 mg de Composé 1 destinés à être administrés par voie orale une fois par jour pendant 2, 3 ou 4 jours, suivis de la dose d'entretien de 20 mg de Composé 1 destinée à être administrée par voie orale une fois par jour.

2. Composé 1, ou un sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci, pour une utilisation selon la revendication 1, dans lequel le Composé 1, ou un sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci, est destiné à être administré à un
5 sujet humain par voie orale une fois par jour comme suit : 2 mg de Composé 1 les jours 1 et 2 ; 3 mg de Composé 1 les jours 3 et 4 ; 4 mg de Composé 1 les jours 5 et 6 ; 5 mg de Composé 1 le jour 7 ; 6 mg de Composé 1 le jour 8 ; 7 mg de
10 Composé 1 le jour 9 ; 8 mg de Composé 1 le jour 10 ; et 9 mg de Composé 1 le jour 11 ; suivis par 10 mg de Composé 1 destinés à être administrés par voie orale une fois par jour pendant 2, 3 ou 4 jours ; suivis de la dose d'entretien de 20 mg de Composé 1 destinée à être administrée par voie orale
15 une fois par jour.

3. Composé 1, ou un sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci, pour une utilisation selon la revendication 1, dans lequel le Composé 1, ou un sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci, est destiné à être administré à un
20 sujet humain par voie orale une fois par jour comme suit : 2 mg de Composé 1 les jours 1 et 2 ; 3 mg de Composé 1 les jours 3 et 4 ; 4 mg de Composé 1 les jours 5 et 6 ; 5 mg de Composé 1 le jour 7 ; 6 mg de Composé 1 le jour 8 ; 7 mg de Composé 1 le jour 9 ; 8 mg de Composé 1 le jour 10 ; et 9 mg de Composé 1 le jour 11 ; suivis par 10 mg de Composé 1 destinés à être administrés par voie orale une fois par jour les jours 12, 13 et 14 ; suivis de la dose d'entretien de 20 mg de Composé 1 destinée à être administrée par voie orale
25 à partir du jour 15.

4. Composé 1, ou un sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci, pour une utilisation selon la revendication 1, dans lequel le Composé 1, ou un sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci, est destiné à être administré à un
35 sujet humain par voie orale une fois par jour comme suit : 2 mg de Composé 1 les jours 1 et 2 ; 3 mg de Composé 1 les

jours 3 et 4 ; 4 mg de Composé 1 les jours 5 et 6 ; 5 mg de Composé 1 le jour 7 ; 6 mg de Composé 1 le jour 8 ; 7 mg de Composé 1 le jour 9 ; 8 mg de Composé 1 le jour 10 ; et 9 mg de Composé 1 le jour 11 ; suivis de la dose d'entretien de
5 10 mg de Composé 1 destinée à être administrée par voie orale à partir du jour 12.

5. Composé 1, ou un sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci, pour une utilisation selon l'une quelconque des
10 revendications 1 à 4, dans lequel la maladie ou le trouble devant être traité est choisi dans le groupe constitué par : un rejet d'organes greffés tels qu'un rein, un foie, un cœur et un poumon ; une réaction du greffon contre l'hôte ; les syndromes auto-immuns choisis parmi la polyarthrite
15 rhumatoïde, la sclérose en plaques, le psoriasis, l'arthrite psoriasique, la maladie de Crohn, et la thyroïdite de Hashimoto ; et une dermatite atopique.

6. Composé 1, ou un sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci, pour une utilisation selon l'une quelconque des
20 revendications 1 à 4, dans lequel la maladie ou le trouble devant être traité est une réaction du greffon contre l'hôte.

7. Composé 1, ou un sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci, pour une utilisation selon l'une quelconque des
25 revendications 1 à 4, dans lequel la maladie ou le trouble devant être traité est une réaction chronique du greffon contre l'hôte.

30 8. Composé 1, ou un sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci, pour une utilisation selon l'une quelconque des revendications 1 à 4, dans lequel la maladie ou le trouble devant être traité est une sclérose en plaques.

35 9. Composé 1, ou un sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci, pour une utilisation selon l'une quelconque des revendications 1 à 4, dans lequel la maladie ou le trouble

devant être traité est une sclérose en plaques récidivante.

10. Composé 1, ou un sel pharmaceutiquement acceptable de celui-ci, pour une utilisation selon l'une quelconque des
5 revendications 1 à 4, dans lequel la maladie ou le trouble devant être traité est une sclérose en plaques cyclique.