



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 2694037 B1

NORWAY

(19) NO  
(51) Int Cl.  
*A61K 31/137 (2006.01)*  
*A61K 9/16 (2006.01)*  
*A61K 9/20 (2006.01)*  
*A61K 9/48 (2006.01)*  
*A61K 31/661 (2006.01)*  
*A61P 37/06 (2006.01)*

**Norwegian Industrial Property Office**

---

(21) Translation Published 2017.03.06

(80) Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent 2016.10.12

(86) European Application Nr. 12714163.8

(86) European Filing Date 2012.03.30

(87) The European Application's Publication Date 2014.02.12

(30) Priority 2011.04.01, US, 201161470747 P  
2011.10.11, US, 201161545835 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

(73) Proprietor Novartis AG, Lichtstrasse 35, 4056 Basel, CH-Sveits

(72) Inventor RANE, Supriya, Novartis Pharmaceuticals Corporation One Health Plaza, East Hanover, New Jersey 07936-1080, US-USA

(74) Agent or Attorney Zacco Norway AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

---

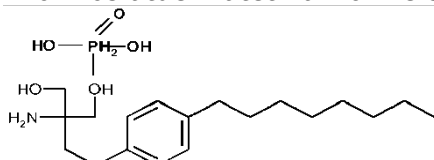
(54) Title **FORMULATIONS COMPRISING 2-AMINO-2-[2-(4-OCTYLPHENYL)ETHYL]PROPANE-1,3-DIOL**

(56) References Cited: EP-A1- 1 050 301  
WO-A2-2005/025553  
WO-A2-2008/037421  
"SOLID STATE FORMS OF 2-AMINO-2-[2-(4-OCTYLPHENYL)ETHYL]-1,3-PRO PANEDIOL HYDROCHLORIDE", IP.COM JOURNAL, IP.COM INC., WEST HENRIETTA, NY, US, 3 March 2011 (2011-03-03), XP013148489, ISSN: 1533-0001  
THORSTEINN LOFTSSON ET AL: "Pharmaceutical Applications of Cyclodextrins. 1. Drug Solubilization and Stabilization", JOURNAL OF PHARMACEUTICAL SCIENCES, AMERICAN PHARMACEUTICAL ASSOCIATION, WASHINGTON, US, vol. 85, no. 10, 1 October 1996 (1996-10-01), pages 1017-1025, XP002080430, ISSN: 0022-3549, DOI: 10.1021/JS950534B

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.** Fast farmasøytisk sammensetning egnet for oral administrering, omfattende
- 5 a) en første forbindelse valgt fra 2-amino-2-[2-(4-oktylfenyl)etyl]propan-1,3-diol, et farmasøytisk akseptabelt salt derav og et fosfatderivat derav,
- b) et fyllstoff, og
- c) en stabilisator omfattende et syklodekstrin eller et derivat derav,
- hvor fosfatderivatet har formelen



- 10 hvor syklodekstrinet eller derivatet derav er naturlig syklodekstrin, et forgrenet syklodekstrin, et alkyl-syklodekstrin eller et hydroksyalkyl-syklodekstrin, og hvor sammensetningen omfatter mindre enn 0,5 mg av den første forbindelsen.

- 2.** Sammensetningen ifølge krav 1, hvor fyllstoffet omfatter en sukkeralkohol.

15

- 3.** Sammensetningen ifølge krav 2, hvor fyllstoffet omfatter mannitol som sukkeralkohol.

- 4.** Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, ytterligere omfattende et bindemiddel.

20

- 5.** Sammensetningen ifølge krav 4, hvor bindemiddelet omfatter hydroksypropylcellulose.

25

- 6.** Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, ytterligere omfattende et smøremiddel.

- 7.** Sammensetning ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvor syklodekstrinet eller derivatet derav er  $\alpha$ -syklodekstrin;  $\beta$ -syklodekstrin,  $\gamma$ -syklodekstrin; hydroksypropyl-syklodekstrin, sulfobutyleter  $\beta$ -syklodekstrin, dodekakis-2,6,0-metyl- $\alpha$ -syklodekstrin, tetradekakis-2,6,0-metyl- $\beta$ -syklodekstrin, heksadekakis-2,6,0-metyl- $\gamma$ -syklodekstrin, tetradekakis-2,6,0-etyl- $\beta$ -syklodekstrin,  $\alpha$ -syklodekstrin delvis eterisert med 2-hydroksypropyl,  $\beta$ -syklodekstrin delvis eterisert med 2-hydroksypropyl, forgrenet  $\alpha$ -syklodekstrin

30

eller forgrenet  $\beta$ -syklodekstrin, der glukose eller maltose er bundet via  $\alpha$ -1,6 glukosidbinding.

5 **8.** Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6, hvori stabilisatoren omfatter hydroksypropyl-beta-syklodekstrin.

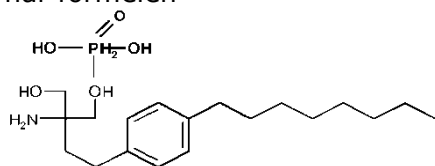
10 **9.** Sammensetning ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori stabilisatoren er til stede i 0,4 til 3 ganger mengden av 2-amino-2-[2-(4-oktylfenyl)etyl]propan-1,3-diol eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, i et mol-til-mol-forhold.

15 **10.** Sammensetning ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori den første forbindelsen er 2-amino-2-[2-(4-oktylfenyl)etyl]propan-1,3-diol eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

**11.** Sammensetning ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene for anvendelse i behandling av en autoimmun sykdom.

20 **12.** Sammensetning ifølge krav 11, hvori den autoimmune sykdommen er multipel sklerose.

25 **13.** Sammensetning ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori den farmasøytiske sammensetningen er i enhetsdoseform, der hver enhet omfatter 0,03 til 0,40 mg 2-amino-2-[2-(4-oktylfenyl)etyl]propan-1,3-diol i fri form, i form av et farmasøytisk akseptabelt salt, og et fosfatderivat derav som har formelen



30 **14.** Sammensetning ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori den farmasøytiske sammensetningen er en tablett eller en kapsel.