



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2695609 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/20 (2006.01)
A61K 9/28 (2006.01)
A61K 31/7068 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2020.02.17
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.12.11
(86)	European Application Nr.	13182721.4
(86)	European Filing Date	2009.05.14
(87)	The European Application's Publication Date	2014.02.12
(30)	Priority	2008.05.15, US, 53609 P 2008.12.05, US, 201145 P 2009.03.05, US, 157875 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 ; TR
(62)	Divided application	EP2299984, 2009.05.14
(73)	Proprietor	CELGENE CORPORATION, 86 Morris Avenue, Summit, NJ 07901, USA
(72)	Inventor	Etter, Jeffrey B., 1318 Deer Train Rd., Boulder, CO 80302, USA Lai, Mei, 1038 Neon Forest Circle, Longmont, CO 80504, USA Backstrom, Jay T., 15400 Aberdeen St., Leawood, KS 66224, USA
(74)	Agent or Attorney	OSLO PATENTKONTOR AS, Hoffsvæien 1A, 0275 OSLO, Norge

(54)	Title	Oral formulations of cytidine analogs and methods of use thereof
(56)	References Cited:	WO-A2-2008/028193 US-A1- 2004 186 065 STOLTZ: "Development of an Oral Dosage Form of Azacitidine: Overcoming Challenges in Chemistry, Formulation, and Bioavailability", ASH ANNUAL MEETING, vol. 108, 1 January 2006 (2006-01-01), XP009121611, WARD: "An oral dosage formulation of azacitidine: A pilot pharmacokinetic study", JOURNAL OF CLINICAL ONCOLOGY, vol. 25, no. 18S, 1 July 2007 (2007-07-01) , XP009121612,

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 anvendelse i en fremgangsmåte for å behandle et individ som har kreft, hvor fremgangsmåten omfatter oral administrasjon av den farmasøytiske sammensetningen en gang per dag, og hvor
5 den farmasøytiske sammensetningen omfatter en terapeutisk effektiv mengde av 5-azacytidin og er en sammensetning med øyeblikkelig frigivelse.
2. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 1, hvor fremgangsmåten omfatter administrasjon daglig til individet av den farmasøytiske
10 sammensetningen i 7 eller flere dager.
3. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 2, hvor fremgangsmåten videre omfatter administrasjon av et ytterligere terapeutisk middel.
15
4. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvor kreften er myelodysplastisk syndrom, akutt myelogen leukemi, ikke-småcellet lungekreft, eggstokkreft, kreft i bukspyttkjertelen eller tykktarmskreft.
20
5. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, hvor mengden av 5-azacytidin er ca. 40 mg, ca. 400 mg, eller ca. 1000 mg.
- 25 6. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5, hvor sammensetningen er ikke-enterisk belagt.
7. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6, hvor sammensetningen er en enhetsdoseringsform.
30
8. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7, hvor sammensetningen er en tablett eller kapsel.
9. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av
35 kravene 1 til 8, hvor sammensetningen videre omfatter en eksipiens valgt fra mannitol, mikrokrySTALLinsk cellulose, crospovidon og magnesiumstearat.

10. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 9, hvor sammensetningen videre omfatter en gjennomsyrringsforsterker.
- 5 11. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, hvor permeasjonsforsterkeren er d-alfa-tokoferylpolyetylenglykol-1000-suksinat, eventuelt hvor d-alfa-tokoferylpolyetylenglykol-1000-suksinat er til stede i formuleringen på omtrent 2 vekt% relativt til formuleringens totale vekt.
- 10 12. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 11, som i det vesentlige er fri for en cytidindeaminaseinhibitor, eller som i det vesentlige er fri for tetrahydrouridin.
- 15 13. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 12, hvor sammensetningen oppnår en areal-under-kurveverdi på minst 200 ng-time/ml eller minst 400 ng-time/ml etter oral administrasjon, eller hvor sammensetningen oppnår en maksimal plasmakonsentrasjon på minst ca. 100 ng/ml eller minst ca. 200 ng/ml etter oral administrasjon, eller hvor sammensetningen oppnår en tid til maksimal plasmakonsentrasjon på mindre enn 20 ca. 60 minutter, mindre enn ca. 90 minutter, eller mindre enn ca. 180 minutter etter oral administrasjon til individet.
14. Sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 13, hvor individet er et menneske.