



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3758708 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/553 (2006.01)
A61P 11/06 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2025.02.17
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2024.11.27
(86)	European Application Nr.	19716296.9
(86)	European Filing Date	2019.03.01
(87)	The European Application's Publication Date	2021.01.06
(30)	Priority	2018.03.01, US, 201862636944 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
	Designated Validation States:	KH; MA; MD; TN
(73)	Proprietor	AstraZeneca AB, 151 85 Södertälje, Sverige
(72)	Inventor	WIKSTRÖM, Håkan, c/o Astrazeneca R&D Gothenberg, 431 83 Mölndal, Sverige LUDVIGSSON, Jufang Wu, c/o Astrazeneca R&D Gothenberg, 431 83 Mölndal, Sverige ANDERSSON, Thomas, c/o Astrazeneca R&D Gothenberg, 431 83 Mölndal, Sverige
(74)	Agent or Attorney	RWS, Europa House, Chiltern Park, Chiltern Hill, SL99FG CHALFONT ST PETER, Storbritannia

(54)	Title	PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS COMPRISING (2S)-(1S)-1-CYANO-2-[4-(3-METHYL-2- OXO-2,3-DIHYDRO-1,3-BENZOXAZOL-5-YL)PHENYL]ETHYL-1,4-OXAZEPANE-2- CARBOXAMIDE
(56)	References Cited:	US-A1- 2015 210 655 US-A1- 2018 028 541 KEVIN DOYLE ET AL: "Discovery of Second Generation Reversible Covalent DPP1 Inhibitors Leading to an Oxazepane Amidoacetonitrile Based Clinical Candidate (AZD7986)", JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, vol. 59, no. 20, 11 October 2016 (2016-10-11), US, pages 9457 - 9472, XP055600426, ISSN: 0022-2623, DOI: 10.1021/acs.jmedchem.6b01127

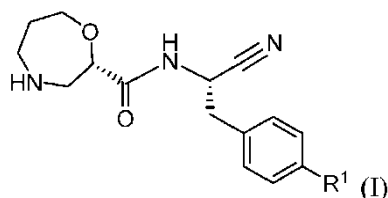
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters 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. Farmasøytisk sammensetning omfattende de følgende komponentene (a)-(f):

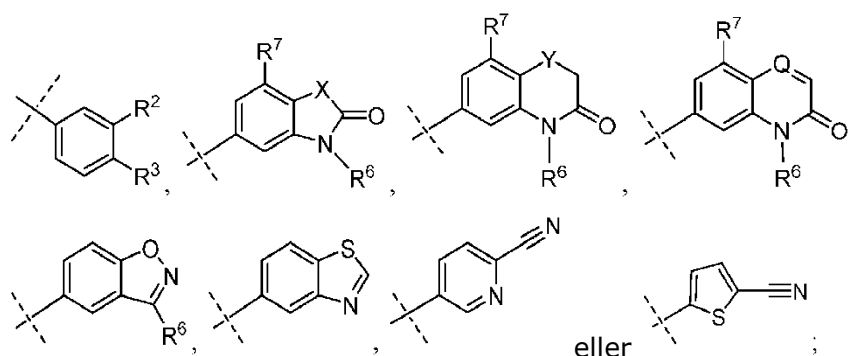
(a) fra 1,0 vekt-% til 30 vekt-% av en forbindelse av formel (I), eller et farmasøytisk

5 akseptabelt salt derav;



hvor,

R¹ er



10 R² er hydrogen, F, Cl, Br, OSO₂C₁-₃alkyl eller C₁-₃alkyl;

R³ er hydrogen, F, Cl, Br, CN, CF₃, SO₂C₁-₃alkyl, CONH₂ eller SO₂NR⁴R⁵, hvori R⁴ og R⁵ sammen med nitrogenatomet som de er festet til danner en azetidin-, pyrrolidin- eller piperidinring; eller

R⁶ er C₁-₃alkyl, eventuelt substituert med 1, 2 eller 3 F og/eller eventuelt med OH, OC₁-
15 ₃alkyl, N(C₁-₃alkyl)₂, syklopropyl eller tetrahydropyran;

R⁷ er hydrogen, F, Cl eller CH₃;

X er O, S eller CF₂;

Y er O eller S;

Q er CH eller N;

20 (b) fra 55 vekt-% til 75 vekt-% av et farmasøytisk fortynningsmiddel;

