

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

PATENTTI- JA REKISTERIHALLITUS
PATENT- OCH REGISTERSTYRELSEN
FINNISH PATENT AND REGISTRATION OFFICE

(10) **FI/EP3758708 T3**
(12) **EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS**
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION

(45) Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning - **18.02.2025**
Translation available to the public

(97) Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för **27.11.2024**
det europeiska patentet - Date of grant of European patent

(51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -
International patent classification
A61K 31/553 (2006 . 01)
A61P 11/06 (2006 . 01)

(96) Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan - **EP19716296.9**
European patent application

(22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date **01.03.2019**

(97) Patenttihakemuksen julkiseksitilopäivä - Patentansökans **06.01.2021**
publiceringsdag - Patent application available to the public

(86) Kansainvälinen hakemus - Internationell **01.03.2019 PCT/EP2019055138**
ansökan - International application

(30) Etuoikeus - Prioritet - Priority
01.03.2018 US US201862636944 P

(73) Haltija - Innehavare - Holder
1• AstraZeneca AB, 151 85 Södertälje, (SE)

(72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor
1• WIKSTRÖM, Håkan, c/o Astrazeneca R&D Gothenberg, 431 83 Mölndal, (SE)
2• LUDVIGSSON, Jufang Wu, c/o Astrazeneca R&D Gothenberg, 431 83 Mölndal, (SE)
3• ANDERSSON, Thomas, c/o Astrazeneca R&D Gothenberg, 431 83 Mölndal, (SE)

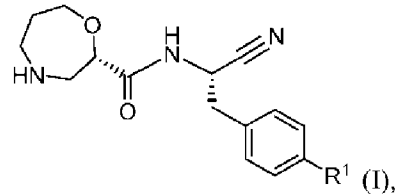
(74) Asiamies - Ombud - Agent
Papula Oy, P.O.Box 981, 00101 Helsinki, (FI)

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention
(2S)-{(1S)-1-SYANO-2-[4-(3-METYyli-2-OKSO-2,3-DIHYDRO-1,3-BENTSOKSATSOL-5-YYLI)FENYyli]ETYYLI}-1,4-OKSATSEPAANI-2-KARBOKSAMIDIA KÄSITTÄVIÄ FARMASEUTTISIA KOOSTUMUKSIA
PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS COMPRISING (2S)-{(1S)-1-CYANO-2-[4-(3-METHYL-2-OXO-2,3-DIHYDRO-1,3-BENZOXAZOL-5-YL)PHENYL]ETHYL}-1,4-OXAZEPANE-2-CARBOXAMIDE

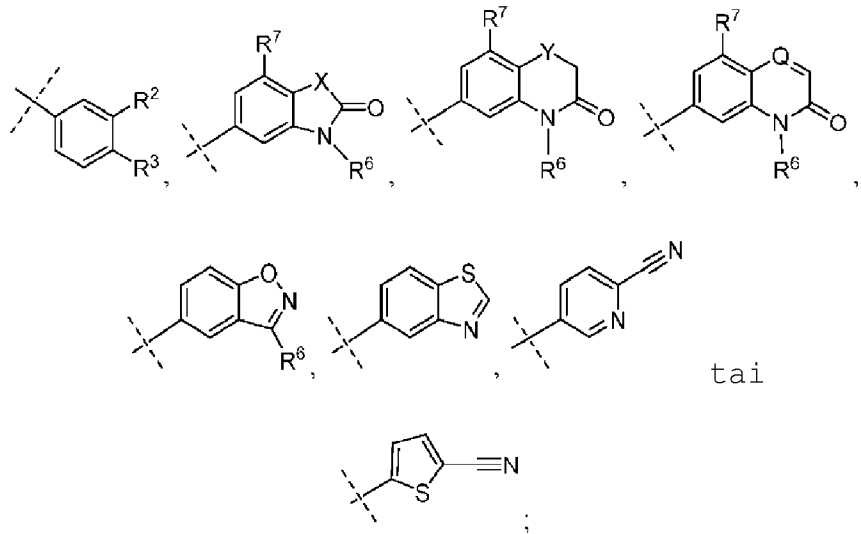
PATENTTIVAATIMUKSET

1. Farmaseuttinen koostumus, joka käsittää seuraavia komponentteja (a) - (f):

- 5 (a) 1,0 painoprosenttia - 30 painoprosenttia yhdistettä, jolla on kaava (I), tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävää suolaa;



