



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3323814 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 267/10 (2006.01)
A61K 31/553 (2006.01)
A61P 11/00 (2006.01)
C07D 413/12 (2006.01)
C07D 413/14 (2006.01)
C07D 417/12 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

| | | |
|------|----------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| (45) | Translation Published | 2020.08.24 |
| (80) | Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent | 2020.05.13 |
| (86) | European Application Nr. | 17195612.1 |
| (86) | European Filing Date | 2015.01.23 |
| (87) | The European Application's Publication Date | 2018.05.23 |
| (30) | Priority | 2014.01.24, US, 201461931090 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 | EP3097086, 2015.01.23 |
| (73) | Proprietor | AstraZeneca AB, 151 85 Södertälje, Sverige |
| (72) | Inventor | LÖNN, Hans, Roland, c/o AstraZeneca Intellectual PropertyAstraZeneca R&D AlderleyAlderley Park, Macclesfield, Cheshire SK10 4TG, Storbritannia CONNOLLY, Stephen, c/o AstraZeneca Intellectual PropertyAstraZeneca R&D AlderleyAlderley Park, Macclesfield, Cheshire SK10 4TG, Storbritannia SWALLOW, Steven, AstraZeneca R&D AlderleyAlderley Park, Macclesfield, Cheshire SK10 4TG, Storbritannia KARLSSON, Staffan PO, AstraZeneca R&D Mölndal, SE-431 83 Mölndal, Sverige AURELL, Carl-Johan, AstraZeneca R&D Mölndal, SE-431 83 Mölndal, Sverige PONTÉN, John Fritiof, c/o AstraZeneca Intellectual PropertyAstraZeneca R&D AlderleyAlderley Park, Macclesfield, Cheshire SK10 4TG, Storbritannia DOYLE, Kevin, James, BioFocusChesterford Research ParkLittle Chesterford, Saffron Walden, Essex CB10 1XL, Storbritannia VAN DE POËL, Amanda, Jane, BioFocusChesterford Research ParkLittle Chesterford, Saffron Walden, Essex CB10 1XL, Storbritannia JONES, Graham, Peter, BioFocusChesterford Research ParkLittle Chesterford, Saffron Walden, Essex CB10 1XL, Storbritannia WATSON, David, Wyn, BioFocusChesterford Research ParkLittle Chesterford, Saffron Walden, Essex CB10 1XL, Storbritannia MACRITCHIE, Jacqueline, Anne, BioFocusChesterford Research ParkLittle Chesterford, Saffron Walden, Essex CB10 1XL, Storbritannia |

PALMER, Nicholas, John, c/o AstraZeneca Intellectual Property
AstraZeneca R&D
Alderley Alderley Park, Macclesfield, Cheshire SK10 4TG, Storbritannia

(74) Agent or Attorney Nordic Patent Service A/S, Bredgade 30, 1260 KØBENHAVN K, Danmark

(54) Title **(2S)-N-[(1S)-1-CYANO-2-PHENYLETHYL]-1,4-OXAZEPANE-2-CARBOXAMIDES AS
DIPEPTIDYL PEPTIDASE I INHIBITORS**

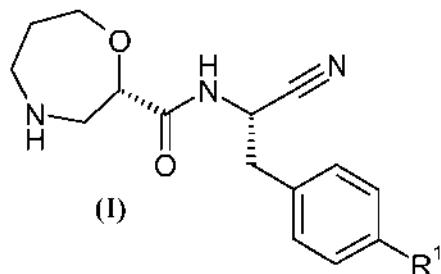
(56) References
Cited:

WO-A1-2009/074829
WO-A1-2010/142985
WO-A1-2010/128324
WO-A1-2011/154677

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/>

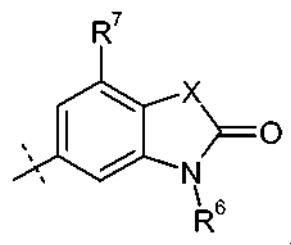
PATENTKRAV

1. Forbindelse av formel (I)



hvor

5 **R¹** er



X er valgt fra O, S eller CF₂;

R⁶ er valgt fra C₁₋₃alkyl, hvori C₁₋₃alkylet eventuelt er substituert med 1, 2 eller 3 F;

R⁷ er valgt fra hydrogen, F, Cl eller CH₃;

10 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

2. Farmasøytisk sammensetning omfattende en forbindelse av formel (I) ifølge

krav 1 og en farmasøytisk akseptabel adjuvans, fortynningsmiddel eller bærer.

15 3. Forbindelse av formel (I) ifølge krav 1 for anvendelse i terapi.

4. Forbindelse av formel (I) ifølge krav 1, for anvendelse i behandling av

obstruktive sykdommer i luftveiene: inkludert hvilken som helst av astma, inkludert bronkial, allergisk, iboende, ekstrinsik, treningsindusert, legemiddelindusert (inkludert aspirin og

20 NSAID-indusert) og støvindusert astma, både intermitterende og vedvarende og av alle alvorlighetsgrader, og andre årsaker til hyperreaksjonsevne i luftveiene; kronisk obstruktiv lungesykdom (KOLS); bronkitt, inkludert smittsom og eosinofil bronkitt; emfysem; bronkiektasier; cystisk fibrose; sarkoidose; alfa-1-antitrypsinmangel; farmer's lunge og relaterte sykdommer; overfølsomhetspneumonitt; lungefibrose, inkludert kryptogen

25 fibroserende alveolitt, idiopatiske interstitielle pneumonier, fibrose som kompliserer anti-

neoplastisk behandling og kronisk infeksjon, inkludert tuberkulose og aspergillose og andre soppinfeksjoner; komplikasjoner av lungetransplantasjon; vaskulittiske og trombotiske lidelser i lungevaskulaturen, og pulmonal hypertensjon; antitussiv aktivitet inkludert behandling av kronisk hoste assosiert med inflamatoriske og sekretoriske tilstander i luftveiene, og iatrogen

- 5 hoste; akutt og kronisk rhinitt inkludert rhinitis medicamentosa, og vasomotorisk rhinitt; flerårig og sesongbasert allergisk rhinitt inkludert rhinitis nervosa (høysnue); nesepolypose; akutt virusinfeksjon inkludert forkjølelse, og infeksjon som følge av respiratorisk syncytialvirus, influensa, coronavirus (inkludert SARS) og adenovirus, akutt lungeskade, akutt lungesviktsyndrom (ARDS), samt forverringer av hver av de foregående
- 10 luftveiskanalsykdomstilstandene, spesielt forverringer av alle typer av astma eller KOLS.

5. Forbindelse av formel (I) for anvendelse ifølge krav 4 for anvendelse i behandling av astma eller kronisk obstruktiv lungesykdom.

- 15 6. Forbindelse av formel (I) for anvendelse ifølge krav 4 for anvendelse i behandling av bronkiktase.

7. Kombinasjon av en forbindelse av formel (I) ifølge krav 1 og ett eller flere midler uavhengig valgt fra:

- 20 • en ikke-steroid glukokortikoidreceptoragonist;
- en selektiv β_2 -adrenoceptoragonist;
- en fosfodiesteraseinhibitor;
- en proteaseinhibitor;
- et glukokortikoid;
- 25 • et antikolinergisk middel;
- en modulator av kjemokinreceptorfunksjon; og
- en inhibitor av kinasefunksjon.