



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3293186 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 471/18 (2006.01)
A61K 31/4162 (2006.01)
A61P 7/02 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.02.15
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.09.23
(86)	European Application Nr.	17189935.4
(86)	European Filing Date	2015.07.29
(87)	The European Application's Publication Date	2018.03.14
(30)	Priority	2014.10.01, US, 201462058316 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
(62)	Divided application	EP3089979, 2015.07.29
(73)	Proprietor	Bristol-Myers Squibb Company, Route 206 and Province Line Road, Princeton, NJ 08543-4000, USA
(72)	Inventor	DILGER, Andrew K., c/o Bristol-Myers Squibb Company 311Pennington-Rocky Hill Road, Pennington, New Jersey 08534, USA CORTE, James R., c/o Bristol-Myers Squibb Company 311Pennington-Rocky Hill Road, Pennington, New Jersey 08534, USA DE LUCCA, Indawati, 9 Hunters Ridge Dr, Pennington, New Jersey 08534, USA FANG, Tianan, c/o Bristol-Myers Squibb Company 311Pennington-Rocky Hill Road, Pennington, New Jersey 08534, USA YANG, Wu, c/o Bristol-Myers Squibb Company 311Pennington-Rocky Hill Road, Pennington, New Jersey 08534, USA WANG, Yufeng, c/o Bristol-Myers Squibb Company 311Pennington-Rocky Hill Road, Pennington, New Jersey 08534, USA PABBISSETTY, Kumar Balashanmuga, c/o Bristol-Myers Squibb Company 311Pennington-Rocky Hill Road, Pennington, New Jersey 08534, USA EWING, William R., c/o Bristol-Myers Squibb Company 311Pennington-Rocky Hill Road, Pennington, New Jersey 08534, USA ZHU, Yeheng, c/o Bristol-Myers Squibb Company 311Pennington-Rocky Hill Road, Pennington, New Jersey 08534, USA WEXLER, Ruth R., c/o Bristol-Myers Squibb Company 311Pennington-Rocky Hill Road, Pennington, New Jersey 08534, USA PINTO, Donald J.P., c/o Bristol-Myers Squibb Company 311Pennington-Rocky Hill Road, Pennington, New Jersey 08534, USA

ORWAT, Michael J., c/o Bristol-Myers Squibb Company 311Pennington-Rocky Hill
Road, Pennington, New Jersey 08534, USA
SMITH II, Leon M., c/o Bristol-Myers Squibb Company 311Pennington-Rocky Hill
Road, Pennington, New Jersey 08534, USA

(74) Agent or Attorney TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

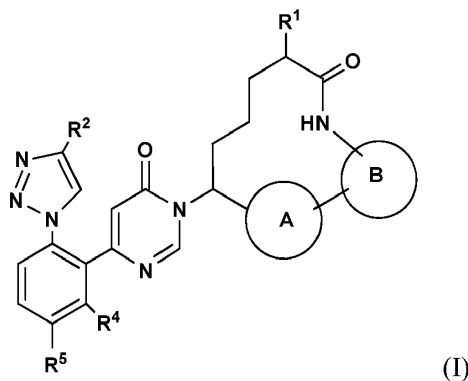
(54) Title **PYRIMIDINONES AS FACTOR XIA INHIBITORS**

(56) References
Cited: WO-A1-2013/093484
WO-A1-2015/116886
WO-A1-2014/022767

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/>

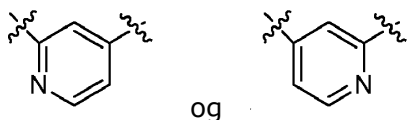
Patentkrav

1. En oral farmasøytisk sammensetning omfattende en forbindelse med formel (I):

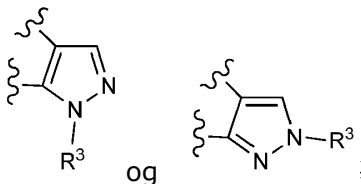


eller en stereoisomer, en tautomer, et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav, hvor:

ring A er uavhengig valgt fra



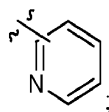
ring B er uavhengig valgt fra



R¹ er uavhengig valgt fra H og C₁₋₄ alkyl;

R² er uavhengig valgt fra F, Cl, CF₃, CHF₂ og COOH;

