



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 4125911 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/506 (2006.01)
A61P 25/28 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2024.08.26
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2024.04.24
(86)	European Application Nr.	22715162.8
(86)	European Filing Date	2022.03.04
(87)	The European Application's Publication Date	2023.02.08
(30)	Priority	2021.03.05, US, 202163157586 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	NewAmsterdam Pharma B.V., (dutch Chamber of Commerce No. 55971946) Gooimeer 2-35, 1411 DC Naarden, Nederland
(72)	Inventor	DITMARSCH, Marc, 1411 DC Naarden, Nederland KASTELEIN, Johannes Jacob Pieter, 1411 DC Naarden, Nederland DAVIDSON, Michael Harvey, 1411 DC Naarden, Nederland
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54)	Title	OBICETRAPIB FOR TREATMENT OF DEMENTIAS
------	-------	---

(56)	References	
	Cited:	WO-A1-2012/050517 EP-A1- 2 281 824 WO-A2-2005/095409 JP-B2- 4 531 027 JP-A- 2007 119 450 WO-A1-2015/119495

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. Obicetrapib, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse i en fremgangsmåte for saktning av progresjon av nevrodegenerativ sykdom hos et individ som har eller er i fare for å utvikle den nevrodegenerative sykdommen, der

5 fremgangsmåten omfatter:

administrering av en terapeutisk effektiv mengde obicetrapib eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav til individet, hvori den nevrodegenerative sykdommen er Alzheimers sykdom (AD), lewylegemedemens, vaskulær demens eller multi-infarkt-demens, eller

10 frontotemporal demens (FTD).

2. Obicetrapib, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse ifølge krav 1, hvori obicetrapib eller et salt derav administreres oralt.

15

3. Obicetrapib, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 2, hvori obicetrapib administreres én gang per dag.

4. Obicetrapib, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse ifølge

20 krav 3, hvori dosen er 5–25 mg po QD av obicetrapib eller et salt derav.

5. Obicetrapib, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse ifølge krav 4, hvori dosen er 5 mg po QD, 10 mg po QD, 15 mg po QD, 20 mg po QD eller 25 mg po QD.

25

6. Obicetrapib, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–5, hvori obicetrapib eller et salt derav administreres én gang daglig i minst 8 uker, i minst 6 måneder, i minst 12 måneder eller i minst 24 måneder.

30

7. Obicetrapib, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse ifølge krav 6, hvori individet har blitt diagnostisert med eller er i fare for å utvikle AD.

8. Obicetrapib, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse ifølge krav 7, hvori individet har blitt diagnostisert med AD.

9. Obicetrapib, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse ifølge krav 7 eller krav 8, hvori individet har minst ett ApoE4-allel.

10. Obicetrapib, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse ifølge krav 9, hvori individet har to ApoE4-alleler.

11. Obicetrapib, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 9–10, som ytterligere omfatter det tidligere trinnet med detektering av ApoE4-alleler hos individet.

12. Obicetrapib, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–11, hvori individet har blitt diagnostisert med en mild kognitiv svekkelse (MCI).

13. Obicetrapib, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–12, hvori det før behandling ble bestemt at individet har minst ett av (i) reduserte nivåer av A β 42 i plasma, (ii) økte nivåer av A β 40 i plasma, (iii) redusert forhold av A β 42/A β 40 i plasma, (iv) økte nivåer av neurofilament lett (NfL) i plasma, og (v) økte nivåer av neurogranin i plasma, sammenlignet med en frisk kontrollpopulasjon som ikke har, og som ikke har forhøyet risiko for neurodegenerativ sykdom.

14. Obicetrapib, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–13, hvori det før behandling ble bestemt at individet har minst ett av (i) reduserte nivåer av A β 42 i CSF, (ii) økte nivåer av A β 40 i CSF, (iii) redusert forhold av A β 42/A β 40 i CSF, (iv) økte nivåer av neurofilament lett (NFL) i CSF, og (v) økte nivåer av neurogranin i CSF, sammenlignet med en frisk kontrollpopulasjon som ikke har, og som ikke har forhøyet risiko for neurodegenerativ sykdom.

15. Obicetrapib, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–14, hvori det før behandling ble bestemt at individet har unormale mønstre av Tau, basert på Tau PET-avbildning.

5 **16.** Obicetrapib, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–15, hvori dosen av obicetrapib eller et salt derav er tilstrekkelig til å forhindre minst én av (i) ytterligere reduksjon i nivåer av A β 42 i plasma, (ii) ytterligere økning i nivåer av A β 40 i plasma, (iii) ytterligere reduksjon i forhold av A β 42/A β 40 i plasma, (iv) ytterligere økning i nivåer av neurofilament lett (NFL) i plasma, og (v) ytterligere økning i nivåer av neurogranin i plasma,
10 sammenlignet med nivåer umiddelbart før behandlingsstart.

17. Obicetrapib, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–16, hvori dosen av obicetrapib eller et salt derav er
15 tilstrekkelig til å forhindre minst én av (i) ytterligere reduksjon i nivåer av A β 42 i CSF, (ii) ytterligere økning i nivåer av A β 40 i CSF, (iii) ytterligere reduksjon i forhold av A β 42/A β 40 i CSF, (iv) ytterligere økning i nivåer av neurofilament lett (NFL) i CSF, og (v) ytterligere økning i nivåer av neurogranin i CSF, sammenlignet med nivåer umiddelbart før behandlingsstart.

20

18. Obicetrapib, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–17, hvori obicetrapib administreres som en tablett.

19. Obicetrapib, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse ifølge
25 krav 18, hvori tablettene omfatter obicetrapib som kalsiumsaltet.

20. Obicetrapib, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse i en fremgangsmåte for saktning av progresjonen av neurodegenerativ sykdom, hvori individet har eller er i fare for å utvikle en neurodegenerativ sykdom.

30

21. Obicetrapib eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 20, hvori individet er et individ med tidlig Alzheimers sykdom.

22. Obicetrapib eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 20, hvori individet er en heterozygot eller homozygot ApoE4-bærer.

23. Obicetrapib eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 20, hvori individet er en heterozygot eller homozygot ApoE4-bærer med tidlig Alzheimers sykdom.