



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 3263110 B1

NORWAY

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

**Norwegian Industrial Property Office**

---

(45)	Translation Published	2023.07.31
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.05.10
(86)	European Application Nr.	16755593.7
(86)	European Filing Date	2016.02.25
(87)	The European Application's Publication Date	2018.01.03
(30)	Priority	2015.02.26, JP, 2015037462
(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	Takeda Pharmaceutical Company Limited, 1-1 Doshomachi 4-chome Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka 541-0045, Japan
(72)	Inventor	YAMANE, Ikuro, c/o Spera Pharma, Inc., 17-85 Jusohonmachi 2-chome Yodogawa-ku, Osaka-shi Osaka 532-0024, Japan NOMURA, Yukihiro, c/o TAKEDA PHARMACEUTICAL COMPANY LIMITED 17-85 Jusohonmachi 2-chome Yodogawa-ku, Osaka-shi Osaka 532-0024, Japan NISHIMOTO, Yutaka, c/o TAKEDA PHARMACEUTICAL COMPANY LIMITED 17-85 Jusohonmachi 2-chome Yodogawa-ku, Osaka-shi Osaka 532-0024, Japan HOSHINA, Wataru, c/o TAKEDA PHARMACEUTICAL COMPANY LIMITED 17-85 Jusohonmachi 2-chome Yodogawa-ku, Osaka-shi Osaka 532-0024, Japan
(74)	Agent or Attorney	RWS, Europa House, Chiltern Park, Chiltern Hill, SL99FG CHALFONT ST PETER, Storbritannia

---

(54) Title **A TABLET COMPRISING A METHOXYUREA DERIVATIVE AND MANNITOL PARTICLES**

(56) References  
Cited: EP-A1- 2 329 823  
WO-A1-2004/067535  
WO-A1-2010/026993  
US-A1- 2014 199 236  
JP-A- 2001 278 884  
JP-A- 2003 292 492  
JP-A- 2004 250 439  
JP-A- H08 295 693

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. Tablett omfattende:

5 N-(4-(1-(2,6-difluorbenzyl)-5-((dimetylamino)metyl)-3-(6-metoksy-3-pyridaziny)-2,4-  
diokso-1,2,3,4-tetrahydrotieno[2,3-d]pyrimidin-6-yl)fenyl)-N'-metoksyurea eller et salt  
derav i en mengde på 40 mg målt basert på fri form N-(4-(1-(2,6-difluorbenzyl)-5-  
((dimetylamino)metyl)-3-(6-metoksy-3-pyridaziny)-2,4-diokso-1,2,3,4-  
tetrahydrotieno[2,3-d]pyrimidin-6-yl)fenyl)-N'-meoksyurea,  
10 51 mg D-mannitolpartikler som har en gjennomsnittlig partikkelstørrelse på 70 – 200 µm,  
5 mg natriumstivelsesglykolat,  
3 mg hydroksopropylcellulose, og  
1 mg magnesiumstearat.

15 2. Tabletten ifølge krav 1, videre omfattende et filmbelegg, hvori filmbelegget  
omfatter hydroksopropylmetylcellulose, titanoksid og rødt jernoksid.

20 3. Tabletten ifølge krav 1, videre omfattende et filmbelegg, hvori filmbelegget  
omfatter 3,56 mg hydroksopropylmetylcellulose, 0,40 mg titanoksid og 0,04 mg rødt  
jernoksid.

4. Tablett omfattende:

25 N-(4-(1-(2,6-difluorbenzyl)-5-((dimetylamino)metyl)-3-(6-metoksy-3-pyridaziny)-2,4-  
diokso-1,2,3,4-tetrahydrotieno[2,3-d]pyrimidin-6-yl)fenyl)-N'-metoksyurea eller et salt  
derav i en mengde på 120 mg målt basert på fri form N-(4-(1-(2,6-difluorbenzyl)-5-  
((dimetylamino)metyl)-3-(6-metoksy-3-pyridaziny)-2,4-diokso-1,2,3,4-  
tetrahydrotieno[2,3-d]pyrimidin-6-yl)fenyl)-N'-metoksyurea,  
153 mg D-mannitolpartikler som har en gjennomsnittlig partikkelstørrelse på 70 – 200  
µm,  
15 mg natriumstivelsesglykolat,  
30 9 mg hydroksopropylcellulose, og  
3 mg magnesiumstearat.

35 5. Tabletten ifølge krav 4, videre omfattende et filmbelegg, hvori filmbelegget  
omfatter hydroksopropylmetylcellulose, titanoksid og rødt jernoksid.

6. Tablett omfattende:

N-(4-(1-(2,6-difluorbenzyl)-5-((dimetylamino)metyl)-3-(6-metoksy-3-pyridaziny)-2,4-  
diokso-1,2,3,4-tetrahydrotieno[2,3-d]pyrimidin-6-yl)fenyl)-N'-metoksyurea eller et salt

derav i en mengde på 80 mg målt basert på fri form N-(4-(1-(2,6-difluorbenzyl)-5-((dimetylamino)metyl)-3-(6-metoksy-3-pyridazinyl)-2,4-diokso-1,2,3,4-tetrahydrotieno[2,3-d]pyrimidin-6-yl)fenyl)-N'-metoksyurea,

102 mg D-mannitolpartikler som har en gjennomsnittlig partikkelstørrelse på 70 – 200  
5 µm,

10 mg natriumstivelsesglykolat,

6 mg hydroksypropylcellulose, og

2 mg magnesiumstearat.

10 7. Tabletten ifølge krav 6, videre omfattende et filmbelegg, hvori filmbelegget omfatter hydroksypropylmetylcellulose, titanoksid og rødt jernoksid.

8. Tabletten ifølge krav 6, videre omfattende et filmbelegg, hvori filmbelegget omfatter 7,12 mg hydroksypropylmetylcellulose, 0,80 mg titanoksid og 0,08 mg rødt  
15 jernoksid.

9. Tabletten ifølge et hvilket som helst av kravene 1–8, hvori D-mannitolpartiklene har en gjennomsnittlig partikkelstørrelse på 75 – 150 µm.

20 10. Fremgangsmåte for å lage en tablett ifølge et hvilket som helst av kravene 1, 4 eller 6, fremgangsmåten omfattende:

1) å blande N-(4-(1-(2,6-difluorbenzyl)-5-((dimetylamino)metyl)-3-(6-metoksy-3-pyridazinyl)-2,4-diokso-1,2,3,4-tetrahydrotieno[2,3-d]pyrimidin-6-yl)fenyl)-N'-metoksyurea eller et salt derav med D-mannitolpartikler som har en gjennomsnittlig  
25 partikkelstørrelse på 70–200 µm og natriumstivelsesglykolat;

2) å sprøyte inn i en blanding av trinn 1) en løsning av hydroksypropylcellulose i et løsningsmiddel eller dispergeringsmedium;

3) å tørke eller sikte en blanding av trinn 2) for å gi et granulert pulver eller et siktet pulver;

30 4) å tilsette magnesiumstearat til det granulerte pulveret eller siktede pulveret i trinn 3) og blande det for å gi granuler for tabletering;

5) å tabletere granulene i trinn 4) for å gi en kjernetablett; og eventuelt

6) å sprøyte en filmbeleggingsløsning på kjernetabletten i trinn 5) for å gi en filmbelagt tablett.