



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2979701 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/7072 (2006.01)
A61K 31/4745 (2006.01)
A61K 31/506 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)
A61P 43/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2020.12.21
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.08.26
(86)	European Application Nr.	14773672.2
(86)	European Filing Date	2014.03.27
(87)	The European Application's Publication Date	2016.02.03
(30)	Priority	2013.03.27, JP, 2013066073
(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	Taiho Pharmaceutical Co., Ltd., 1-27, Kandanishiki-cho, Chiyoda-ku, Tokyo 101-8444, Japan
(72)	Inventor	OKABE, Hiroyuki, c/o Taiho Pharmaceutical Co., Ltd.3, Okubo, Tsukuba-shilbaraki 300-2611, Japan
(74)	Agent or Attorney	TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

(54)	Title	ANTITUMOR AGENT INCLUDING IRINOTECAN HYDROCHLORIDE HYDRATE
(56)	References Cited:	WO-A1-2006/080327 TEMMINK, O.H. ET AL.: 'Irinotecan-induced cytotoxicity to colon cancer cells in vitro is stimulated by pre-incubation with trifluorothymidine.' EUROPEAN JOURNAL OF CANCER vol. 43, no. 1, 2007, pages 175 - 183, XP005834920 TEMMINK, O.H. ET AL.: 'Therapeutic potential of the dual-targeted TAS-102 formulation in the treatment of gastrointestinal malignancies.' CANCER SCI. vol. 98, no. 6, 2007, pages 779 - 789, XP055281121 SOTARO SADAHIRO ET AL.: 'Two Patients with Recurrent Colon Cancer Who Underwent Surgery Following a Combination of Irinotecan and UFT' JAPANESE JOURNAL OF CANCER AND CHEMOTHERAPY vol. 29, no. 11, 2002, pages 2013 - 2018, XP008180952 YOSHINO ET AL: "TAS-102 monotherapy for pretreated metastatic colorectal cancer: a double-blind, randomised, placebo-controlled phase 2 trial", LANCET/ONCOLOGY, vol. 13, no. 10,

October 2012 (2012-10), pages 993-1001, XP002762779, ISSN: 1470-2045, DOI:
10.1016/S1470-2045(12)70345-5

YAMAZAKI, K. ET AL.: 'A first combination phase I study of TAS-102 and irinotecan (Iri) in Japanese patients (pts) with metastatic colorectal cancer (mCRC) refractory to fluoropyrimidine (FU) and oxaliplatin (Ox).' EUROPEAN JOURNAL OF CANCER vol. 49, no. SUPPL., September 2013, page S555, XP055291370

AYUMU GOTO: 'Daicho Gan Kagaku Ryoho -Saikin no Heiyo Toyo- TS-1/Irinotecan Heiyo Ryoho -Genzai no Chiken' JAPANESE JOURNAL OF CANCER AND CHEMOTHERAPY vol. 33,

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. Et kombinasjonsmedikament omfattende trifluridin og tipirasilhydroklorid i et
5 molforhold på 1:0,5 for bruk i behandling av et solid kreft, hvor én syklus av et
administreringsskjema, der, i løpet av en periode på 14 dager,
kombinasjonsmedikamentet som omfatter trifluridin og tipirasilhydroklorid i et molforhold
på 1:0,5 administreres i en dose på 20 til 80 mg/m²/dag trifluridin på dag 1 til 5 og
irinotecan-hydrokloridhydrat administreres i en dose på 50 til 200 mg/m²/dag på dag 1,
10 gjentas én eller to ganger eller flere ganger.

2. Kombinasjonsmedikament for bruk ifølge krav 1, hvor
kombinasjonsmedikamentet som omfatter trifluridin og tipirasilhydroklorid i et molforhold
på 1:0,5 administreres i en dose på 40 til 70 mg/m²/dag trifluridin.

15 3. Kombinasjonsmedikament for bruk ifølge krav 1 eller 2, hvor irinotecan-
hydrokloridhydrat administreres i en dose på 100 til 180 mg/m²/dag.

4. Kombinasjonsmedikament for bruk ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvor
20 nevnte solid kreft er kolorektal kreft, lungekreft, brystkreft, pankreaskreft eller
gastriskkreft.

5. Et kombinasjonsmedikament omfattende trifluridin og tipirasilhydroklorid i et
molforhold på 1:0,5 for bruk til å styrke antitumoreffekten av irinotecan-
25 hydrokloridhydrat av en pasient med solid kreft, hvor én syklus av en
administrasjonsskjema, der, i løpet av en periode på 14 dager,
kombinasjonsmedikamentet som omfatter trifluridin og tipirasilhydroklorid i et molforhold
på 1:0,5 administreres i en dose på 20 til 80 mg/m²/dag trifluridin på dag 1 til 5 og
irinotecan-hydrokloridhydrat administreres i en dose på 50 til 200 mg/m²/dag på dag 1,
30 gjentas én eller to ganger eller flere ganger.

6. Et kombinasjonsmedikament omfattende trifluridin og tipirasilhydroklorid i et
molforhold på 1:0,5 for bruk i behandling av en pasient med solid kreft, som har mottatt
irinotecan-hydrokloridhydrat, hvor én syklus av en administrasjonsskjema, der, i løpet av
35 en periode på 14 dager, kombinasjonsmedikamentet som omfatter trifluridin og
tipirasilhydroklorid i et molforhold på 1:0,5 administreres i en dose på 20 til 80
mg/m²/dag trifluridin på dag 1 til 5 og irinotecan-hydrokloridhydrat administreres i en
dose på 50 til 200 mg/m²/dag på dag 1, gjentas én eller to ganger eller flere ganger.