



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3277270 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/16 (2006.01)
A61K 9/20 (2006.01)
A61K 9/28 (2006.01)
A61K 31/4418 (2006.01)
A61P 7/06 (2006.01)
C07D 213/16 (2006.01)
C07D 213/81 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2022.01.24
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.10.27
(86)	European Application Nr.	16774184.2
(86)	European Filing Date	2016.03.31
(87)	The European Application's Publication Date	2018.02.07
(30)	Priority	2015.04.01, US, 201562141420 P 2015.12.21, US, 201562270168 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
	Designated Extension States:	BA ; ME
	Designated Validation States:	MA ;MD
(73)	Proprietor	Akebia Therapeutics, Inc., 245 First Street, Suite 1100, Cambridge, MA 02142, USA
(72)	Inventor	SMITH, Alexander, 5240 Levering Mill Road, Apex, NC 27539, USA CHANDORKAR, Gurudatt Ajay, 267 Bishops Forest Drive, Waltham, MA 02452, USA ETTE, Ene Ikpong, 8 Summer Lane, Framingham, MA 01760, USA MARONI, Bradley John, 8 Durham Street, Boston, MA 02115, USA HARTMAN, Charlotte Suzanne, 12927 Birkenstock Street, Carmel, IN 46032, USA FARZANEH-FAR, Ramin, 43 Druce Street, Brookline, MA 02445, USA INRIG, Julia Kern, 20205 Chandler Drive, Yorba Linda, CA 92887, USA

(74) Agent or Attorney BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54) Title **COMPOSITIONS AND METHODS FOR TREATING ANEMIA**

(56) References

Cited:

WO-A1-2014/168986

US-A1- 2014 171 465

WO-A2-2014/200773

WO-A1-2014/197660

QUNIBI, WY ET AL.: 'A randomized controlled trial comparing intravenous ferric carboxymaltose with oral iron for treatment of iron deficiency anaemia of non-dialysis-dependent chronic kidney disease patients.' NEPHROLOGY DIALYSIS TRANSPLANTATION vol. 26, no. 5, 2011, pages 1599 - 1607, XP055317095

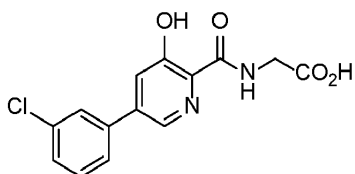
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters 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. Oral doseringsformulering som er en tablett som omfatter en
intragranulær komponent, en ekstragranulær komponent og en
5 filmbeleggkomponent

hvor den intragranulære komponenten omfatter

55% til 75 vekt% av {[5-(3-klorfenyl)-3-hydroksypyridin-2-
karbonyl]amino}eddiksyre,



10 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav,
15% til 35 vekt% av et uløselig fortynningsmiddel eller en bærer,
2,0% til 4,0 vekt% av et desintegreringsmiddel, og
1,8% til 3,8 vekt% av et fortynningsmiddel eller fyllstoff;
hvor den ekstragranulære komponenten omfatter
15 2,0% til 4,0 vekt% av et desintegreringsmiddel,
0,15% til 0,35 vekt% av et glidemiddel, og
0,35% til 1,15 vekt% av et smøremiddel;
hvor filmbeleggkomponenten omfatter 1,0 til 8 vekt% av et
tablettbelegg; og
20 hvor vekten er den totale vekten av alle intra-granulære og ekstra-
granulære komponenter.

2. Oral doseringsformuleringen ifølge krav 1

hvor den intragranulære komponenten omfatter

25 60% til 70 vekt% av {[5-(3-klorfenyl)-3-hydroksypyridin-2-
karbonyl]amino}eddiksyre,
20% til 30 vekt% av et uløselig fortynningsmiddel eller en bærer,
2,5% til 3,5 vekt% av et desintegreringsmiddel, og
2,3% til 3,3 vekt% av et fortynningsmiddel eller fyllstoff;

- hvor den ekstragranulære komponenten omfatter
2,5% til 3,5 vekt% av et desintegreringsmiddel,
0,2% til 0,3 vekt% av et glidemiddel, og
0,55% til 0,95 vekt% av et smøremiddel;
- 5 hvor filmbeleggkomponenten omfatter 1,0 til 8 vekt% av et
tablettbelegg; og
hvor vekten er den totale vekten av alle intra-granulære og ekstra-
granulære komponenter.
- 10 3. Oral doseringsformuleringen ifølge krav 1 eller 2
hvor den intragranulære komponenten omfatter
ca. 65 vekt% av {[5-(3-klorfenyl)-3-hydroksypyridin-2-
karbonyl]amino}eddiksyre,
ca. 25 vekt% av et uløselig fortynningsmiddel eller en bærer,
- 15 ca. 3 vekt% av et desintegreringsmiddel, og
ca. 2,8 vekt% av et fortynningsmiddel eller fyllstoff;
hvor den ekstragranulære komponenten omfatter
ca. 3 vekt% av et desintegreringsmiddel,
ca. 0,25 vekt% av et glidemiddel, og
- 20 ca. 0,75 vekt% av et smøremiddel;
hvor filmbeleggkomponenten omfatter 2,0 til 6,0 vekt% av et
tablettbelegg; og
hvor vekten er den totale vekten av alle intra-granulære og ekstra-
granulære komponenter.
- 25 4. Oral doseringsformuleringen ifølge hvilket som helst av kravene 1-3,
hvor det uløselige fortynningsmidlet eller bæreren er mikrokrySTALLinsk
cellulose, desintegreringsmidlet er natriumstivelsesglykolat,
fortynningsmidlet eller fyllstoffet er hydroksypropylmetylcellulose,
- 30 glidemidlet er kolloidalt silisiumdioksid, smøremidlet er