R³ er uavhengig valgt fra H, CHF₂, CD₃, CH₃, og



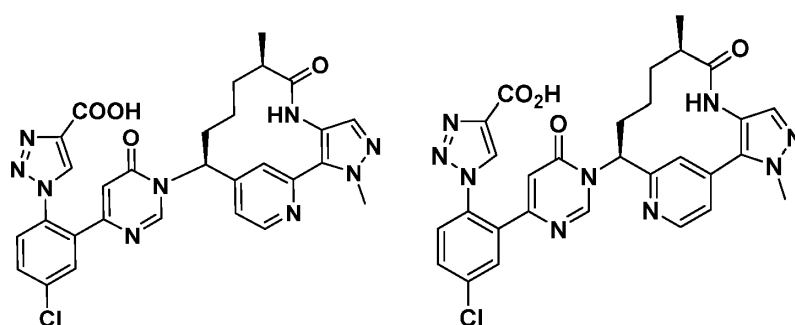
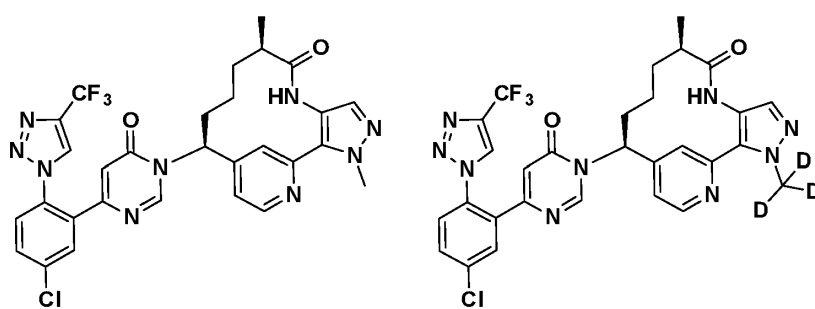
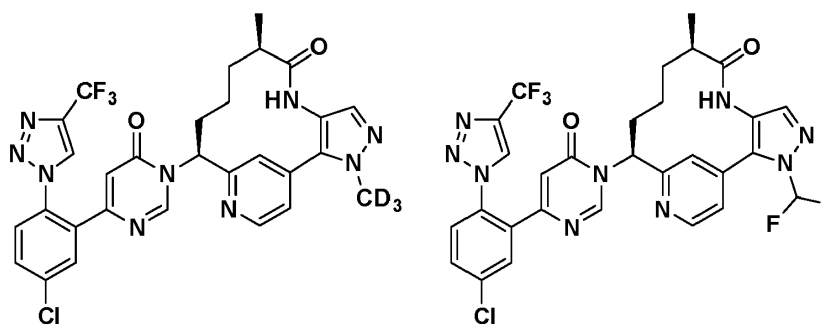
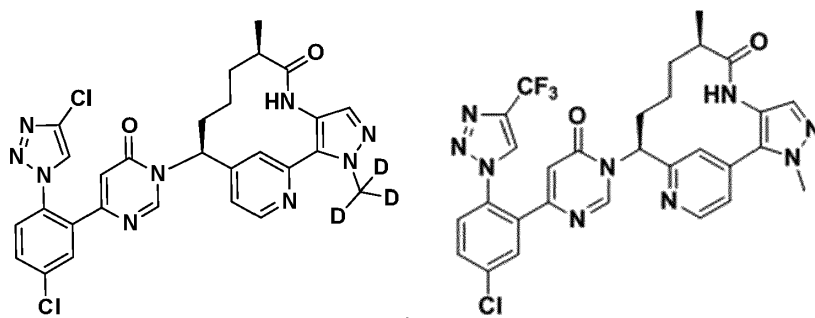
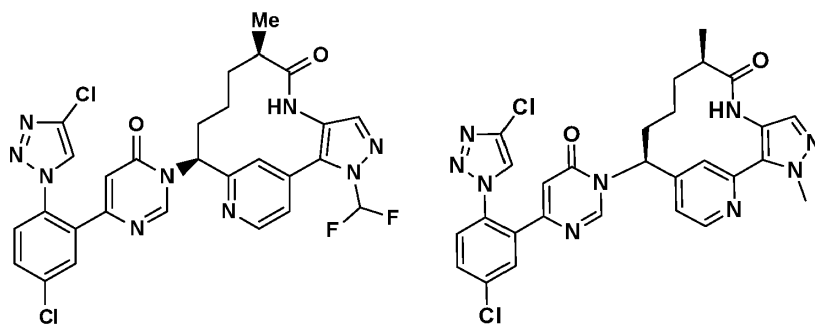
R⁴ er uavhengig valgt fra H og F; og

R⁵ er uavhengig valgt fra H, F, Cl, CH₃ og OCH₃;

og en farmasøytisk akseptabel bærer eller fortynningsmiddel.

