

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

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

(10) **FI/EP3911648 T3**
(12) **EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS**
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION

- (45) Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning - Translation available to the public **10.01.2025**
- (97) Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för det europeiska patentet - Date of grant of European patent **23.10.2024**
- (51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering - International patent classification
C07D 401/14 (2006 . 01)
A61K 31/506 (2006 . 01)
A61P 3/06 (2006 . 01)
A61P 9/00 (2006 . 01)
- (96) Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan - European patent application EP20740953.3
- (22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date **16.01.2020**
- (97) Patenttihakemuksen julkiseksitulospäivä - Patentansökans publiceringsdag - Patent application available to the public **24.11.2021**
- (86) Kansainvälinen hakemus - Internationell ansökan - International application **16.01.2020 PCT/US2020013881**
- (30) Etuoikeus - Prioritet - Priority
18.01.2019 US US201962794234 P

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

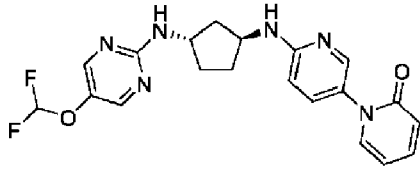
(72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor
1• SERRANO-WU, Michael H., 4 Elizabeth Road, Belmont, MA 02478, (US)
2• CHAMBERS, Mark, Chesterford Research Park, Cambridge CB10 1XL, (GB)
3• GOLDSMITH, Erica, Chesterford Research Park, Cambridge CB10 1XL, (GB)
4• TIERNEY, Jason, Chesterford Research Park, Cambridge CB10 1XL, (GB)
5• JANDU, Karamjit, Chesterford Research Park, Cambridge CB10 1XL, (GB)
6• CLARK, David, Chesterford Research Park, Cambridge CB10 1XL, (GB)
7• HINCHLIFFE, Paul, Chesterford Research Park, Cambridge CB10 1XL, (GB)

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

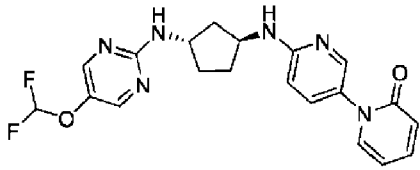
(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention
6'-[[[(1S,3S)-3-[[5-(DIFLUOROMETOKSI)-2-PYRIMIDINYLI]AMINO]SYKLOPENTYYLI]AMINO][1(2H),3'-BIPYRIDIN]-2-ONI PCSK9:N ESTÄJÄNÄ JA MENETELMÄT SEN KÄYTTÖÖN
6'-[[[(1S,3S)-3-[[5-(DIFLUOROMETHOXY)-2-PYRIMIDINYLI]AMINO]CYCLOPENTYL]AMINO][1(2H),3'-BIPYRIDIN]-2-ONE AS PCSK9 INHIBITOR AND METHODS OF USE THEREOF

PATENTTIVAATIMUKSET

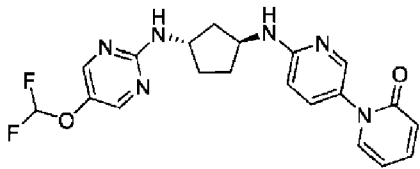
1. Yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyt-
tävä suola, joka on:



5 2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste,
joka on:



3. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste,
joka on



10 :n farmaseuttisesti hyväksyttävä
suola.

4. Farmaseuttinen koostumus, joka käsittää
jonkin patenttivaatimuksista 1-3 mukaisen yhdisteen tai
sen farmaseuttisesti hyväksyttävän suolan ja yhden tai
15 useamman farmaseuttisesti hyväksyttävän apuaineen.

5. Jokin patenttivaatimuksista 1-3 mukainen
yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola käy-
tettäväksi lääkkeenä.

6. Jokin patenttivaatimuksista 1-3 mukainen
20 yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola käy-
tettäväksi sydän- ja verisuonisairauksien hoidossa.

7. Yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyt-
tävä suola käytettäväksi sydän- ja verisuonisairauksien
hoidossa patenttivaatimuksen 6 mukaisesti, jossa sydän-
25 ja verisuonisairaus on valittu hyperkolesterolemian,
hyperlipidemian, hyperlipoproteinemian, hypertrigly-
seridemian, dyslipidemian, dyslipoproteinemian,

ateroskleroosin, hepaattisen steatoosin, metabolisen oireyhtymän ja sepelvaltimotaudin joukosta.

8. Yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola käytettäväksi sydän- ja verisuonisairauksien hoidossa patenttivaatimuksen 6 tai 7 mukaisesti, jossa sydän- ja verisuonitauti on -

- a. familiaalinen hyperkolesterolemia;
- b. autosomaalisesti dominantti hyperkolesterolemia; tai
- 10 c. ateroskleroosi.

9. Yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola käytettäväksi sydän- ja verisuonisairauksien hoidossa jonkin patenttivaatimuksista 6-8 mukaisesti, jossa -

- 15 a. seerumin kiertävän kolesterolin taso on alentunut kohteessa;
- b. seerumin kiertävän LDL-kolesterolin taso on alentunut kohteessa;
- c. verenkierrossa olevan seerumin VLDL- kolesterolitaso on alentunut kohteessa;
- 20 d. seerumin triglyseriditaso on alentunut kohteessa; tai
- e. seerumin seerumin lipoproteiini A:n taso on alentunut kohteessa.

25 10. Yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola käytettäväksi sydän- ja verisuonisairauksien hoidossa jonkin patenttivaatimuksista 6-9 mukaisesti, joka käsittää lisäksi yhden tai useamman muun terapeut-

30 11. Yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola käytettäväksi sydän- ja verisuonisairauksien hoidossa patenttivaatimuksen 10 mukaisesti, jossa yksi tai useampi terapeut-

35 tinen lisäaine on valittu seuraavista: alirokumabi, evolokumabi, bokositsumabi, RG7652, LY3015014, mAb316P, berberiini, kversetiini, etsetimbi, polikosanoli, BMS-962476, atorvastatiini, serivastatiini, fluvastatiini, lovastatiini, mevastatiini,

pitavastatiini, pravastatiini, rosuvastatiini ja simvastatiini.

12. Yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola käytettäväksi sydän- ja verisuonisairauksien hoidossa patenttivaatimuksen 10 mukaisesti, jossa yksi tai useampi muu terapeuttinen aine valitaan HMG-CoA-reduktaasin estäjästä, HMG-CoA-syntaasin estäjästä, HMG-CoA-reduktaasin geeniekspression inhibiittorista, HMG-CoA-syntaasin geeniekspression inhibiittorista, MTP:n/Apo B:n erittymisen inhibiittorista, CETP:n estäjästä, sappihapon imeytymisen estäjästä, kolesterolin imeytymisen estäjästä, kolesterolisynteesin estäjästä, skvaleenisyntetaasin estäjästä, skvaleeniepoksidaasin estäjästä, skvaleenisyklaasin estäjästä, yhdistetty skvaleeniepoksidaasi/svaleenisyklaasin estäjästä, fibraattista, niasiinista, niasiinin ja lovastatiinin yhdistelmästä, ioninvaihtohartsista, antioksidantista, ACAT:n estäjästä, sappihapposekvestrantista ja PCSK9:n translaation estäjästä.

13. Yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola käytettäväksi sydän- ja verisuonisairauksien hoidossa patenttivaatimuksen 10 mukaisesti, jossa yksi tai useampi muu terapeuttinen aine on statiini.

14. Yhdiste tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola käytettäväksi sydän- ja verisuonisairauksien hoidossa patenttivaatimuksen 10 mukaisesti, jossa yksi tai useampi muu terapeuttinen lisäaine on valittu atorvastatiinin, serivastatiinin, fluvastatiinin, lovastatiinin, mevastatiinin, pitavastatiinin, pravastatiinin, rosuvastatiinin ja simvastatiinin joukosta.