



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3875085 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

A61K 9/10 (2006.01)

A61K 47/38 (2006.01)

A61K 31/4152 (2006.01)

A61P 21/02 (2006.01)

A61K 47/32 (2006.01)

A61P 25/28 (2006.01)

A61K 47/36 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2024.08.26
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2024.06.19
(86)	European Application Nr.	19880770.3
(86)	European Filing Date	2019.11.01
(87)	The European Application's Publication Date	2021.09.08
(30)	Priority	2018.11.02, JP, 2018207646
(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	Mitsubishi Tanabe Pharma Corporation, 3-2-10, Dosho-machi, Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka 541-8505, Japan
(72)	Inventor	HAYAMA, Tetsuo, c/o Mitsubishi Tanabe Pharma Corporation, 3-2-10, Dosho-machi, Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka 541-8505, Japan TAKAHASHI, Tomohiro, c/o Mitsubishi Tanabe Pharma Corporation, 3-2-10, Dosho-machi, Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka 541-8505, Japan OMURA, Tomoyuki, c/o Mitsubishi Tanabe Pharma Corporation, 3-2-10, Dosho-machi, Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka 541-8505, Japan HAYASHI, Kouji, c/o Mitsubishi Tanabe Pharma Corporation, 3-2-10, Dosho-machi, Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka 541-8505, Japan MATSUDA, Munetomo, c/o Mitsubishi Tanabe Pharma Corporation, 3-2-10, Dosho-machi, Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka 541-8505, Japan MIYAZAWA, Tadashi, c/o Mitsubishi Tanabe Pharma Corporation, 3-2-10, Dosho-machi, Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka 541-8505, Japan
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54) Title **EDARAVONE SUSPENSION FOR ORAL ADMINISTRATION**

(56) References

Cited:

CN-A- 105 816 423, JP-A- 2004 091 441, JP-A- 2012 056 950, WO-A1-2018/133957, WO-A1-2021/009775, JP-A- H1 129 463, JP-A- 2014 177 415
PARIKH, ANKIT ET AL.: "Development of a novel oral delivery system of edaravone for enhancing bioavailability", INTERNATIONAL JOURNAL OF PHARMACEUTICS, vol. 515, no. 1, 2016, pages 490 - 500, XP002770642, DOI: 10.1016/j.ijpharm.2016.10.052
PARIKH, ANKIT ET AL.: "Lipid-based nanosystem of edaravone: development, optimization, characterization and in vitro/in vivo evaluation", D RUG DELIV, vol. 24, no. 1, 2017, pages 962 - 978, XP55703974
LI, HAO ET AL.: "Phase I clinical study of edaravone in healthy Chinese volunteers", DRUGS R D, vol. 12, no. 2, 2012, pages 65 - 70, XP55703976

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. Edaravon-suspensjon for oral administrering til mennesker, omfattende:
 - edaravon-partikler;
 - et dispergeringsmiddel; og
 - 5 vann;hvor dispergeringsmiddelet er ett eller flere valgt fra polyvinylalkohol, metylcellulose, hypromellose, sukrosefettsyreester og polysorbat.
2. Suspensjon ifølge krav 1, hvor dispergeringsmiddelet er et dispergeringsmiddel som fremviser en
10 transmisjons-spredningslysintensitet på 1% eller mer, målt i samsvar med metoden i beskrivelsen.
3. Suspensjon ifølge krav 1, hvor dispergeringsmiddelet er et dispergeringsmiddel som fremviser en kontaktvinkel på 80 grader eller mindre, målt i samsvar med metoden i beskrivelsen.
- 15 4. Suspensjon ifølge krav 1, hvor dispergeringsmiddelet er ett eller to valgt fra polyvinylalkohol og metylcellulose.
5. Suspensjon ifølge krav 1 eller 4, hvor dispergeringsmiddelet er polyvinylalkohol.
- 20 6. Suspensjon ifølge et hvilket som helst av kravene 1-5, hvor en blandingsmengde av dispergeringsmiddelet er 0,001% (vekt/volum) - 1,0% (vekt/volum).
7. Suspensjon ifølge et hvilket som helst av kravene 1-6, videre omfattende et tykningsmiddel.
- 25 8. Suspensjon ifølge krav 7, hvor tykningsmiddelet er ett eller to valgt fra xantangummi og tragantpulver.
9. Suspensjon ifølge krav 7 eller 8, hvor tykningsmiddelet er xantangummi.
- 30 10. Suspensjon ifølge et hvilket som helst av kravene 7-9, hvor en blandingsmengde av tykningsmiddelet er 0,1% (vekt/volum) - 1,2% (vekt/volum).
11. Suspensjon ifølge et hvilket som helst av kravene 1 - 10, hvor edaravon-partiklene i suspensjonen har en volumbasert D50-partikkelstørrelse på 10 µm - 100 µm og en volumbasert D90-

3875085

2

partikkelstørrelse på 50 µm - 300 µm, målt med bruk av en laserdiffraksjon-partikkelstørrelsesfordelingsanordning.

- 5 12. Suspensjon ifølge et hvilket som helst av kravene 1 - 11, hvor en blandingsmengde av edaravon-partiklene er 0,06% (vekt/volum) - 36% (vekt/volum).
13. Suspensjon ifølge krav 12, hvor en blandingsmengde av edaravon-partiklene er 0,5% (vekt/volum) - 36% (vekt/volum).
- 10 14. Suspensjon ifølge et hvilket som helst av kravene 1 - 13, videre omfattende ett eller flere additiver valgt fra et søtningsmiddel, en stabilisator og en pH-regulator.
- 15 15. Suspensjon ifølge et hvilket som helst av kravene 1-14 med en densitet på 1 g/mL - 1,5 g/mL.
- 15 16. Suspensjon ifølge et hvilket som helst av kravene 1 - 15 hvor, når en oppløsningstest, testløsning: første løsning; og paddle-rotasjonshastighet: 50 rpm, utføres i samsvar med den japanske farmakopé, en edaravon-oppløsningsrate 30 minutter etter oppstart av testen er 80% eller mer.
- 20 17. Sett for fremstilling av edaravon-suspensjonen for oral administrering til mennesker ifølge et hvilket som helst av kravene 1 - 15, omfattende:
- (A) en fast sammensetning som inneholder edaravon-partikler; og
 - (B) en dispergeringsmiddelløsning.