



(12) **Translation of
European patent specification**

(11) **NO/EP 2978416 B1**

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/01 (2006.01)
A61P 1/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

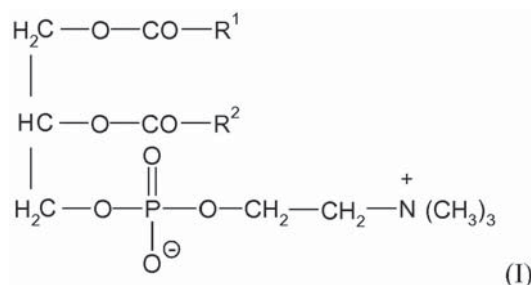
(21)	Translation Published	2017.01.30
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2016.10.26
(86)	European Application Nr.	14713808.5
(86)	European Filing Date	2014.03.25
(87)	The European Application's Publication Date	2016.02.03
(30)	Priority	2013.03.26, EP, 13161089
(84)	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	Lipid Therapeutics GmbH, Boxbergring 107, 69126 Heidelberg, DE-Tyskland
(72)	Inventor	KEILHAUER, Gerhard, Landauerstrasse 13, 67125 Dannstadt, DE-Tyskland
(74)	Agent or Attorney	Bryn Aarflot AS, Postboks 449 Sentrum, 0104 OSLO, Norge

(54)	Title	PHARMACEUTICAL FORMULATION COMPRISING PHOSPHATIDYLCHOLINE FOR THE TREATMENT OF ULCERATIVE COLITIS
(56)	References Cited:	EP-A1- 0 479 121 EP-A2- 0 112 174

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

- 5 1. Farmasøytisk formulering omfattende:
i det minste ett fosfatidylcholinprodukt (PC) med formel (I),



hvor:

- 10 R^1 er resten av en mettet eller umettet fettsyre med 12-24 karbonatomer,
og R^2 er resten av en mettet eller umettet fettsyre med 12-24 karbonatomer, og hvor
fosfatidylcholinproduktet (PC) inneholder de følgende mengder av fettsyrer (i
vektprosent av den totale mengde av fettsyrer i PC):

55 - 72	linolsyre
10 - 18	palmitinsyre
07 - 15	oljesyre
02 - 08	linolensyre
02 - 08	stearinsyre,

15

og minst en farmasøytisk akseptabel eksipiens for forsinket frigjøring av
fosfatidylcholinproduktet (PC),
hvor i fosfatidylcholinproduktet (PC) angir 94 vekt% av alle lipid/fosfolipid-
komponentene i formuleringen.

20

2. Farmasøytisk formulering ifølge krav 1, omfattende minst ett
fosfatidylcholinprodukt (PC) med formel (I), hvor:

R^1 er resten av en mettet eller umettet fettsyre med 14-20 karbonatomer,
og R^2 er resten av en mettet eller umettet fettsyre med 14-20 karbonatomer, og hvor
25 fosfatidylcholinproduktet (PC) inneholder følgende mengder av fettsyrerester (i
vektprosent av den totale mengde av fettsyrer i PC):

59 - 70	linolsyre
12 - 17	palmitinsyre
07 - 15	oljesyre
03 - 07	linolensyre
02 - 05	stearinsyre

og minst en farmasøytisk akseptabel eksipiens, hvor den farmasøytiske formuleringen frigjør minst 50%, spesielt minst 70 vekt% av fosfatidylcholin- produktet (PC) i tarmen.

3. Farmasøytisk formulering ifølge krav 1 eller 2, hvor det farmasøytiske preparat omfatter minst ett fosfatidylcholinprodukt (PC) med formel (I), hvor mer enn 78vekt%, spesielt mer enn 80 vekt% av fettsyrerestene R¹ og R² er umettet fettsyre med 18 karbonatomer.

4. Farmasøytisk formulering ifølge ett av kravene 1 til 3, hvor den farmasøytiske formuleringen omfatter en eller flere enterisk belagte pelleter, en eller flere enterisk belagt kapsler, en eller flere enterisk belagte granuler eller en eller flere enterisk belagt tabletter bestående av fosfatidylcholinproduktet (PC) og minst ett lag av et enterisk polymerbelegg som er motstandsdyktig mot magesyrer.

