



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 3797772 B1

NORWAY

(19) NO  
(51) Int Cl.  
**A61K 31/4704 (2006.01)**  
**A61K 31/573 (2006.01)**  
**A61P 1/00 (2006.01)**

**Norwegian Industrial Property Office**

---

|      |                                                                            |                                                                                                                                                                                                   |
|------|----------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| (45) | Translation Published                                                      | 2024.02.26                                                                                                                                                                                        |
| (80) | Date of The European<br>Patent Office Publication of<br>the Granted Patent | 2023.10.18                                                                                                                                                                                        |
| (86) | European Application Nr.                                                   | 19020504.7                                                                                                                                                                                        |
| (86) | European Filing Date                                                       | 2019.09.03                                                                                                                                                                                        |
| (87) | The European Application's<br>Publication Date                             | 2021.03.31                                                                                                                                                                                        |
| (84) | Designated Contracting<br>States:                                          | AL ; AT ; BE ; BG ; CH ; CY ; CZ ; DE ; DK ; EE ; ES ; FI ; FR ; GB ; GR ; HR ; HU ;<br>IE ; IS ; IT ; LI ; LT ; LU ; LV ; MC ; MK ; MT ; NL ; NO ; PL ; PT ; RO ; RS ; SE ; SI ;<br>SK ; SM ; TR |
| (73) | Proprietor                                                                 | SQUARE POWER LTD, 2nd Floor, 9 Chapel Place, London EC2A 3DQ,<br>Storbritannia                                                                                                                    |
| (74) | Agent or Attorney                                                          | ONSAGERS AS, Postboks 1813, Vika, 0123 OSLO, Norge                                                                                                                                                |

---

|      |                      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |
|------|----------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| (54) | Title                | <b>REBAMIPIDE FOR USE IN PREVENTION AND TREATMENT OF CROHN'S DISEASE</b>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         |
| (56) | References<br>Cited: | WO-A2-2005/072113<br>KR-A- 20130 106 786<br>T. MATYSIAK-BUDNIK ET AL: "Review article: rebamipide and the digestive epithelial barrier",<br>ALIMENTARY PHARMACOLOGY & THERAPEUTICS., vol. 18, no. s1, July 2003 (2003-07),<br>pages 55-62, XP055667986, GB ISSN: 0269-2813, DOI: 10.1046/j.1365-2036.18.s1.6.x<br>DAVID LAHARIE ET AL: "Effect of Rebamipide on the Colonic Barrier in Interleukin-10-Deficient<br>Mice", DIGESTIVE DISEASES AND SCIENCES, KLUWER ACADEMIC PUBLISHERS-<br>PLENUM PUBLISHERS, NE, vol. 52, no. 1, 22 December 2006 (2006-12-22), pages 84-92,<br>XP019464722, ISSN: 1573-2568<br>ENTCHO KLENSKE ET AL: "Targeting mucosal healing in Crohn's disease: what the clinician<br>needs to know", THERAPEUTIC ADVANCES IN GASTROENTEROLOGY, vol. 12, 14 June<br>2019 (2019-06-14), pages 1-11, XP055668477, UK ISSN: 1756-283X, DOI:<br>10.1177/1756284819856865<br>KISHIMOTO S ET AL: "Therapeutic effect of rebamipide and 5-aminosalicylic acid on dextran<br>sulfate sodium-induced rat colitis: Suppression of inflammatory cytokines",<br>GASTROENTEROLOGY : OFFICIAL PUBLICATION OF THE AMERICAN<br>GASTROENTEROLOGICAL ASSOCIATION, WILLIAMS & WILKINS, US, vol. 114, 15 April<br>1998 (1998-04-15), page A1010, XP027469012, ISSN: 0016-5085, DOI: 10.1016/S0016-<br>5085(98)84111-5 [retrieved on 1998-04-15] |

