



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3283114 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

A61K 45/06 (2006.01)

A61P 3/06 (2006.01)

A61K 31/54 (2006.01)

A61P 9/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2023.10.02
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.09.06
(86)	European Application Nr.	16712378.5
(86)	European Filing Date	2016.03.31
(87)	The European Application's Publication Date	2018.02.21
(30)	Priority	2015.04.13, GB, 201506228 2015.04.27, GB, 201507109 2015.07.29, GB, 201513344 2015.08.07, GB, 201513991 2015.12.07, GB, 201521542
(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	Galapagos NV, Generaal De Wittelaan L11/A3, 2800 Mechelen, Belgium
(72)	Inventor	WIGERINCK, Piet, Tom, Bert, Paul, Galapagos NV Generaal De Wittelaan L11/A3, 2800 Mechelen, Belgium VAN 'T KLOOSTER, Gerben, Albert, Eleutherius, Galapagos NV Generaal De Wittelaan L11/A3, 2800 Mechelen, Belgium
(74)	Agent or Attorney	Cosmovici Intellectual Property, Rue du Commerce 4, 1204 GENÈVE, Sveits

(54) Title **METHODS FOR THE TREATMENT OF CARDIOVASCULAR DISORDERS**

(56) References

Cited:

WO-A1-2013/189771, WO-A1-2015/117981

CHARLES-SCHOEMAN, C. ET AL.: "Potential mechanisms leading to the abnormal lipid profile in patients with rheumatoid arthritis versus healthy volunteers and reversal by Tofacitinib", ARTHRITIS & RHEUMATOLOGY, vol. 67, no. 3, March 2015 (2015-03), pages 616-625, XP002757709,

CHRISTEL J. MENET ET AL: "Triazolopyridines as Selective JAK1 Inhibitors: From Hit Identification to GLPG0634", JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, vol. 57, no. 22, 26 November 2014 (2014-11-26), pages 9323-9342, XP055272599, US ISSN: 0022-2623, DOI: 10.1021/jm501262q

René Galien ET AL: "4-Week Treatment of Rheumatoid Arthritis Patients with the JAK1-Selective Inhibitor Filgotinib (GLPG0634) Changes Lipid Profile with a Preferential Increase in HDL", , 29 September 2015 (2015-09-29), XP055272629, Retrieved from the Internet: URL:<http://acrabstracts.org/abstract/4-week-treatment-of-rheumatoid-arthritis-patients-with-the-jak1-selective-inhibitor-filgotinib-glpg0634-changes-lipid-profile-with-a-preferential-increase-in-hdl/> [retrieved on 2016-05-13]

DANIELLA M. SCHWARTZ ET AL: "Type I/II cytokines, JAKs, and new strategies for treating autoimmune diseases", NATURE REVIEWS RHEUMATOLOGY, vol. 12, no. 1, 3 December 2015 (2015-12-03), pages 25-36, XP055272570, GB ISSN: 1759-4790, DOI: 10.1038/nrrheum.2015.167

L. VAN ROMPAEY ET AL: "Preclinical Characterization of GLPG0634, a Selective Inhibitor of JAK1, for the Treatment of Inflammatory Diseases", THE JOURNAL OF IMMUNOLOGY, vol. 191, no. 7, 4 September 2013 (2013-09-04), pages 3568-3577, XP055272590, US ISSN: 0022-1767, DOI: 10.4049/jimmunol.1201348

GRAS, J.: "Filgotinib", DRUGS OF THE FUTURE, vol. 39, no. 8, August 2014 (2014-08), pages 547-551, XP009190056,

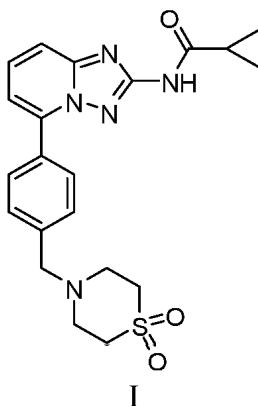
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters 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/>

EP3283114

Patentkrav

1) Forbindelse ifølge formel I:

5



eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, eller solvat eller saltet til et solvat derav til anvendelse i profylaksen og/eller behandling av aterosklerose og/eller dyslipidemi.

10

2) Det farmasøytisk akseptable saltet til et solvat til anvendelse ifølge krav 1, hvori saltet til et solvat er en [forbindelse ifølge formel I:HCl:3H₂O] addukt.

