



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3318259 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/497 (2006.01)
A61K 9/20 (2006.01)
A61K 47/10 (2006.01)
A61K 47/26 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2023.04.11
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.01.11
(86)	European Application Nr.	16821324.7
(86)	European Filing Date	2016.07.01
(87)	The European Application's Publication Date	2018.05.09
(30)	Priority	2015.07.03, JP, 2015134817
(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	Astellas Pharma Inc., 5-1, Nihonbashi-Honcho 2-chome, Chuo-ku Tokyo 103-8411, Japan
(72)	Inventor	MIYAZAKI, Masakazu, c/o Astellas Pharma Inc. 5-1 Nihonbashi-Honcho 2-chome Chuo-ku, Tokyo 103-8411, Japan ISHIBA, Ryohei, c/o Astellas Pharma Inc. 5-1 Nihonbashi-Honcho 2-chome Chuo-ku, Tokyo 103-8411, Japan TAKAISHI, Yuki, c/o Astellas Pharma Inc. 5-1 Nihonbashi-Honcho 2-chome Chuo-ku, Tokyo 103-8411, Japan UEJO, Fumiaki, c/o Astellas Pharma Inc. 5-1 Nihonbashi-Honcho 2-chome Chuo-ku, Tokyo 103-8411, Japan
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54)	Title	STABLE PHARMACEUTICAL COMPOSITION FOR ORAL ADMINISTRATION
------	-------	--

(56)	References Cited:	JP-A- 2014 501 770 WO-A1-2015/119122 US-A1- 2013 273 161 EP-A1- 2 428 508 WO-A1-2010/128659 Yoshinobu Nakai: "Relationship between powder characteristics and the pharmaceutical preparations", , 2 January 2007 (2007-01-02), XP055541588, Retrieved from the Internet: URL: https://www.jstage.jst.go.jp/article/sptj1978/25/6/25_6_388/_pdf/-char/en [retrieved on 2019-01-14] YOSHINOBU NAKAI: 'Relationship between powder characteristics and the pharmaceutical preparations' JOURNAL OF THE SOCIETY OF POWDER TECHNOLOGY, JAPAN vol. 25, no. 6, 1988, ISSN 0386-6157 pages 388 - 394, XP055344928
------	-------------------	---

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.** En stabil farmasøytisk sammensetning for oral administrering omfattende 6-etyl-3-({3-metoksy-4-[4-(4-metylpiperazin-1-yl)piperidin-1-yl]fenyl}amino)-5-(tetrahydro-2H-pyran-4-ylamino)pyrazin-2-karboksamid eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori andelen av krystaller av 6-etyl-3-({3-metoksy-4-[4-(4-metylpiperazin-1-yl)piperidin-1-yl]fenyl}amino)-5-(tetrahydro-2H-pyran-4-ylamino)pyrazin-2-karboksamid eller det farmasøytisk akseptable saltet derav er 60 % eller mer i forhold til den totale mengden av 6-etyl-3-({3-metoksy-4-[4-(4-metylpiperazin-1-yl)piperidin-1-yl]fenyl}amino)-5-(tetrahydro-2H-pyran-4-ylamino)pyrazin-2-karboksamid eller det farmasøytisk akseptable saltet derav i den farmasøytiske sammensetningen.
- 2.** Farmasøytiske sammensetning ifølge krav 1, hvori innholdet av en beslektet substans av 6-etyl-3-({3-metoksy-4-[4-(4-metylpiperazin-1-yl)piperidin-1-yl]fenyl}amino)-5-(tetrahydro-2H-pyran-4-ylamino)pyrazin-2-karboksamid i den farmasøytiske sammensetningen, målt ved en HPLC-metode, er 0,20 % eller mindre, etter lagring av den farmasøytiske sammensetningen for oral administrering under åpne forhold på 40°C og 75 % relativ fuktighet i 1 måned.
- 3.** Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1 eller 2, videre omfattende et farmasøytisk tilsetningsstoff som er i stand til å kontrollere vanninnholdet i en formulering.
- 4.** Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 3, hvori det farmasøytiske tilsetningsstoffet er minst ett sukker og/eller sukkeralkohol.
- 5.** Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 4, hvori det farmasøytiske tilsetningsstoffet er laktose og/eller D-mannitol.
- 6.** Farmasøytisk sammensetning for oral administrering ifølge hvilket som helst av kravene 3 til 5, hvori innholdet av det farmasøytiske tilsetningsstoffet er 20 vekt% til 90 vekt% med hensyn til den totale vekten av den farmasøytiske sammensetningen.
- 7.** Farmasøytisk sammensetning ifølge hvilket som helst av kravene 1 eller 6, hvori den farmasøytiske sammensetningen har et tap ved tørking målt i henhold til Loss on Drying Test som definert i General Tests av The Japanese Pharmacopoeia, sekstende utgave, som er 4 % eller mindre.
- 8.** Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 6, hvori innholdet av det farmasøytiske tilsetningsstoffet er 50 vekt% til 90 vekt% med hensyn til den totale vekten av det farmasøytiske preparatet.
- 9.** Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 6, hvori innholdet av laktose og/eller D-mannitol er 50 vekt% til 70 vekt% med hensyn til den totale vekten av den farmasøytiske sammensetningen.
- 10.** Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 6, hvori innholdet av D-mannitol er 50 vekt% til 70 vekt% med hensyn til den totale vekten av den farmasøytiske sammensetningen.
- 11.** Farmasøytisk sammensetning ifølge et av kravene 1 til 10, omfattende 6-etyl-3-({3-metoksy-4-[4-(4-metylpiperazin-1-yl)piperidin-1-yl]fenyl}amino)-5-(tetrahydro-2H-pyran-4-ylamino)pyrazin-2-karboksamidhemifumarat.
- 12.** Farmasøytisk sammensetning ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 11, som er en tablett.

13. Tablett ifølge krav 12, hvori det farmasøytiske tilsetningsstoffet er laktose og/eller D-mannitol.

14. Tablett ifølge krav 12, hvori det farmasøytiske tilsetningsstoffet er D-mannitol.

15. Tablett ifølge krav 14, omfattende 6-etyl-3-({3-metoksy-4-[4-(4-metylpiperazin-1-yl)piperidin-1-yl]fenyl}amino)-5-(tetrahydro- 2H-pyran-4-ylamino)pyrazin-2-karboksamidhemifumarat.