



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 2345410 B1

NORWAY

(19) NO  
(51) Int Cl.  
*A61K 31/426 (2006.01)*  
*A61K 47/02 (2006.01)*  
*A61K 47/12 (2006.01)*  
*A61K 47/22 (2006.01)*  
*A61K 47/26 (2006.01)*  
*A61K 47/32 (2006.01)*  
*A61K 47/38 (2006.01)*  
*A61P 3/10 (2006.01)*  
*A61P 13/10 (2006.01)*  
*A61K 47/10 (2017.01)*  
*A61K 47/14 (2017.01)*  
*A61K 47/18 (2017.01)*  
*A61K 47/34 (2017.01)*

Norwegian Industrial Property Office

---

|      |                                                                      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |
|------|----------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| (45) | Translation Published                                                | 2021.03.08                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    |
| (80) | Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent | 2020.12.30                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    |
| (86) | European Application Nr.                                             | 09817723.1                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    |
| (86) | European Filing Date                                                 | 2009.09.28                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    |
| (87) | The European Application's Publication Date                          | 2011.07.20                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    |
| (30) | Priority                                                             | 2008.09.30, US, 101338 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 ; SM ; TR                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |
| (73) | Proprietor                                                           | Astellas Pharma Inc., 5-1, Nihonbashi-Honcho 2-chome, Chuo-kuTokyo 103-8411, Japan                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |
| (72) | Inventor                                                             | TAKAISHI Yuuki, c/o Astellas Pharma Inc.5-1, Nihonbashi-Honcho 2-chomeChuo-ku, Tokyo 103-8411, Japan<br>TAKAHASHI Yutaka, c/o Astellas Pharma Inc.5-1, Nihonbashi-Honcho 2-chomeChuo-ku, Tokyo 103-8411, Japan<br>NISHIZATO Takashi, c/o Astellas Pharma Inc.5-1, Nihonbashi-Honcho 2-chomeChuo-ku, Tokyo 103-8411, Japan<br>MURAYAMA Daisuke, c/o Astellas Pharma Inc.5-1, Nihonbashi-Honcho 2-chomeChuo-ku, Tokyo 103-8411, Japan<br>MURAYAMA Emiko, c/o Astellas Pharma Inc.5-1, Nihonbashi-Honcho 2-chomeChuo-ku, Tokyo 103-8411, Japan<br>NAKAMURA Soichiro, c/o Astellas Pharma Inc.5-1, Nihonbashi-Honcho 2-chomeChuo-ku, Tokyo 103-8411, Japan<br>SAKO Kazuhiro, c/o Astellas Pharma Inc.5-1, Nihonbashi-Honcho 2-chomeChuo-ku, Tokyo 103-8411, Japan |

(74) Agent or Attorney                      BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

---

(54) Title                      **PHARMACEUTICAL COMPOSITION FOR MODIFIED RELEASE**

(56) References

Cited:                      EP-A1- 1 028 111  
                                JP-A- 2005 162 737  
                                WO-A1-94/06414  
                                JP-T- 2005 519 884  
                                WO-A1-2004/041276  
                                EP-A1- 1 440 969  
                                WO-A1-2008/084698