5. Farmasøytisk formulering ifølge ett av kravene 1 til 4, hvor vektforholdet mellom enterisk polymerbelegg og fosfatidylcholinprodukt (PC) er fra 3:1 til 1:3, og hvor PCet er i en multippelenhet-doseringsform.

6. Farmasøytisk formulering ifølge ett av kravene 1 til 5, omfattende en eller flere enterisk belaget pelleter eller en eller flere enterisk belagte kapsler eller en eller flere enterisk belagte granuler eller en eller flere enterisk belagt tabletter som har et enterisk polymerbelegg med en tykkelse av 10 til 500 mikrometer.

7. Farmasøytisk formulering ifølge ett av kravene 1 til 6, som omfatter fosfatidylcholinproduktet (PC) som er beskyttet med et enterisk polymerbelegg, som er motstandsdyktig mot magesyrer (pH 1) i minst 120 minutter, men som gjør det mulig at minst 80% av fosfatidylcholinproduktet (PC) frigis fra formuleringen ved en

pH på 5,5 eller høyere i løpet av 120 minutter.

5 8. Farmasøytisk formulering ifølge ett av kravene 1 til 7, omfattende i det minste ett lag med minst en enterisk polymer fra gruppen av homopolymerer og kopolymerer av akrylsyre, metakrylsyre, akrylester og metakrylester.

9. Farmasøytisk formulering ifølge ett av kravene 1 til 8, omfattende fra 20 til 30 vekt% av et fosfatidylcholinprodukt (PC) med formel (I) og 70 til 80 vekt% hjelpestoffer.

10

10. Farmasøytisk formulering ifølge ett av kravene 1 til 9, som har en langtidsstabilitet, karakterisert ved mengden på minst 95 vekt% av Assay-PC (i forhold til nominell verdi) og mindre enn 5 vekt% av Lyso-PC (i forhold til PC) etter 36 måneder ved kjølelagring (5 °C pluss/minus 3 °C).

15

11. Fremgangsmåte for fremstilling av en farmasøytisk formulering ifølge ett av kravene 1 til 10, omfattende trinnet med fremstilling av en eller flere pelleter eller en eller flere kapsler eller en eller flere granuler eller en eller flere tabletter inneholdende minst ett fosfatidylcholinprodukt (PC) med formel (I), og deretter tilveiebringe en eller flere av pelletene eller en eller flere av kapslene eller en eller flere av granulene eller en eller flere av tablettene med minst ett lag av minst ett enterisk polymerbelegg.

20

12. Formulering ifølge ett av kravene 1 til 10 for behandling eller forebygging av en tilstand eller sykdom blant følgende: ulcerøs kolitt, Crohns sykdom, diversion kolitt, infeksjons enteritt, infeksjons kolitt, inflammasjon på grunn av stråling og inflammasjon på grunn av kjemoterapeutika eller kjemikalier, særlig for behandling av ulcerøs kolitt i 5-ASA motstandsdyktige pasienter.

25

13. Formulering ifølge krav 12 for behandling eller forebygging av ulcerøs kolitt, Crohns sykdom eller ulcerøs kolitt i 5-ASA motstandsdyktige eller steroid-motstandsdyktige pasienter.

30

14. Formulering ifølge ett av kravene 12 eller 13 for behandling eller forebygging av ulcerøs kolitt i 5-ASA motstandsdyktige pasienter, hvor en dose på 0,5 til 8 g, spesielt 2 til 6 g, av et fosfatidylcholinprodukt (PC) med formel (I) tilføres per dag.

35

15. Formulering ifølge ett av kravene 12 til 14 for behandling eller forebygging av ulcerøs kolitt i 5-ASA motstandsdyktige pasienter, hvor den daglige dosen av fosfatidylcholinprodukt (PC) med formel (I) blir tilført to ganger eller tre ganger eller fire ganger per dag.

5

16. Formulering ifølge ett av kravene 12 til 15 for behandling av ulcerøs kolitt i 5-ASA motstandsdyktige pasienter, hvor en daglig dose på 0,5 til 8 g fosfatidylcholinprodukt (PC) med formel (I) blirtilført i form av PC-inneholdende pelleter i en enkelt dosebeholder.

10