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.      Rebamipid for anvendelse i en fremgangsmåte for forebygging og/eller  
behandling av Crohns sykdom, der fremgangsmåten er en kombinasjonsterapi med  
5      minst ett annet legemiddel som er effektivt mot Crohns sykdom som omfatter de  
følgende trinn:
- administrere rebamipid som et tillegg til en behandling med minst ett annet  
legemiddel som er effektivt mot Crohns sykdom, og
  - minske dosen av nevnte andre legemiddel etter symptomforbedring.
- 10
2.      Rebamipid for anvendelse ifølge krav 1,  
der nevnte andre legemiddel blir avsluttet etter at pasienten når remisjon.
3.      Rebamipid for anvendelse ifølge ett av kravene 1 eller 2,  
15      der nevnte andre legemiddel er valgt fra 5-aminosalicylater, fortrinnsvis valgt fra  
sulfasalazin og mesalazin; kortikosteroider, fortrinnsvis valgt fra prednison,  
prednisolon, metylprednisolon og budesonid; immundempende midler, fortrinnsvis  
valgt fra tiopuriner, metotreksat, syklosporin og takrolimus; antibiotika, fortrinnsvis  
valgt fra metronidazol og ciprofloksasin; og antistoffer, fortrinnsvis valgt fra  
20      infliximab, adalimumab eller vedolizumab.
4.      Rebamipid for anvendelse ifølge krav 1,  
der rebamipid blir benyttet i forebygging og/eller behandling av Crohns sykdom hos  
en person som lider av økt tarmpermeabilitet eller hos en person som har risiko for  
25      økt tarmpermeabilitet.
5.      Rebamipid for anvendelse ifølge krav 4,

der personen som lider av økt tarmpermeabilitet er en person som lider av minst én tilstand som er valgt fra lavgradsinflammasjon i tarmveggen, kronisk forstoppelse eller gastroparese.

5      6.      Rebamipid for anvendelse ifølge krav 4,

der personen med risiko for økt tarmpermeabilitet er en person som lider av stress, ubalansert diett, bakterie-, virus- eller parasittinfeksjon, eller en person som er eksponert for minst ett stoff som er valgt fra ikke-steroid anti-inflammatoriske legemidler, alkohol, nikotin, matvaretilsetningsstoffer, kjemoterapeutiske midler og  
10      antibiotika.

7.      Rebamipid for anvendelse ifølge krav 4,

der personen med risiko for økt tarmpermeabilitet er en person som lider av eller er eksponert for minst én tilstand som er valgt fra stressindusert gastritt, matforgiftning, ubalanse i kolsyrer, mage-HCl- og pepsinutskilling, ikke-infeksiøs  
15      diaré, strålingsterapi, kjemoterapi, infeksøs eller post-infeksiøs svekkelse av GIT-slimhinne, dysmikrobi.

8.      Rebamipid for anvendelse ifølge ethvert av de foregående krav,

20      der rebamipid blir administrert i en oral farmasøytisk form, fortrinnsvis valgt fra tabletter, kapsler, drasjeer, granuler, mikrogranuler (sachets), orodispergerbare tabletter eller filmer, sublinguale tabletter, knuste tabletter, orale løsninger, orale suspensjoner, siruper, munnvask eller skyllemidler.

25      9.      Rebamipid for anvendelse ifølge krav 8,

der den orale farmasøytiske formen er en tablett.

10.      Rebamipid for anvendelse ifølge krav 8 eller 9,

der den orale farmasøytiske formen er en form med tarmfrigivelse, fortrinnsvis vedvarende tarmfrigivelse eller kontrollert tarmfrigivelse.

11. Rebamipid for anvendelse ifølge krav 8 eller 9,

- 5 der den farmasøytiske formen inneholder rebamipid og minst én farmasøytisk akseptabel eksipiens som er valgt fra fyllmidler, bindingsmidler, smøremidler, glidemidler, oppløsnings-/svellmidler, løseliggjørende midler, tarmfrigjøringsmidler, slimhinneadherende komponenter, midler med vedvarende frigivelse, conserveringsmidler, belegninger og fargemidler.

10

12. Rebamipid for anvendelse ifølge ethvert av de foregående krav,

der rebamipid blir administrert i en daglig dose på 1 til 5000 mg, mer foretrukket fra 50 til 2500 mg, enda mer foretrukket fra 100 til 1000 mg, og mest foretrukket fra 300 til 600 mg.

15

20