



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3892302 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

A61K 47/02 (2006.01)

A61K 47/12 (2006.01)

A61K 9/10 (2006.01)

A61K 47/38 (2006.01)

A61K 9/48 (2006.01)

A61P 35/00 (2006.01)

A61K 31/519 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2023.12.11
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.09.06
(86)	European Application Nr.	21161828.5
(86)	European Filing Date	2016.04.06
(87)	The European Application's Publication Date	2021.10.13
(30)	Priority	2015.04.06, US, 201562143659 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
	Designated Validation States:	MA; MD
(73)	Proprietor	Janssen Pharmaceutica NV, Turnhoutseweg 30, 2340 Beerse, Belgium
(72)	Inventor	GOLE, Dilip, c/o Janssen Research&Development 1000 US Route 202, Raritan, NJ New Jersey 08869, USA GUPTA, Manish Kumar, c/o Janssen Pharmaceutica Company Higi House Opp. Ralli Wolf LBS Marg, Mullund West, 400080 Mumbai Maharashtra, India TAMBWEKAR, Kaustubh, c/o Janssen Pharmaceutica NV Turnhoutseweg 30, B-2340 Beerse, Belgium NAIR, Binuraj Krishnan, c/o Janssen Pharmaceutica Company Higi House Opp. Ralli Wolf LBS Marg, Mullund West, 400080 Mumbai Maharashtra, India BERNINI, Maristella, c/o Janssen Pharmaceutica NV Turnhoutseweg 30, B-2340 Beerse, Belgium INGHELBRECHT, Sabine, c/o Janssen Pharmaceutica NV Turnhoutseweg 30, B-2340 Beerse, Belgium
(74)	Agent or Attorney	AWA NORWAY AS, Postboks 1052 Hoff, 0218 OSLO, Norge

(54) Title **COMPOSITIONS CONTAINING IBRUTINIB**

(56) References

Cited:

WO-A1-2013/184572

US-A1- 2014 303 191

WO-A1-2014/004707

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 omfattende:
 - (a) 30 til 80 mg/mL Ibrutinib;
 - (b) 12 til 15 mg/mL mikrokristallinsk cellulose og karboksymetylcellulose-natrium;
 - (c) 0,5 til 3 mg/mL hydroksypropylmetylcellulose;
 - (d) 1,4 til 1,7 mg/mL sitronsyremonohydrat;
 - (e) 1,4 mg/mL dinatriumhydrogenfosfat;
 - (f) 0,5 til 1,5 mg/mL sukralose;
 - (g) 1 til 1,5 mg/mL natriummetylparahydroksybenzoat;
 - (h) 0,5 til 0,7 mg/mL natriumetylparahydroksybenzoat;
 - (i) konsentrert saltsyre;
 - (j) natriumhydroksid; og
 - (k) vann.
2. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, omfattende 30 til 50 mg/mL Ibrutinib, eller fortrinnsvis 60 til 80 mg/mL Ibrutinib.
3. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1 eller 2, omfattende 13 til 15 mg/mL mikrokristallinsk cellulose og karboksymetylcellulosenatrium, eller fortrinnsvis 12 til 14 mg/mL mikrokristallinsk cellulose og karboksymetylcellulose-natrium.
4. Farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av de forutgående krav, omfattende 2 til 3 mg/mL hydroksypropylmetylcellulose, eller fortrinnsvis 0,5 til 1,5 mg/mL hydroksypropylmetylcellulose.
5. Farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av de forutgående krav, omfattende en tilstrekkelig mengde konsentrert saltsyre eller natriumhydroksid for å holde pH-verdien rundt 6.
6. Farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av de forutgående krav, omfattende en tilstrekkelig mengde vann for å sikre et samlet volum på 1 mL.
7. Farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av de forutgående krav, som er en flytende suspensjon.

8. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, omfattende:

- (i) ca. 70 mg/mL Ibrutinib;
- (ii) ca. 13 mg/mL mikrokristallinsk cellulose og karboksymetylcellulose-natrium;
- 5 (iii) ca. 2,5 mg/mL hydroksypropylmetylcellulose;
- (iv) ca. 1,5 mg/mL sitronsyremonohydrat;
- (v) ca. 1,4 mg/mL dinatriumhydrogenfosfat;
- (vi) ca. 1 mg/mL sukralose;
- (vii) ca. 1 mg/mL natriummetylparahydroksybenzoat; og
- 10 (viii) ca. 0,6 mg/mL natriumetylparahydroksybenzoat.

9. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, omfattende:

- (i) ca. 40 mg/mL Ibrutinib;
- (ii) ca. 14 mg/mL mikrokristallinsk cellulose og karboksymetylcellulose-natrium;
- 15 (iii) ca. 1 mg/mL hydroksypropylmetylcellulose;
- (iv) ca. 1,6 mg/mL sitronsyremonohydrat;
- (v) ca. 1,4 mg/mL dinatriumhydrogenfosfat;
- (vi) ca. 0,5 mg/mL sukralose;
- (vii) ca. 1,4 mg/mL natriummetylparahydroksybenzoat; og
- 20 (viii) ca. 0,7 mg/mL natriumetylparahydroksybenzoat.

10. Farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av de forutgående krav for anvendelse i en fremgangsmåte ved behandling av en B-celle-proliferativ forstyrrelse.

11. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 10, hvor nevnte B-celle-proliferative forstyrrelse er et non-Hodgkin-lymfom, Waldenstrom-makroglobulinemi, plasmacellemyelom eller kronisk lymfatisk leukemi, valgfritt hvor non-Hodgkin-lymfomet er diffust storcellet B-celle-lymfom, follikulært lymfom, mantelcellelymfom eller burkittlymfom, fortrinnsvis et lymfom, eller fortrinns leukemi.

12. Farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 9 for anvendelse i en fremgangsmåte ved behandling av mantelcellelymfom i et

individ som allerede har mottatt minst én tidligere terapi mot mantelcellelymfom, omfattende å administrere den farmasøytiske sammensetning én gang daglig.

13. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 10 til 12, hvor den farmasøytiske sammensetning blandes i maten så som myk mat.

14. Fremgangsmåte ved fremstilling av en sammensetning ifølge krav 1, hvor nevnte fremgangsmåte omfatter å:

- (a) blande vann, mikrokristallinsk cellulose kroskarmellosenatrium;
- (b) blande vann og med hydroksypropylmetylcellulose;
- 10 (c) blande produktet fra trinn (b) med Ibrutinib;
- (d) blande produktet fra trinn (a) og (c);
- (e) blande produktet fra trinn (d) med sukralose;
- (f) blande produktet fra trinn (e) med natriummetylparahydroksybenzoat og natriumetylparahydroksybenzoat;
- 15 (g) blande produktet fra trinn (f) med monohydratsitronsyre; og
- (h) blande produktet fra trinn (g) med vannfritt dinatriumhydrogenfosfat.