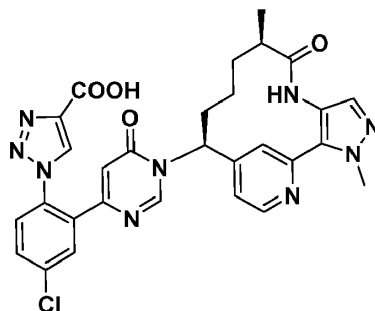
2. Oral farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, hvor R² er uavhengig valgt fra F, Cl, CF₃ og CHF₂.

3. Oral farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, hvor forbindelsen med formel (I) er valgt fra gruppen bestående av:



eller en stereoisomer, en tautomer, et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav.

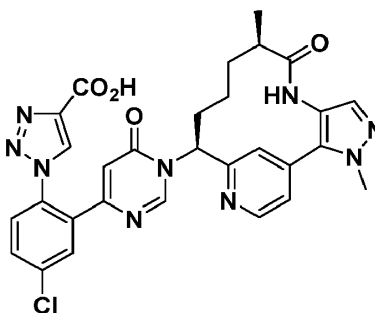
4. Oral farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, hvor forbindelsen med formel (I) har strukturen:



5

eller en stereoisomer, en tautomer, et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav.

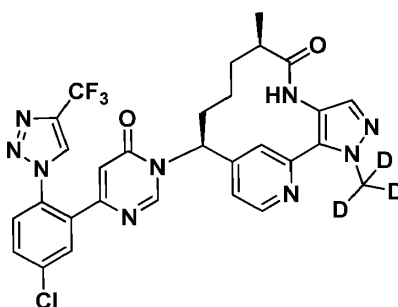
5. Oral farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, hvor forbindelsen med formel (I) har strukturen:



10

eller en stereoisomer, en tautomer, et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav.

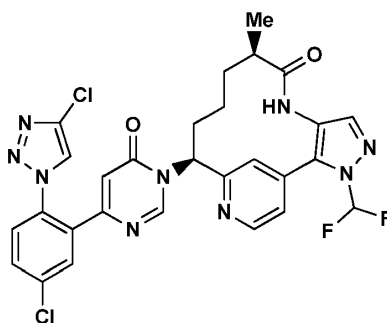
6. Oral farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, hvor forbindelsen med formel (I) har strukturen:



15

eller en stereoisomer, en tautomer, et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav.

7. Oral farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, hvor forbindelsen med formel (I) har strukturen:



eller en stereoisomer, en tautomer, et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav.

8. Oral farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7 i form av tabletter, kapsler, piller, pulver, granuler, eliksir, tinkturer, suspensjoner, sirup eller emulsjoner.

9. Oral farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8, videre omfattende et eller flere ytterligere terapeutiske midler valgt fra et antiarytmisk middel, et antihypertensivt middel, et antikoagulasjonsmiddel, en platehemmere, et trombininhiberende middel, et trombolytisk middel, et fibrinolytisk middel, en kalsiumkanalblokker, en kaliumkanalblokker, et kolesterol/lipidsenkende middel eller en kombinasjon derav.

10. Oral farmasøytisk sammensetning ifølge krav 9, hvor det ene eller de flere ytterligere terapeutiske midlene er en platehemmere eller en kombinasjon derav.

11. Oral farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 10 for bruk som et medikament.

12. Oral farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 10 for bruk ved behandling av en tromboembolisk forstyrrelse.

13. Oral farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8 for bruk ved behandling av en tromboembolisk forstyrrelse i kombinasjon med en platehemmere, i en daglig dose på ca. 0,01 til ca. 300 milligram av forbindelsen (I) og ca. 50 til ca. 150 milligram av nevnte platehemmere, per kilo pasient-kroppsvekt.

14. Oral farmasøytisk sammensetning for bruk ifølge krav 12, hvor den tromboemboliske forstyrrelsen er valgt fra arterielle kardiovaskulære tromboemboliske forstyrrelser, venøse kardiovaskulære tromboemboliske forstyrrelser og tromboemboliske forstyrrelser i hjertekamrene eller i den perifere sirkulasjonen.

15. Oral farmasøytisk sammensetning for bruk ifølge krav 12, hvor den tromboemboliske forstyrelsen er valgt fra ustabil angina, et akutt koronarsyndrom, atrieflimmer, hjerteinfarkt, transitorisk iskemisk angrep, hjerneslag, aterosklerose, perifer okklusiv arteriell sykdom, venetrombose, dyp venetrombose, tromboflebitt, arteriell emboli, koronar arteriell trombose, cerebral arteriell trombose, cerebral emboli, nyreemboli, lungeemboli og trombose som følge av medisinske implantater, enheter eller prosedyrer der blod utsettes for en kunstig overflate som fremmer trombose.