10 jossa,
R¹ on



15

R² on vety, F, Cl, Br, OSO₂C₁-₃-alkyyli tai C₁-₃-alkyyli;

20 R³ on vety, F, Cl, Br, CN, CF₃, SO₂C₁-₃-alkyyli, CONH₂ tai SO₂NR⁴R⁵, jossa R⁴ ja R⁵ muodostavat yhdessä sen typpiätomien kanssa, johon ne ovat kiinnittyneet, atsetidiini-, pyrrolidiini- tai piperidiinirenkaan; tai

25 R⁶ on C₁-₃-alkyyli, joka on valinnaisesti substituoitu 1, 2 tai 3 F:llä ja/tai valinnaisesti

OH:lla, OC₁₋₃-alkyyllilla, N(C₁₋₃-alkyyli)₂:lla, syklopropyyllilla tai tetrahydropyraanilla;

R⁷ on vety, F, Cl tai CH₃;

X on O, S tai CF₂;

5 Y on O tai S;

Q on CH tai N;

(b) 55 painoprosenttia - 75 painoprosenttia farmaseuttista laimenninta;

10 (c) 15 painoprosenttia - 25 painoprosenttia puristusapuainetta;

(d) 3,0 painoprosenttia - 5,0 painoprosenttia farmaseuttista hajotusainetta;

(e) 0,00 painoprosenttia - 1,0 painoprosenttia farmaseuttista massan liukuainetta; ja

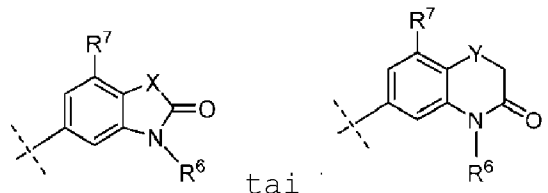
15 (f) 2 painoprosenttia - 6 painoprosenttia farmaseuttista muotin liukuainetta;

jossa komponenttien (a) - (f) painot ovat yhteensä 100 painoprosenttia;

20 jossa farmaseuttinen muotin liukasteon glyserolibehenaattia, farmaseuttinen laimennin on mikrokiteistä selluloosaa, puristusapuaine on kaksiemäksistä kalsiumfosfaattidihydraattia, farmaseuttinen hajotusaine on natriumtärkkelysglykolaattia ja farmaseuttinen massan liukuaine on piidioksidia.

25 2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen farmaseuttinen koostumus, jossa

R¹ on



30

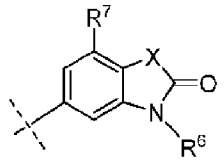
X on O, S tai CF₂;

Y on O tai S;

R⁶ on C₁₋₃-alkyyli, joka on valinnaisesti substituoitu 1, 2 tai 3 F:llä ja valinnaisesti

OH:lla, OC₁₋₃-alkyyllilla, N(C₁₋₃-alkyyli)₂:lla, syklopropyyllilla tai tetrahydropyraanilla; ja R⁷ on vety, F, Cl tai CH₃.

3. Patenttivaatimuksen 1 tai 2 mukainen farmaseuttinen koostumus, jossa R¹ on



4. Patenttivaatimuksen 3 mukainen farmaseuttinen koostumus, jossa X on O, S tai CF₂; R⁶ on C₁₋₃-alkyyli, joka on valinnaisesti substituoitu 1, 2 tai 3 F:llä; ja R⁷ on vety, F, Cl tai CH₃.