3) Forbindelse ifølge krav 1,

15 eller farmasøytisk akseptabelt salt derav til anvendelse ifølge krav 1, i profylaksen og/eller behandling av aterosklerose.

4) Farmasøytisk sammensetning til anvendelse ved profylaksen og/eller behandling av aterosklerose og/eller dyslipidemi, omfattende forbindelsen ifølge formel I, eller farmasøytisk
20 akseptabelt salt derav, og farmasøytisk akseptabel bærer, eksipient eller fortynner.

5) Forbindelse ifølge krav 1,

eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, til anvendelse ifølge krav 1 eller 3, eller farmasøytisk sammensetning ifølge krav 4 til anvendelse ifølge krav 4 hos et individ som har abnormal
25 lipidprofil.

6) Forbindelse ifølge krav 1, til anvendelse ifølge krav 1 eller 3, eller farmasøytisk sammensetning ifølge krav 4 til anvendelse ifølge krav 4, hvori det abnormale lipidnivået

EP3283114

karakterisert ved [LDL] under 50 mg/dl (eller under 1,3 mmol/L) og [HDL] under 40 mg/dl (eller under 1,04 mmol/l).

- 7) Forbindelse ifølge krav 1,
5 eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, til anvendelse ifølge krav 1 eller 3, eller farmasøytisk sammensetning ifølge krav 4 til anvendelse ifølge krav 4 hos en klinisk ikke-RA-rammet pasient.
- 8) Forbindelse ifølge krav 1,
eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, til anvendelse ifølge krav 1 eller 3, eller farmasøytisk
10 sammensetning ifølge krav 4 til anvendelse ifølge krav 4 hos en klinisk ikke-RA-rammet pasient, hvori den ikke-RA-rammede tilstanden måles med DAS28(CRP)-skåren.
- 9) Forbindelse ifølge krav 1,
eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, til anvendelse ifølge krav 1 eller 3, eller farmasøytisk
15 sammensetning ifølge krav 4 til anvendelse ifølge krav 4 hos en klinisk ikke-RA-rammet pasient, hvori den ikke-RA-rammede tilstanden måles med DAS28(CRP)-skåren, hvori DAS28(CRP)-skåren er mindre enn 2,6.
- 10) Forbindelse ifølge krav 1,
20 eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, til anvendelse ifølge krav 1 eller 3, eller farmasøytisk sammensetning ifølge krav 4 til anvendelse ifølge krav 4 hos en klinisk ikke-RA-rammet pasient, hvori den ikke-RA-rammede tilstanden måles med DAS28(CRP)-skåren, og har et CRP-nivå som er høyere enn 3 mg/l.
- 25 11) Forbindelse ifølge krav 1,
eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, til anvendelse ifølge krav 1 eller 3, eller farmasøytisk sammensetning ifølge krav 4 til anvendelse ifølge krav 4 hos en klinisk RA-rammet pasient, hvori forbindelsen til oppfinnelsen eller farmasøytiske sammensetninger omfattende en forbindelse med oppfinnelsen, administreres minst én gang i uken i en periode på mer enn 4
30 uker.
- 12) Forbindelse ifølge krav 1,
eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, til anvendelse ifølge krav 1 eller 3, eller farmasøytisk sammensetning ifølge krav 4 til anvendelse ifølge krav 4 hos en klinisk RA-rammet pasient,
35 hvori tilstanden til den klinisk RA-rammet pasienten måles med DAS28(CRP)-skåren.

EP3283114

13) Forbindelse ifølge krav 1, eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, til anvendelse ifølge krav 12, eller farmasøytisk sammensetning ifølge krav 4 til anvendelse ifølge krav 12, hvori DAS28(CRP)-skåren er høyere enn 3,2.

5

14) Forbindelse ifølge krav 1, eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, til anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1, 3, 5–13, eller farmasøytisk sammensetning ifølge krav 4 til anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 4–13, hvori forbindelsen, eller farmasøytisk akseptabelt salt derav

10 administreres med en dose på 100 mg to ganger daglig.

15) Forbindelse ifølge krav 1, eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, til anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1, 3, 5–13, eller farmasøytisk sammensetning ifølge krav 4 til anvendelse ifølge et hvilket som

15 helst av kravene 4–13, hvori forbindelsen farmasøytisk akseptabelt salt derav administreres med en dose på 200 mg én gang daglig.

20

25

30