



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2654736 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/28 (2006.01)
A61K 9/20 (2006.01)
A61K 31/519 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2020.11.02
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.07.01
(86)	European Application Nr.	11849974.8
(86)	European Filing Date	2011.12.20
(87)	The European Application's Publication Date	2013.10.30
(30)	Priority	2010.12.20, US, 201061424967 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	Novartis AG, Lichtstrasse 35, 4056 Basel, Sveits
(72)	Inventor	DeMARINI, Douglas, J., 1250 South Collegeville Road, CollegevillePA 19426, USA LE, Ngocdiep, T., 1250 South Collegeville Road, CollegevillPA 19426, USA HENRIQUEZ, Francisco, 1250 South Collegeville Road, CollegevillePA 19426, USA WANG, Lihong, 1250 South Collegevill Road, CollegevillPA 19426, USA
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

(54) Title **NOVEL PHARMACEUTICAL COMPOSITION**

(56) References
Cited:

WO-A1-2011/047238
EP-A2- 2 482 819
WO-A1-2012/027438
US-A1- 2008 254 131
US-A1- 2010 240 613

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 tablett omfattende:
- a) et legemiddel som er N-{3-[3-syklopropyl-5-(2-fluor-4-jod-fenylamino)-6,8-dimetyl-
5 2,4,7-triokso-3,4,6,7-tetrahydro-2H-pyrido[4,3-d]pyrimidin-1-yl]fenyl}acetamiddimetylsulfoksidsolvat i en mengde valgt fra: 0,5 mg, 1 mg og 2 mg, i vekt-% av N-{3-[3-syklopropyl-5-(2-fluor-4-jod-fenylamino)-6,8-dimetyl-2,4,7-triokso-3,4,6,7-tetrahydro-2H-pyrido[4,3-d]pyrimidin-1-yl]fenyl}acetamid;
hvor,
- 10 b) tablett inneholder fra 25 til 89 vekt-% av én eller flere eksipienser, der eksipiensene inneholder ca. 5 vekt-% eller mindre vann; og
c) mengden av usolvatisert legemiddel ikke overstiger ca. 20 %; og
d) legemiddelpartiklene er mikroniserte.
- 15 2. Farmasøytisk tablett ifølge krav 1, hvori N-{3-[3-syklopropyl-5-(2-fluor-4-jod-fenylamino)-6,8-dimetyl-2,4,7-triokso-3,4,6,7-tetrahydro-2H-pyrido[4,3-d]pyrimidin-1-yl]fenyl}acetamiddimetylsulfoksidsolvat er til stede i en mengde valgt fra 0,5 mg og 2 mg vekt-% av N-{3-[3-syklopropyl-5-(2-fluor-4-jod-fenylamino)-6,8-dimetyl-2,4,7-triokso-3,4,6,7-tetrahydro-2H-pyrido[4,3-d]pyrimidin-1-yl]fenyl}acetamid.
- 20 3. Farmasøytisk tablett ifølge krav 1 eller 2, hvori mengden av usolvatisert legemiddel ikke overstiger ca. 15 %.
4. Farmasøytisk tablett ifølge krav 1 eller 2, hvori mengden av usolvatisert legemiddel ikke
25 overstiger ca. 10 %.
5. Farmasøytisk tablett ifølge krav 1 eller 2, hvori mengden av usolvatisert legemiddel ikke overstiger ca. 5 %.
- 30 6. Farmasøytisk tablett ifølge krav 1 eller 2, hvori mengden av usolvatisert legemiddel ikke overstiger ca. 2 %.

7. Farmasøytisk tablett ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori minst 50 % av legemiddelpartiklene har en partikkelstørrelse på 30 mikron eller mindre.
8. Farmasøytisk tablett ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori minst 50 % av legemiddelpartiklene har en partikkelstørrelse på 5 mikron eller mindre.
9. Farmasøytisk tablett ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, hvori tablett inneholder fra 25 til 89 vekt-% av én eller flere eksipienser valgt fra:
mikrokrystallinsk cellulose, pulverisert cellulose, forgelatinisert stivelse,
stivelse, laktose, Di-kalsiumfosfat, laktitol, mannitol, sorbitol og maltodekstrin, der eksipiensene inneholder ca. 5 vekt-% eller mindre vann.
10. Farmasøytisk tablett ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori tablett fremstilles i en skala egnet til å fremstille minst 50 000 tabletter.
11. Farmasøytisk tablett ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori tablett er filmbelagt.
12. Farmasøytisk tablett ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori tablett er filmbelagt og hvori filmbelaget inneholder et fargestoff.
13. Farmasøytisk tablett ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori tablett er filmbelagt og hvori filmbelaget inneholder et fargestoff som inneholder jernoksid.
14. Farmasøytisk tablett ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene for anvendelse i behandling av kreft hos et menneske med behov derav.
15. Fremgangsmåte for fremstilling av farmasøytiske tabletter som inneholder et legemiddel som er N-{3-[3-syklopropyl-5-(2-fluor-4-jod-fenylamino)-6,8-dimetyl-2,4,7-triokso-3,4,6,7-tetrahydro-2H-pyrido[4,3-d]pyrimidin-1-yl]fenyl}acetamid dimetylsulfoksidsolvat i en mengde valgt fra: 0,5 mg, 1 mg og 2 mg, i vekt-% av N-{3-[3-syklopropyl-5-(2-fluor-4-jod-fenylamino)-6,8-dimetyl-2,4,7-triokso-3,4,6,7-tetrahydro-2H-pyrido[4,3-d]pyrimidin-1-yl]fenyl}acetamid, fremgangsmåten omfatter trinnene:

å blande:

N-{3-[3-syklopropyl-5-(2-fluor-4-jod-fenylamino)-6,8-dimetyl-2,4,7-triokso-3,4,6,7-tetrahydro-2H-pyrido[4,3-d]pyrimidin-1-yl]fenyl}acetamiddimetylsulfoksidsolvat,

én eller flere eksipienser, der eksipiensene inneholder ca. 5 vekt-% eller mindre vann, og

5 ytterligere eksipienser,

for å danne en blanding; og

å komprimere blandingen til tabletter;

forutsatt at:

hver tablett inneholder N-{3-[3-syklopropyl-5-(2-fluor-4-jod-fenylamino)-6,8-dimetyl-

10 2,4,7-triokso-3,4,6,7-tetrahydro-2H-pyrido[4,3-d]pyrimidin-1-

yl]fenyl}acetamiddimetylsulfoksidsolvat i en mengde valgt fra:

0,5 mg, 1 mg og 2 mg, i vekt-% av N-{3-[3-syklopropyl-5-(2-fluor-4-jod-fenylamino)-6,8-dimetyl-2,4,7-triokso-3,4,6,7-tetrahydro-2H-pyrido[4,3-d]pyrimidin-1-yl]fenyl}acetamid;

hver tablett inneholder fra 25 til 89 vekt-% av én eller flere eksipienser, der eksipiensene

15 inneholder ca. 5 vekt-% eller mindre vann; og mengden av usolvatisert legemiddel ikke overstiger ca. 20 %; og

legemiddelpartiklene mikroniseres.