



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2968173 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/20 (2006.01)
A61K 31/496 (2006.01)
A61P 9/04 (2006.01)
C07D 213/75 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.02.22
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.10.14
(86)	European Application Nr.	14719472.4
(86)	European Filing Date	2014.03.14
(87)	The European Application's Publication Date	2016.01.20
(30)	Priority	2013.03.14, US, 201361785763 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	Amgen Inc., 1 Amgen Center Drive, Thousand Oaks, California 91320-1799, USA Cytokinetics, Inc., 280 East Grand Avenue, South San Francisco, CA 94080, USA
(72)	Inventor	BI, Mingda, 3853 Santa Lucia Street, Simi Valley, CA 93063, USA KUEHL, Robert, 23 Medau Place, San Francisco, CA 94133, USA
(74)	Agent or Attorney	TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

(54)	Title	HETEROCYCLIC COMPOUNDS AND THEIR USES
(56)	References Cited:	US-A1- 2007 161 617

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. En farmasøytisk formulering som omfatter:

et farmasøytisk akseptabelt salt av omecamtiv mecarbil, eller et farmasøytisk
akseptabelt hydrat derav;
et kontrollert frigjøringsmiddel;
et pH-modifiserende middel valgt fra gruppen bestående av fumarsyre, vinsyre,
glutaminsyre, og en hvilken som helst kombinasjon derav;
et fyllstoff; og
et smøremiddel.

2. En farmasøytisk formulering i henhold til krav 1, hvor det farmasøytisk akseptable saltet av omecamtiv mecarbil eller det farmasøytisk akseptable hydratet derav er omecamtiv mecarbil dihydrokloridhydrat.

3. En farmasøytisk formulering i henhold til krav 1 eller 2, hvor det pH-modifiserende midlet er fumarsyre.

4. En farmasøytisk formulering i henhold til et hvilket som helst av kravene 1-3, hvor fyllstoffet er valgt fra stivelse, laktose, mannitol, cellulosederivater, kalsiumfosfat, et sukker, og en hvilken som helst kombinasjon derav.

5. En farmasøytisk formulering i henhold til et hvilket som helst av kravene 1-4, hvor det kontrollert frigjøringsmidlet omfatter hypromellose som har en viskositet på 100,000 mPa.s ved 2 % konsentrasjon i vann ved 20 °C.

6. En farmasøytisk formulering i henhold til et hvilket som helst av kravene 1-4, hvor det kontrollert frigjøringsmidlet omfatter hypromellose som har en viskositet på 100 mPa.s ved 2 % konsentrasjon i vann ved 20 °C.

7. En farmasøytisk formulering i henhold til et hvilket som helst av kravene 1-4, hvor det kontrollert frigjøringsmidlet er en blanding av hypromellose som har en viskositet på 100,000 mPa.s ved 2 % konsentrasjon i vann ved 20 °C og hypromellose som har en viskositet på 100 mPa.s ved 2 % konsentrasjon i vann ved 20 °C.

8. En farmasøytisk formulering i henhold til et hvilket som helst av kravene 1-7, hvor fyllstoffet er en kombinasjon av mikrokrySTALLinsk cellulose og laktosemonohydrat.

9. En farmasøytisk formulering i henhold til et hvilket som helst av kravene 1-8, hvor smøremidlet er magnesiumstearat.

10. En farmasøytisk formulering i henhold til et hvilket som helst av kravene 1-9, hvor formuleringen er i formen av en tablett.

11. En farmasøytisk formulering i henhold til et hvilket som helst av kravene 1-10 som omfatter:

3-30 vekt% av et farmasøytisk akseptabelt salt av omecamtiv mecarbil eller et farmasøytisk akseptabelt hydrat derav;

15-35 vekt% kontrollert frigjøringsmiddel;

20-45 vekt% pH-modifiserende middel;

25-65 vekt% fyllstoff; og

0,1-1,0 vekt% smøremiddel.

12. En fremgangsmåte for å lage en farmasøytisk formulering i henhold til krav 1, som omfatter:

å blande en blanding som omfatter et farmasøytisk akseptabelt salt av omecamtiv mecarbil eller et farmasøytisk akseptabelt hydrat derav, et kontrollert frigjøringsmiddel, et pH-modifiserende middel, og et fyllstoff;

å smøre den blandede blandingen ved å anvende et smøremiddel;

å granulere den smurte blandingen;

å smøre det resulterende granulatet ved å anvende smøremidlet; og

å komprimere det smurte granulatet til ønsket form.

13. En fremgangsmåte i henhold til krav 12, hvor det farmasøytisk akseptable saltet av omecamtiv mecarbil eller det farmasøytisk akseptable hydratet derav er omecamtiv mecarbil dihydrokloridhydrat.

14. En farmasøytisk formulering i henhold til et hvilket som helst av kravene 1-11 for anvendelse ved behandling av en sykdom valgt fra akutt hjertesvikt og kronisk hjertesvikt.

- 5 **15.** En farmasøytisk formulering i henhold til krav 14, hvor formuleringen er for oral administrering.