



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3725778 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

C07D 233/86 (2006.01)

A61K 9/16 (2006.01)

A61K 31/4164 (2006.01)

A61K 31/4166 (2006.01)

A61P 13/08 (2006.01)

A61P 15/00 (2006.01)

A61P 15/08 (2006.01)

A61P 15/14 (2006.01)

A61P 35/00 (2006.01)

A61P 43/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.11.08
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.08.18
(86)	European Application Nr.	20177837.0
(86)	European Filing Date	2013.09.11
(87)	The European Application's Publication Date	2020.10.21
(30)	Priority	2012.09.11, US, 201261699351 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
(73)	Proprietor	Medivation Prostate Therapeutics LLC, 235 East 42nd Street, New York, NY 10017, USA Astellas Pharma Inc., 2-5-1, Nihonbashi-Honcho Chuo-ku, Tokyo 103-8411, Japan
(72)	Inventor	LORENZ, Douglas Alan, c/o Bend Research 64550 Research Road, Bend, OR 97701, USA KONAGURTHU, Sanjay, c/o Bend Research 64550 Research Road, Bend, OR 97701, USA WALD, Randy J., c/o Bend Research 64550 Research Road, Bend, OR 97701, USA EVERETT, Jason A., c/o Bend Research 64550 Research Road, Bend, OR 97701, USA MATZ, Sheila, c/o Medivation Prostate Therapeutics LLC 525 Market Street 36th Floor, San Francisco, CA 94105, USA TAKAISHI, Yuuki, c/o Astellas Pharma Inc. 3-11 Nihonbashi-Honcho 2-chome, Chuo-Ku, Tokyo 103-8411, Japan SAKAI, Toshiro, c/o Astellas Pharma Inc. 3-11 Nihonbashi-Honcho 2-chome, Chuo- Ku, Tokyo 103-8411, Japan IRIE, Ryouyuke, c/o Astellas Pharma Inc. 3-11 Nihonbashi-Honcho 2-chome, Chuo- Ku, Tokyo 103-8411, Japan OBA, Shinsuke, c/o Astellas Pharma Inc. 3-11 Nihonbashi-Honcho 2-chome, Chuo- Ku, Tokyo 103-8411, Japan TOYOTA, Hiroyasu, c/o Astellas Pharma Inc. 3-11 Nihonbashi-Honcho 2-chome, Chuo-Ku, Tokyo 103-8411, Japan NISHIMURA, Koji, c/o Astellas Pharma Inc. 3-11 Nihonbashi-Honcho 2-chome, Chuo-Ku, Tokyo 103-8411, Japan KANBAYASHI, Atsushi, c/o Astellas Pharma Inc. 3-11 Nihonbashi-Honcho 2- chome, Chuo-Ku, Tokyo 103-8411, Japan

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

(54) Title **FORMULATIONS OF ENZALUTAMIDE**

(56) References

Cited:

WO-A2-03/063821

US-A1- 2007 004 753

Anonymous: "Prescribing Information for XTANDI", , 1 August 2012 (2012-08-01), XP055676626, Retrieved from the Internet: URL:https://www.accessdata.fda.gov/drugsatfda_docs/label/2012/203415lbl.pdf [retrieved on 2020-03-16]

DWAYNE T. FRIESEN ET AL: "Hydroxypropyl Methylcellulose Acetate Succinate-Based Spray-Dried Dispersions: An Overview", MOLECULAR PHARMACEUTICS, vol. 5, no. 6, 1 December 2008 (2008-12-01), pages 1003-1019, XP055056966, ISSN: 1543-8384, DOI: 10.1021/mp8000793

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. Fast farmasøytisk sammensetning omfattende en fast dispersjon inneholdende amorft enzalutamid og en konsentrasjonsforbedrende polymer, hvor polymeren er hydroksypropylmetylcelluloseacetatsuccinat.
2. Fast farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, hvor mengden av polymeren er 0,5 til 7 vektdeler, i forhold til 1 vektdel av enzalutamidet.
3. Fast farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, hvor mengden av polymeren er 0,5 til 3 vektdeler, i forhold til 1 vektdel av enzalutamidet.
4. Fast farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, hvor mengden av polymeren er 3 til 5 vektdeler, i forhold til 1 vektdel av enzalutamidet.
5. Fast farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, hvor mengden av polymeren er 3 vektdeler, i forhold til 1 vektdel av enzalutamidet.
6. Fast farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, hvor mengden av polymeren er 5 vektdeler, i forhold til 1 vektdel av enzalutamidet.
7. Fast farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, hvor den farmasøytiske sammensetningen er i enhetsdoseringsform som inneholder 40 til 160 mg enzalutamid per doseringsform.
8. Fast farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, hvor sammensetningen omfatter mer enn én konsentrasjonsforbedrende polymer.

9. Fast farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, hvor minst 80% av den totale mengden enzalutamid til stede er i en amorf form.
- 5 10. Fast farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, hvor den faste dispersjonen omfatter mellom 50% og 70% enzalutamid.
- 10 11. Fast farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, hvor den faste dispersjon er hovedsakelig homogen slik at fraksjonen av enzalutamid som er til stede i relativt rene amorfe domener i den faste dispersjonen er mindre enn 20 vekt% av den totale mengden enzalutamid.
12. Fast farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, hvor den faste dispersjon fremstilles ved spraytørking.
- 15 13. Fast farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, hvor den faste dispersjon fremstilles ved smelteekstrudering.
- 20 14. Fast farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, videre omfattende et fyllstoff, et bindemiddel, en desintegrator, et surt middel, et brusemiddel, et kunstig søtningsmiddel, en smak, et smøremiddel, et fargestoff, et stabiliseringsmiddel, en buffer, en antioksidant, et glidemiddel eller en blanding derav.
- 25 15. Fremgangsmåte for fremstilling av en fast farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, omfattende:
(1) fremstilling av den faste dispersjon av amorft enzalutamid og polymeren
(2) blanding og/eller granulering av den faste dispersjon, og
(3) tabletering av den faste dispersjonen.
- 30 16. Fremgangsmåte ifølge krav 15, hvor trinn (2) omfatter blanding av den faste dispersjon med ett additiv eller to eller flere tilsetningsstoffer

og granulering av blandingen, og videre omfattende et trinn med tabletering av granuler av blandingen.

17. Fast farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, som er en tablett.

5

18. Fast farmasøytisk sammensetning ifølge krav 17, hvor tablett
omfatter 45-70 vekt% av den faste dispersjonen, idet dispersjonen
omfatter 55-65 vekt% av enzalutamid og
hydroksypropylmetylcelluloseacetatsuccinat; fortrinnsvis hvor tablett
omfatter 45-55 vekt% av den faste dispersjon; eller hvor tablett
omfatter 55,3 vekt% av den faste dispersjon, idet dispersjonen
omfatter 60 vekt% av enzalutamid og
hydroksypropylmetylcelluloseacetatsuccinat.

10

19. Fast farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1 for anvendelse ved
behandling av en hyperproliferativ lidelse.

15

20. Fast farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 19,
hvor:

20

i) hyperproliferativ lidelse er valgt fra gruppen bestående av godartet
prostatahyperplasi, prostatakraft, brystkreft og eggstokkreft; eller
ii) hyperproliferativ lidelse er prostatakraft og prostatakraft er valgt fra
gruppen som består av hormonmotstandsdyktig prostatakraft og
hormonsensitiv prostatakraft.

25