



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2299984 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/20 (2006.01)
A61K 9/28 (2006.01)
A61K 31/7068 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21) Translation Published 2019.04.23

(80) Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent 2018.11.28

(86) European Application Nr. 09746975.3

(86) European Filing Date 2009.05.14

(87) The European Application's Publication Date 2011.03.30

(30) Priority 2008.05.15, US, 53609 P
2008.12.05, US, 201145 P
2009.03.05, US, 157875 P

(84) Designated Contracting States: 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 ; SE ; SI ; SK ; TR

(73) Proprietor CELGENE CORPORATION, 86 Morris Avenue, Summit, NJ 07901, USA

(72) Inventor ETTER, Jeffrey, B., 1318 Deer Trail Road, BoulderCO 80302, USA
LAI, Mei, 1038 Neon Forest Circle, LongmontCO 80504, USA
BACKSTROM, Jay, Thomas, 15400 Aberdeen, LeawoodKS 66224, USA

(74) Agent or Attorney OSLO PATENTKONTOR AS, Postboks 7007 M, 0306 OSLO, Norge

(54) Title **ORAL FORMULATIONS OF CYTIDINE ANALOGS AND METHODS OF USE THEREOF**

(56) References Cited: WO-A2-2008/028193, US-A1- 2004 186 065, STOLTZ: "Development of an Oral Dosage Form of Azacitidine: Overcoming Challenges in Chemistry, Formulation, and Bioavailability" ASH ANNUAL MEETING, vol. 108, 1 January 2006 (2006-01-01), XP009121611, WARD: "An oral dosage formulation of azacitidine: A pilot pharmacokinetic study" JOURNAL OF CLINICAL ONCOLOGY, vol. 25, no. 18S, 1 July 2007 (2007-07-01) , XP009121612

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/>

Krav

1. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av et individ som har kreft omfattende oral administrering til individet av den farmasøytiske sammensetningen som omfatter en terapeutisk effektiv
5 mengde av 5-azacytidin, hvor sammensetningen er en umiddelbar frigivelse-sammensetning og hvor kreften er akutt myelogen leukemi.
2. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 1, som videre omfatter et ytterligere terapeutisk middel.
10
3. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 1 eller 2, hvor sammensetningen er ikke-enterisk belagt.
4. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av
15 kravene 1 til 3, hvor sammensetningen er en enkelt-enhet doseringsform.
5. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 4, hvor enkelt-enhet doseringsformen er en tablett eller en kapsel.
- 20 6. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 5, hvor sammensetningen videre omfatter en eksipiens valgt fra mannitol, mikrokrystallinsk cellulose, krospovidon og magnesiumstearat, eller hvor sammensetningen videre omfatter en permeasjonsforsterker.
- 25 7. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 6, hvor permeasjonsforsterkeren er d-alfa-tokoferyl polyetylen glykol 1000 succinat, eventuelt hvor d-alfa-tokoferyl polyetylen glykol 1000 succinatet er tilstede i formuleringen ved ca. 2 vekt% i forhold til totalvekt av formuleringen.
- 30 8. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7, som er i all vesentlighet fri for en cytidin-deaminase-inhibitor, eller som er i all vesentlighet fri for tetrahydrouridin.
9. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av
35 kravene 1 til 8, hvor sammensetningen oppnår en område-under-urveverdi på minst ca. 200 ng-t/ml eller minst ca. 400 ng-t/ml etter oral administrering, eller hvor sammensetningen oppnår en maksimal plasmakonsentrasjon på minst ca. 100

ng/ml eller minst ca. 200 ng/ml etter oral administrering, eller hvor sammensetningen oppnår en tid til maksimal plasmakonsentrasjon på mindre enn ca. 60 minutter, mindre enn ca. 90 minutter eller mindre enn ca. 180 minutter etter oral administrering til individet.

5

10. Sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 9, hvor individet er et menneske.