5. Jonkin patenttivaatimuksista 1 - 4 mukainen farmaseuttinen koostumus, jossa kaavan (I) yhdiste on (2S)-N-{(1S)-1-syano-2-[4-(3-metyyli-2-okso-2,3-dihydro-1,3-bentsoksatsol-5-yyli)fenyyli]etyyli}-1,4-oksatsepaani-2-karboksamidi (yhdiste A) tai yhdisteen A farmaseuttisesti hyväksyttävä suola.

6. Patenttivaatimuksen 5 mukainen farmaseuttinen koostumus, jossa yhdistettä A on läsnä 3 painoprosenttia - 10 painoprosenttia.

7. Patenttivaatimuksen 6 mukainen farmaseuttinen koostumus, jossa glyserolibehenaattia on läsnä 2,5 painoprosenttia - 4,5 painoprosenttia.

8. Patenttivaatimuksen 6 tai patenttivaatimuksen 7 mukainen farmaseuttinen koostumus, jossa piidioksidia on läsnä 0,05 painoprosenttia - 0,25 painoprosenttia.

9. Jonkin patenttivaatimuksista 6 - 8 mukainen farmaseuttinen koostumus, jossa natriumtärkkelysglykolaattia on läsnä 3,5 painoprosenttia - 4,5 painoprosenttia.

10. Jonkin patenttivaatimuksista 6 - 9 mukainen farmaseuttinen koostumus, jossa kaksiemäksistä

kalsiumfosfaattidihydraattia on läsnä 18 painoprosenttia - 22 painoprosenttia.

11. Jonkin patenttivaatimuksista 6 - 10 mukainen farmaseuttinen koostumus, jossa mikrokiteistä selluloosaa on läsnä 55 painoprosenttia - 70 painoprosenttia.

12. Jonkin patenttivaatimuksista 1 - 11 mukainen farmaseuttinen koostumus, jossa kaavan (I) yhdiste on yhdisteen A vapaa emäs.

10 13. Jonkin patenttivaatimuksista 1 - 12 mukainen farmaseuttinen koostumus, jossa kaavan (I) yhdistettä on läsnä farmaseuttisessa koostumuksessa (a) 5 mg - 50 mg, (b) 10 mg - 40 mg, (c) 10 mg, (d) 25 mg tai (e) 40 mg.

15 14. Jonkin patenttivaatimuksista 1 - 13 mukainen farmaseuttinen koostumus käytettäväksi hengitysteitä ahtauttavan taudin hoitamisessa sen tarpeessa olevassa potilaassa.

20 15. Farmaseuttinen koostumus käytettäväksi patenttivaatimuksen 14 mukaisesti, jossa hengitysteitä ahtauttava tauti on (a) bronkiektasiatauti, (b) keuhkoahtaumatauti (COPD), (c) astma tai (d) kystinen fibroosi.

25 16. Farmaseuttinen koostumus käytettäväksi patenttivaatimuksen 15 mukaisesti, jossa hengitysteitä ahtauttava tauti on (a) bronkiektasiatauti.

30 17. Farmaseuttinen koostumus käytettäväksi patenttivaatimuksen 16 mukaisesti, jossa bronkiektasiatauti on kystiseen fibroosiin liittymätön bronkiektasiatauti.

18. Farmaseuttinen koostumus käytettäväksi patenttivaatimuksen 15 mukaisesti, jossa hengitysteitä ahtauttava tauti on (d) kystinen fibroosi.

35 19. Jonkin patenttivaatimuksista 1 - 13 mukainen farmaseuttinen koostumus käytettäväksi neutrofii-lien sytoplasmaplastinivasta-aineisiin (ANCA) liittyvän vaskuliitin hoitamisessa sen tarpeessa olevassa potilaassa.

20. Farmaseuttinen koostumus käytettäväksi patenttivaatimuksen 19 mukaisesti, jossa ANCA-vaskuliitti on granulomatoottinen polyangiitti (GPA).