



(12) Translation of new
European patent specification
After opposition procedure

(11) NO/EP 2464337 B2

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.

A61K 9/14 (2006.01)
A61K 31/44 (2006.01)
A61K 31/47 (2006.01)

A61K 45/06 (2006.01)
A61P 19/00 (2006.01)

A61P 19/10 (2006.01)
A61P 43/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

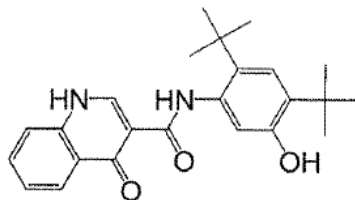
(45)	Translation Published	2019.06.11
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.01.09
(45)	Decision of the opposition in EPO	2024.06.26
	Decision of the opposition in NIPO	2024.08.26
(86)	European Application No	10708442.8
(86)	European Filing Date	2010.02.18
(87)	The European Application's Publication Date	2012.06.20
(30)	Priority	2009.08.13, US, 583066 2009.08.13, WO, PCT/US09/000462
(84)	Designated Contracting States: Designated Extension 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 AL; BA; RS
(73)	Proprietor	Vertex Pharmaceuticals Incorporated, 50 Northern Avenue, Boston, MA 02210, USA
(72)	Inventor	ROWE, William, 770 Highland Avenue, Medford MA 02155, USA HURTER, Patricia, 49 Tahanto Trail, Harvard MA 01451, USA YOUNG, Christopher, R., 42 Francis Street Unit 1, Waltham MA 02451, USA DINEHART, Kirk, 60 Hemlock Drive, Holliston MA 01746, USA VERWIJS, Marinus, Jacobus, 4 Carter Drive, Framingham MA 01701, USA OVERHOFF, Kirk, 47 Alder Street 25, Waltham MA 02453, USA GROOTENHUIS, Peter, D. J., 4801 Riding Ridge Road, San Diego CA 92130, USA BOTFIELD, Martyn, 47 Walden Terrace, Concord MA 01742, USA GROSSI, Alfredo, 102 Tern Hills Road, Somerville MA 02145, USA ZLOKARNIK, Gregor, 2754 Palomino Circle, La Jolla CA 92037, USA VAN GOOR, Fredrick F., 832 Ormond Court, San Diego CA 92109, USA
(74)	Agent or Attorney	AWA NORWAY AS, Postboks 1052 Hoff, 0218 OSLO, Norge

(54)	Title	Tablet formulation of N-[2,4-bis(1,1-dimethylethyl)-5-hydroxyphenyl]-1,4-dihydro-4-oxoquinoline-3-carboxamide for use in the treatment of cystic fibrosis
(56)	References Cited:	WO-A2-2007/079139 WO-A2-2010/019239 WO-A2-2009/023509 ON BEHALF OF THE VX-770 STUDY INVESTIGATORS ET AL: "Final results of a 14- and 28-day study of VX-770 in subjects with CF" JOURNAL OF CYSTIC FIBROSIS, ELSEVIER, vol. 8, 1 June 2009 (2009-06-01), page S25, XP026192272 ISSN: 1569-1993 [retrieved on 2009-06-01] ANONYMOUS: "Vertex Pharmaceuticals initiates Phase I development for VX-770 in Cystic Fibrosis" INTERNET CITATION 17 May 2006 (2006-05-17), pages 1-2, XP002528469 Retrieved from the Internet: URL:http://files.shareholder.com/downloads/VRTX/641260063x0x84745/fc8ddd6d-3713-48bb-b689-0444fc7ad623/VRTX_News_2006_5_17_General.pdf [retrieved on 2009-05-18] CLUNES M T ET AL: "Front-runners for pharmacotherapeutic correction of the airway ion transport defect in cystic fibrosis" CURRENT OPINION IN PHARMACOLOGY, ELSEVIER SCIENCE PUBLISHERS, NL LNKD- DOI:10.1016/J.COPH.2008.04.006, vol. 8, no. 3, 1 June 2008 (2008-06-01), pages 292-299, XP022711870 ISSN: 1471-4892 [retrieved on 2008-05-28] VAN GOOR F ET AL: "Rescue of CF airway epithelial cell function in vitro by a CFTR potentiator, VX-770" JOURNAL OF CYSTIC FIBROSIS, ELSEVIER, vol. 8, 1 June 2009 (2009-06-01), page S17, XP026192243 ISSN: 1569-1993 [retrieved on 2009-06-01] A. VESTNER ET AL.: "Neue Therapieansätze bei Cystischer Fibrose" PHARMAZIE UNSERER ZEIT, vol. 37, no. 5, 2008, pages 354-355, XP002581329

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 som omfatter ca. 34,1 vekt% av en fast dispersjon beregnet på vekten av sammensetningen, hvor dispersjonen omfatter 80 vekt% av hovedsakelig amorf eller amorf N-[2,4-Bis(1,1-dimetyletyl)-5-hydroksyfenyl]-1,4-dihydro-4-oksokinolin-3-karboksamid (Forbindelse 1)



Forbindelse 1

- beregnet på vekten av dispersjonen, 19,5 vekt% HPMCAS beregnet på vekten av dispersjonen og 0,5 vekt% SLS beregnet på vekten av dispersjonen; omtrent 30,5 vekt% mikrokrySTALLinsk cellulose beregnet på vekten av sammensetningen; omtrent 30,4 vekt% laktose beregnet på vekten av sammensetningen; omtrent 3 vekt% kroskarmellosenatrium beregnet på vekten av sammensetningen; omtrent 0,5 vekt% SLS beregnet på vekten av sammensetningen; omtrent 0,5 vekt% kolloidalt silisiumdioksid beregnet på vekten av sammensetningen; omtrent 1 vekt% magnesiumstearat beregnet på vekten av sammensetningen; hvor den farmasøytiske sammensetningen er laget som en tablett; for anvendelse i behandling eller nedsettelse av alvorlighetsgraden av cystisk fibrose hos en pasient; hvor nevnte anvendelse omfatter administrasjon av den farmasøytiske sammensetning samtidig med, før eller etter en eller flere andre ønskede terapeutiske midler; hvor pasienten har en cystisk fibrose transmembranreseptor (CFTR) med en $\Delta F508$ -mutasjon på begge alleler; og hvor det andre ønskede terapeutiske middel er en annen CFTR-modulator enn forbindelse 1.

2. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 1, hvor den farmasøytiske sammensetningen inneholder 150 mg av forbindelse 1.
3. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 1, hvor den farmasøytiske sammensetningen inneholder 100 mg av forbindelse 1.

4. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 1, hvor det andre ønskede terapeutiske midlet er (3-(6-(1-(2,2-difluorbenzo[d][1,3]dioksol-5-yl)-cyklopropankarboksamido)-3-metylpyridin-2-yl)benzosyre.