



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3570819 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/14 (2006.01)
A61K 9/08 (2006.01)
A61K 9/16 (2006.01)
A61K 31/4152 (2006.01)
A61K 47/02 (2006.01)
A61K 47/18 (2017.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.07.12
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.03.03
(86)	European Application Nr.	17737775.1
(86)	European Filing Date	2017.07.06
(87)	The European Application's Publication Date	2019.11.27
(30)	Priority	2017.01.17, EP, 17151741
(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	Treeway TW001 B.V., Sevilaweg 142, 3047 AL Rotterdam, Nederland
(72)	Inventor	MOOLENAAR, Sytske Hyke, Sevilaweg 142, 3047 AL Rotterdam, Nederland
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54)	Title	MEDICAL TREATMENT COMPRISING ENTERAL ADMINISTRATION OF EDARAVONE
(56)	References Cited:	CN-A- 1 449 754 CN-A- 101 953 832 CN-A- 102 349 893 PARIKH ANKIT ET AL: "Development of a novel oral delivery system of edaravone for enhancing bioavailability", INTERNATIONAL JOURNAL OF PHARMACEUTICS (KIDLINGTON), vol. 515, no. 1-2, 24 October 2016 (2016-10-24), pages 490-500, XP002770642,

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/>

EP3570819

1

Patentkrav

5 **1.** Fast vanndispergerbar farmasøytisk sammensetning for anvendelse i behandlingen av en sykdom, der behandlingen omfatter dispergering av den farmasøytiske sammensetningen i en vandig væske for å fremstille en enteralt administrerbar væske som inneholder minst 0,5 gram av den farmasøytiske sammensetningen og minst 0,3 g/l edaravone, etterfulgt av enteral administrering av den enteralt administrerbare væsken til en human pasient i en mengde som tilveiebringer en dose på 30-300 mg edaravone, der den farmasøytiske sammensetningen omfatter:

- 2-50 vekt-% 3-metyl-1-fenyl-2-pyrazolin-5-on (edaravone); og
- 3-50 vekt-% vannløselig alkaliserende middel;

10 hvori edaravonen i denne farmasøytiske sammensetningen fullstendig oppløses når sammensetningen tilsettes demineralisert vann på 25 °C i en konsentrasjon ekvivalent med en edaravonekonsentrasjon på 1,4 g/l, og hvori pH-en i denne løsningen ved 25 °C er minst 0,5 pH-enheter høyere enn pH-en i en løsning som har den samme edaravonekonsentrasjonen og består utelukkende av edaravone og demineralisert vann.

20 **2.** Farmasøytisk sammensetning for anvendelse i behandlingen ifølge krav 1, hvori den farmasøytiske sammensetningen er et pulver eller en tablett.

25 **3.** Farmasøytisk sammensetning for anvendelse i behandlingen ifølge krav 1 eller 2, hvori sammensetningen i tillegg inneholder 25-95 vekt-% eksipienter valgt fra fyllstoff, desintegrant, brusemiddel, bindemiddel og kombinasjoner derav.

30 **4.** Farmasøytisk sammensetning for anvendelse i behandlingen ifølge krav 3, hvori sammensetningen inneholder minst 30 vekt-% av én eller flere polyoler valgt fra mannitol, sorbitol, xylitol, maltitol, laktitol og kombinasjoner derav.

5. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse i behandlingen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori sammensetningene i tillegg inneholder 0,5-15 vekt-% surfaktant.

EP3570819

2

6. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse i behandlingen ifølge krav 5, hvori sammensetningen inneholder minst 0,5 vekt-% ikke-ionisk surfaktant.

5 **7.** Farmasøytisk sammensetning for anvendelse i behandlingen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori minst 90 volum-% av edaravonen er til stede i formen av mikroniserte partikler som har en partikkelstørrelse på mindre enn 100 mikrometer.

10 **8.** Farmasøytisk sammensetning for anvendelse i behandlingen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori sammensetningen inneholder mindre enn 1 vekt-% vannløselig materiale.

15 **9.** Farmasøytisk sammensetning for anvendelse i behandlingen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori det vannløselige alkaliserende middelet er valgt fra oksider og hydroksider av alkaliske metaller; oksider og hydroksider av alkalijordmetaller; $\text{Al}(\text{OH})_3$; Fe_2O_3 ; salter av svake organiske og svake uorganiske syrer, alkaliske aminer; alkaliske aminosyrer; og kombinasjoner derav.

20 **10.** Farmasøytisk sammensetning for anvendelse i behandlingen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori det vannløselige alkaliserende midlet har en pKa på minst 7.

25 **11.** Farmasøytisk sammensetning for anvendelse i behandlingen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori edaravonen til stede i den enteralt administrerbare væsken ikke er inneholdt i et klatrat.

30 **12.** Farmasøytisk sammensetning for anvendelse i behandlingen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori den enteralt administrerbare sammensetningen inneholder mindre enn 3 vekt-%, foretrukket mindre enn 1 vekt-% vannløselig organisk løsemiddel valgt fra polyetylglykol, propylenglykol, dietylglykolmonoetyleter, polyoksylicinusoljer, polyoksyglyserider, polyoksyetylenorbitanfettsyreestere, vannløselige former av vitamin E og etanol.

13. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse i behandlingen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori den enteralt administrerbare væsken er en enfaset løsning.

5

14. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse i behandlingen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori 1 vektdel av den farmasøytiske sammensetningen dispergeres i 20 til 200 vektdeler av den vandige væsken.

10

15. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse i behandlingen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori den enteralt administrerbare væsken inneholder minst 500 mg/l, mer foretrukket 800-3000 mg/l edaravone.

15

16. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse i behandlingen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori sammensetningen er for anvendelse i behandlingen av nevrodegenerative sykdommer; cerebral amyloid angiopati (CAA); autoimmune sykdommer; myokardialt infarkt eller cerebrovaskulære sykdommer.