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 for modifisert frigjøring, omfattende  
(1) (R)-2-(2-aminotiazol-4-yl)-4'-[2-[(2-hydroksy-2-  
5 fenyletyl)amino]etyl]eddiksyreanilid, eller et farmasøytisk akseptabelt  
salt derav, (2) minst ett tilsetningsstoff som sikrer penetrering av vann  
i det farmasøytiske preparatet og som har en løselighet slik at volumet  
av vann som kreves for å oppløse 1 g av tilsetningsstoffet er 10 ml eller  
mindre, og (3) en hydrogeldannende polymer med en gjennomsnittlig  
10 molekylvekt på 100.000 til 5.000.000 eller en viskositet på 12 mPa·s  
eller mer i en 5% vandig løsning ved 25°C og 7500 mPa·s eller mindre i  
en 1% vandig løsning ved 25°C,  
hvor tilsetningsstoffet som sikrer penetrering av vann i det  
farmasøytiske preparatet er en forbindelse, eller to eller flere  
15 forbindelser valgt fra gruppen bestående av polyetylenglykol,  
polyvinylpyrrolidon, D-mannitol, laktose, sukrose, natriumklorid og  
polyoksyetylenpolyoksypropylenglykol;  
hvor den hydrogeldannende polymeren er en forbindelse, eller to eller  
flere forbindelser valgt fra gruppen bestående av polyetylenoksyd,  
20 hydroksypropylmetylcellulose og hydroksypropylcellulose; og  
hvor medikamentets oppløsningshastighet fra det farmasøytiske  
preparatet er 75% eller mindre etter 1,5 timer og minst 75% etter 7  
timer fra begynnelsen av oppløsningstesten, og hvor oppløsningstesten  
utføres i samsvar med padle-metoden beskrevet i USA States  
25 Pharmacopoeia under de forhold at 900 mL USP-buffer, pH 6,8,  
anvendes og padlerotasjonshastigheten er 50 til 200 rpm.

2. Farmasøytisk sammensetning for modifisert frigjøring ifølge krav 1,  
hvor padlerotasjonshastigheten er 200 rpm.

3. Farmasøytisk sammensetning for modifisert frigjøring ifølge krav 1, hvor den hydrogeldannende polymeren er polyetylenoksyd.
- 5 4. Farmasøytisk sammensetning for modifisert frigjøring ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvor en mengde av tilsetningsstoffet som sikrer penetrering av vann i det farmasøytiske preparatet er 5 vekt% til 75 vekt% med hensyn til totalvekten av den farmasøytiske sammensetning.
- 10 5. Farmasøytisk sammensetning for modifisert frigjøring ifølge krav 4, hvor en mengde av tilsetningsstoffet som sikrer penetrering av vann i det farmasøytiske preparatet er 5 vekt% til 70 vekt% i forhold til totalvekten av det farmasøytiske preparatet.
- 15 6. Farmasøytisk sammensetning for modifisert frigjøring ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5, hvor en mengde av den hydrogeldannende polymeren er 1 vekt% til 70 vekt% i forhold til totalvekten av det farmasøytiske preparatet.
- 20 7. Farmasøytisk sammensetning for modifisert frigjøring ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6, videre omfattende en antioksidant.
- 25 8. Farmasøytisk sammensetning for modifisert frigjøring ifølge krav 7, hvor antioksidanten er en forbindelse, eller to eller flere forbindelser valgt fra gruppen bestående av butylhydroksytoluen, propylgallat og natriumaskorbat.
9. Farmasøytisk sammensetning for modifisert frigjøring ifølge krav 8, hvor antioksidanten er butylhydroksytoluen.

10. Farmasøytisk sammensetning for modifisert frigjøring ifølge et hvilket som helst av kravene 7 til 9, hvor en mengde av antioksidanten er 0,025 vekt% til 0,25 vekt%.

5 11. Farmasøytisk sammensetning for modifisert frigjøring ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 10, videre omfattende en stabilisator.

12. Farmasøytisk sammensetning for modifisert frigjøring ifølge krav 11, hvor stabilisatoren er en forbindelse, eller to eller flere forbindelser  
10 valgt fra gruppen bestående av gult jernoksid, rødt jernoksid og svart jernoksid.

13. Farmasøytisk sammensetning for modifisert frigjøring ifølge krav 12, hvor stabilisatoren er gult jernoksid og/eller rødt jernoksid.

15 14. Farmasøytisk sammensetning for modifisert frigjøring ifølge hvilket som helst av kravene 11 til 14, hvor en mengde av stabilisatoren er 0,05 vekt% til 1 vekt%.