



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 4233850 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/48 (2006.01)
A61K 31/451 (2006.01)
A61K 47/10 (2017.01)
A61K 47/14 (2017.01)
A61K 47/40 (2006.01)
A61K 47/44 (2017.01)
A61P 29/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2025.02.10
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2024.10.02
(86)	European Application Nr.	23160271.5
(86)	European Filing Date	2019.11.27
(87)	The European Application's Publication Date	2023.08.30
(30)	Priority	2018.11.30, US, 201862773848 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	KH ; MA ; MD ; TN
(62)	Divided application	EP3886820, 2019.11.27
(73)	Proprietor	ChemoCentryx, Inc., One Amgen Center Drive, Thousand Oaks, CA 91320, USA
(72)	Inventor	LELETI, Manmohan Reddy, California, 94568, USA POWERS, