



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2593090 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/20 (2006.01)
A61K 9/28 (2006.01)
A61K 31/47 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2022.02.21
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.10.13
(86)	European Application Nr.	11740764.3
(86)	European Filing Date	2011.07.18
(87)	The European Application's Publication Date	2013.05.22
(30)	Priority	2010.07.16, US, 365253 P 2010.08.05, US, 370843 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
(73)	Proprietor	Exelixis, Inc., 1851 Harbor Bay Parkway, Alameda, CA 94502, USA
(72)	Inventor	WILSON, Jo Ann, 74 Seward Street, San Francisco CA 94114, USA
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54) Title **C-MET MODULATOR PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS**

(56) References
Cited: WO-A1-2010/083414
WO-A2-2005/030140
KURZROCK R ET AL: "379 POSTER A phase I study of XL184, a MET, VEGFR2, and RET
kinase inhibitor, administered orally to patients (pts) with advanced malignancies, including a
subgroup of pts with medullary thyroid cancer (MTC)", EUROPEAN JOURNAL OF CANCER.
SUPPLEMENT, PERGAMON, OXFORD, GB, vol. 6, no. 12, 1 October 2008 (2008-10-01), page
119, XP025534443, ISSN: 1359-6349, DOI: 10.1016/S1359-6349(08)72313-9 [retrieved on
2008-10-01]

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/>

EP 2 593 090

1

Patentkrav

1. En farmasøytisk tablett sammensetning som omfatter:

30-32 vekt% av Forbindelse I, malatsalt;

38-40 vekt% av mikrokrySTALLINSK cellulose;

18-22 vekt% av laktose;

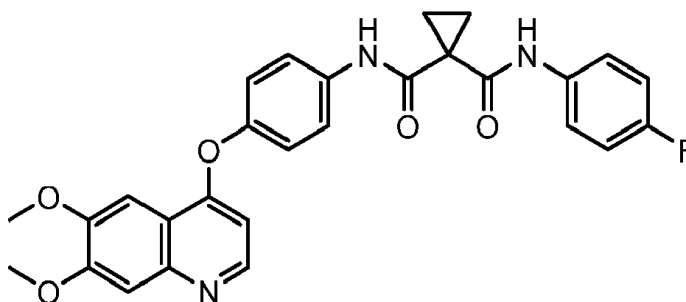
2-4 vekt% av hydrokSYpropylcellulose;

4-8 vekt% av kroskarmellose natrium;

0.2-0.6 vekt% av kolloidalt silisiumdioksid; og

0.5-1 vekt% av magnesiumstearat;

hvor Forbindelse I er:



2. Den farmasøytiske tablett sammensetningen ifølge krav 1, hvor sammensetningen omfatter:

Ingrediens	(% vekt/vekt)
Forbindelse I, malatsalt	31,68
MikrokrySTALLINSK cellulose	38,85
Vannfri laktose	19,42
HydrokSYpropylcellulose	3,00
Kroskarmellose natrium	3,00
Totalt Intra-granulært	95,95

EP 2 593 090

2

Ingrediens	(% vekt/vekt)
Silisiumdioksid, kolloidalt	0,30
kroscarmellose natrium	3,00
Magnesiumstearat	0,75
Totalt	100,00

3. Den farmasøytiske tablett sammensetningen ifølge krav 1 eller krav 2, hvor Forbindelse I er i formen av L-malatsaltet.

5 **4.** Den farmasøytiske tablett sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-3, hvor forbindelsen I malatsalt er i amorf, hovedsakelig amorf, krystallinsk, eller hovedsakelig krystallinsk form.

10 **5.** Den farmasøytiske tablett sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-4, som videre omfatter et filmbelegg.

6. Den farmasøytiske tablett sammensetningen ifølge krav 5, hvor filmbelegget omfatter hypromellose, titanoksid, triacetin, og jernoksidgult.

15 **7.** Den farmasøytiske tablett sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-6, hvor sammensetningen inneholder fra 20 til 100 mg av Forbindelse I.

20 **8.** Den farmasøytiske tablett sammensetningen ifølge krav 7, hvor sammensetningen inneholder 20, 25, 50, 60, 75, 80, eller 100 mg av Forbindelse I.

25 **9.** Forbindelse I, malatsalt for anvendelse i behandlingen av kreft, hvor nevnte behandling omfatter å administrere til en pasient med behov for slik behandling en farmasøytisk tablett sammensetning i henhold til et hvilket som helst av kravene 1-8, alene eller i kombinasjon med et annet terapeutisk middel.

EP 2 593 090

3

10. En farmasøytisk tablett-sammensetning i henhold til et hvilket som helst av kravene 1-8 for anvendelse in behandlingen av kreft.

5 **11.** Anvendelse av Forbindelse I, malatsalt for fremstillingen av et medikament for behandlingen av kreft, hvor nevnte behandling omfatter å administrere til en pasient med behov for slik behandling en farmasøytisk tablett-sammensetning i henhold til et hvilket som helst av kravene 1-8, alene eller i kombinasjon med et annet terapeutisk middel.

10 **12.** Anvendelse av en farmasøytisk tablett-sammensetning i henhold til et hvilket som helst av kravene 1-8 for fremstillingen av et medikament for behandlingen av kreft.

15 **13.** Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 9, den farmasøytiske tablett-sammensetningen for anvendelse ifølge krav 10, eller anvendelsen ifølge krav 11 eller krav 12, hvor kreften er valgt fra gruppen som består av bukspyttkjertelkreft, nyrekreft, leverkreft, prostata kreft, magekreft, gastroøsofageal kreft, melanom, lungekreft, brystkreft, skjoldbruskkjertelkreft, astrocytiske svulster, hepatocellulært karsinom (HCC), nyrecellekarsinom, kastrasjonsresistent prostata kreft (CRPC), kreft i mage eller gastroøsofagealt kryss, småcellet lungekreft (SCLC),
20 eggstokk-kreft, primær peritoneal eller eggleder-karsinom, østrogenreseptor positive brystkreft, østrogenreseptor/progesteronreseptor/HER2-negativ (triple-negativ) brystkreft, inflammatorisk (uansett reseptor status) brystkreft, ikke-småcellet lungekreft (NSCLC), eller medullær skjoldbruskkjertelkreft.

25