(c) fra 15 vekt-% til 25 vekt-% av et kompresjonshjelpemiddel;

(d) fra 3,0 vekt-% til 5,0 vekt-% av et farmasøytisk desintegreringsmiddel;

(e) fra 0,00 vekt-% til 1,0 vekt-% av et farmasøytisk glidemiddel; og

(f) fra 2 vekt-% til 6 vekt-% av et farmasøytisk smøremiddel;

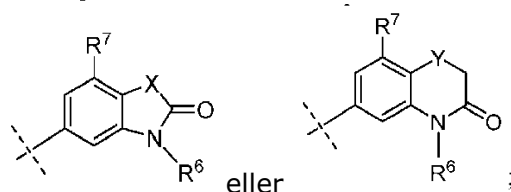
25 hvori vektene av komponentene (a)-(f) summerer seg opp til 100 vekt-%;

hvor det farmasøytiske smøremidlet er glyserolbehenat, det farmasøytiske fortynningsmidlet er mikrokrySTALLINSK cellulose, kompresjonshjelpemidlet er dibasisk

kalsiumfosfatdihydrat, det farmasøytiske desintegreringsmidlet er natriumstivelsesglykolat og det farmasøytiske glidemidlet er silisiumdioksid.

2. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1, hvori

5 R¹ er



X er O, S eller CF₂;

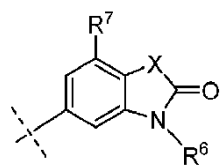
Y er O eller S;

R⁶ er C₁₋₃alkyl, eventuelt substituert med 1, 2 eller 3 F og eventuelt med OH, OC₁₋₃alkyl,

10 N(C₁₋₃alkyl)₂, syklopropyl eller tetrahydropyran; og

R⁷ er hydrogen, F, Cl eller CH₃.

3. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1 eller 2, hvori R¹ er



15

4. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 3, hvori X er O, S eller CF₂; R⁶ er C₁₋₃alkyl, eventuelt substituert med 1, 2 eller 3 F; og R⁷ er hydrogen, F, Cl eller CH₃.

5. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-4, hvori forbindelsen av formel (I) er (2S)-N-{(1S)-1-cyano-2-[4-(3-metyl-2-okso-2,3-dihydro-1,3-benzoksazol-5-yl)fenyl]etyl}-1,4-oksazepan-2-karboksamid (forbindelse A), eller et farmasøytisk akseptabelt salt av forbindelse A.

20

6. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 5, hvori forbindelse A er til stede i 3 vekt-% til 10 vekt-%.

25

7. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 6, hvori glyserolbehenatet er til stede i 2,5 vekt-% til 4,5 vekt-%.

8. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 6 eller krav 7, hvori silisiumdioksidet er til stede ved 0,05 vekt-% til 0,25 vekt-%.

30

9. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 6–8, hvori natriumstivelsesglykolatet er til stede ved 3,5 vekt-% til 4,5 vekt-%.
10. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 6–9, hvori det dibasiske kalsiumfosfatdihydratet er til stede ved 18 vekt-% til 22 vekt-%.
11. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 6–10, hvori den mikrokrySTALLINSKE cellulosen er til stede ved 55 vekt-% til 70 vekt-%.
12. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1–11, hvori forbindelsen av formel (I) er den frie basen av forbindelse A.
13. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1–12, hvori forbindelsen av formel (I) er til stede ved (a) fra 5 mg til 50 mg, (b) fra 10 mg til 40 mg, (c) 10 mg, (d) 25 mg eller (e) 40 mg i den farmasøytiske sammensetningen.
14. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1–13 for anvendelse i behandling av en obstruktiv sykdom i luftveiene hos en pasient med behov derav.
15. Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 14, hvori den obstruktive sykdommen i luftveiene er (a) bronkiektase, (b) kronisk obstruktiv lungesykdom (KOLS), (c) astma eller (d) cystisk fibrose.
16. Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 15, hvori den obstruktive sykdommen i luftveiene er (a) bronkiektase.
17. Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 16, hvori bronkiektasien er bronkiektasi av ikke-cystisk fibrose.
18. Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 15, hvori den obstruktive sykdommen i luftveiene er (d) cystisk fibrose.
19. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1–13 for anvendelse i behandling av et antinøytrofilt cytoplasmatisk autoantistoff (ANCA) assosiert vaskulitt hos en pasient med behov derav.

20. Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 19, hvori den ANCA-assosierte vaskulitten er granulomatose med polyangiitt (GPA).