



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3866767 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/20 (2006.01)
A61K 31/5377 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2024.01.29
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.11.29
(86)	European Application Nr.	19872427.0
(86)	European Filing Date	2019.10.17
(87)	The European Application's Publication Date	2021.08.25
(30)	Priority	2018.10.18, KR, 20180124171
(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:	KH ; MA ; MD ; TN
(73)	Proprietor	Yuhan Corporation, 74 Noryangjin-ro Dongjak-gu, Seoul 06927, Sør-Korea
(72)	Inventor	KIM, Seongkyu, 102-207, 293, Sinjeong-ro Yangcheon-gu, Seoul 08078, Sør-Korea LEE, Deokkyu, 1222-402, 50, Mokdongdong-ro Yangcheon-gu, Seoul 08097, Sør- Korea KIM, Soo-Won, 902-1103, 167, Hanbora 2-ro Giheung-gu, Yongin-si Gyeonggi-do 17083, Sør-Korea YANG, Jun-Mo, 1462-1204, 122, Dongtandaerosibeom-gil, Hwaseong-si Gyeonggi- do 18476, Sør-Korea PARK, Yoong-Sik, 201-1801, 49, Daeji-ro, Suji-gu, Yongin-si Gyeonggi-do Seoul 16872, Sør-Korea
(74)	Agent or Attorney	AWA NORWAY AS, Postboks 1052 Hoff, 0218 OSLO, Norge

(54)	Title	PHARMACEUTICAL COMPOSITION FOR ORAL ADMINISTRATION COMPRISING AMINOPYRIMIDINE DERIVATIVE OR ITS SALT
------	-------	---

(56)	References Cited:	WO-A1-2017/176965, WO-A1-2018/194356, CN-A- 104 788 427, US-A1- 2008 131 505 US-A1- 2016 102 076, US-B1- 6 517 871 Anonymous: "Study Record Versions History of Changes for Study: NCT03556436 Clinical Trial to Evaluate the Safety and Effects of Ethnicity and Food on Pharmacokinetics of YH25448", , 6 September 2018 (2018-09-06), pages 1-10, XP055930152, Retrieved from the Internet: URL: https://clinicaltrials.gov/ct2/history/NCT03556436?V_2=View#StudyPageTop [retrieved on 2022-06-10]
------	----------------------	---

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. Farmasøytisk sammensetning for oral administrasjon, omfattende: N-(5-(4-(4-((dimetylamino)metyl)-3-fenyl-1H-pyrazol-1-yl)pirimidin-2-ylamino)-4-metoksy-2-morfolinofenyl)akrylamid (Lazertinib) eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav
5 som aktiv ingrediens; og en kombinasjon av mikrokrySTALLinsk cellulose og mannitol som fortynningsmiddel.
2. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, hvor vektforholdet mellom den mikrokrySTALLinske cellulose og mannitolen er i området fra 1:0,5 til 1:3.
3. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, hvor vektforholdet mellom den
10 mikrokrySTALLinske cellulose og mannitolen er i området fra 1:0,9 til 1:3.
4. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, hvor vektforholdet mellom den mikrokrySTALLinske cellulose og mannitolen er i området fra 1:0,9 til 1:1,5.
5. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, ytterligere omfattende: kroskarmellosenatrium som desintegrasjonsmiddel.
- 15 6. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 5, hvor kroskarmellosenatriumet foreligger i et område fra 2 til 5 vekt%, i forhold til den samlede vekt av sammensetningen.
7. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, ytterligere omfattende: magnesiumstearat som smøremiddel.
- 20 8. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, omfattende: N-(5-(4-(4-((dimetylamino)metyl)-3-fenyl-1H-pyrazol-1-yl)pirimidin-2-ylamino)-4-metoksy-2-morfolinofenyl)akrylamid eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav som aktiv ingrediens; en kombinasjon av mikrokrySTALLinsk cellulose og mannitol som fortynningsmiddel; kroskarmellosenatrium som desintegrasjonsmiddel; og
25 magnesiumstearat som smøremiddel.
9. Farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8, hvor den aktive ingrediens er N-(5-(4-(4-((dimetylamino)metyl)-3-fenyl-1H-pyrazol-1-yl)pirimidin-2-ylamino)-4-metoksy-2-morfolinofenyl)akrylamidmesylat.

10. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, hvor den farmasøytiske sammensetning består av 5 til 54 vekt% N-(5-(4-(4-((dimetylamino)metyl)-3-fenyl-1H-pyrazol-1-yl)pirimidin-2-ylamino)-4-metoksy-2-morfolinofenyl)-akrylamidmesylat; 45 til 87 vekt% av kombinasjonen av mikrokrySTALLinsk cellulose og mannitol; 0,5 til 10 vekt% kroskarmellosenatrium; og 0,4 til 2 vekt% magnesiumstearat.

11. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, hvor den farmasøytiske sammensetning består av 7 til 46 vekt% N-(5-(4-(4-((dimetylamino)metyl)-3-fenyl-1H-pyrazol-1-yl)pirimidin-2-ylamino)-4-metoksy-2-morfolinofenyl)-akrylamidmesylat; 50 til 87 vekt% av kombinasjonen av mikrokrySTALLinsk cellulose og mannitol; 2 til 5 vekt% kroskarmellosenatrium; og 0,5 til 1,5 vekt% magnesiumstearat.

12. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 9, hvor nevnte N-(5-(4-(4-((dimetylamino)metyl)-3-fenyl-1H-pyrazol-1-yl)pirimidin-2-ylamino)-4-metoksy-2-morfolinofenyl)akrylamidmesylat er en krystallinsk form som har et PXRD-mønster med toppe ved 5,614, 12,394, 14,086, 17,143, 18,020, 19,104, 21,585, 22,131 og 22,487°2θ ± 0,2°2θ.

13. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 9, hvor nevnte N-(5-(4-(4-((dimetylamino)metyl)-3-fenyl-1H-pyrazol-1-yl)pirimidin-2-ylamino)-4-metoksy-2-morfolinofenyl)akrylamidmesylat er en krystallinsk form som har et differensialskanningkalorimeter (DSC) termogram med en endoterm topp ved 210 til 230°C.

14. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 13, hvor nevnte N-(5-(4-(4-((dimetylamino)metyl)-3-fenyl-1H-pyrazol-1-yl)pirimidin-2-ylamino)-4-metoksy-2-morfolinofenyl)akrylamidmesylat er en krystallinsk form som har et differensialskanningkalorimeter (DSC) termogram med en endoterm topp ved 217±2°C.