magnesiumstearat og filmbeleggkomponentene omfatter Opadry®.

5. Oral doseringsformuleringen ifølge krav 4,
hvor den intragranulære komponenten omfatter
5 55% til 75 vekt% av [5-(3-klorfenyl)-3-hydroksypyridin-2-
karbonyl]amino}eddiksyre,
15% til 35 vekt% mikrokrySTALLinsk cellulose,
2,0% til 4,0 vekt% natriumstivelsesglykolat, og
1,8% til 3,8 vekt% av en hydroksypropylmetylcellulose;
10 hvor den ekstragranulære komponenten omfatter
2,0% til 4,0 vekt% av et natriumstivelsesglykolat,
0,15% til 0,35 vekt% kolloidalt silisiumdioksyd, og
0,35% til 1,15 vekt% magnesiumstearat;
hvor filmbeleggkomponenten omfatter 1,0 til 8 vekt% Opadry®; og
15 hvor vekten er den totale vekten av alle intra-granulære og ekstra-
granulære komponenter.

6. Oral doseringsformuleringen ifølge krav 4 eller 5,
hvor den intragranulære komponenten omfatter
20 60% til 70 vekt% av [5-(3-klorfenyl)-3-hydroksypyridin-2-
karbonyl]amino}eddiksyre,
20% til 30 vekt% mikrokrySTALLinsk cellulose,
2,5% til 3,5 vekt% natriumstivelsesglykolat, og
2,3% til 3,3 vekt% av en hydroksypropylmetylcellulose;
25 hvor den ekstragranulære komponenten omfatter
2,5% til 3,5 vekt% av et natriumstivelsesglykolat,
0,2% til 0,3 vekt% kolloidalt silisiumdioksyd, og
0,55% til 0,95 vekt% magnesiumstearat;
hvor filmbeleggkomponenten omfatter 1,0 til 8 vekt% Opadry®; og
30 hvor vekten er den totale vekten av alle intra-granulære og ekstra-
granulære komponenter.

7. Oral doseringsformuleringen ifølge hvilket som helst av kravene 4-6, hvor den intragranulære komponenten omfatter ca. 65 vekt% av [5-(3-klorfenyl)-3-hydroksypyridin-2-karbonyl]amino}eddiksyre,
5 ca. 25 vekt% mikrokrySTALLinsk cellulose,
ca. 3 vekt% natriumstivelsesglykolat, og
ca. 2,8 vekt% av en hydroksypropylmetylcellulose;
hvor den ekstragranulære komponenten omfatter
ca. 3 vekt% av et natriumstivelsesglykolat,
10 ca. 0,25 vekt% kolloidalt silisiumdioksyd, og
ca. 0,75 vekt% magnesiumstearat;
hvor filmbeleggekompenten omfatter 2,0 til 6,0 vekt% Opadry®; og
hvor vekten er den totale vekten av alle intra-granulære og ekstra-granulære komponenter.
- 15 8. Oral doseringsformuleringen ifølge hvilket som helst av kravene 1-7, hvor den intragranulære komponenten omfatter ca. 75 mg, ca. 150 mg, ca. 300 mg, ca. 450 mg eller ca. 600 mg [5-(3-klorfenyl)- 3-hydroksypyridin-2-karbonyl]amino}eddiksyre.
- 20 9. Oral doseringsformulering ifølge hvilket som helst av kravene 1-8 for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av anemi omfattende administrering av formuleringen til en pasient som trenger behandling.
- 25 10. Oral doseringsformulering for anvendelse ifølge krav 9, hvor pasienten med behov for behandling er en pasient som har ikke-dialyseavhengig kronisk nyresykdom eller en pasient som gjennomgår hemodialyse.
- 30 11. Oral doseringsformulering for anvendelse ifølge krav 9, hvor den effektive mengden er en daglig dose omfattende ca. 150 mg/dag, ca.

300 mg/dag, ca. 450 mg/dag, ca. 600 mg/dag, eller ca. 750 mg/dag av forbindelsen.

5 12. Oral doseringsformulering for anvendelse ifølge krav 9 eller 11, hvor den effektive mengden er en daglig dose omfattende ca. 300 mg/dag eller ca. 450 mg/dag av forbindelsen.

10 13. Oral doseringsformulering for anvendelse ifølge krav 12, hvor den daglige dosen omfatter to eller tre tabletter på 150 mg hver av forbindelsen.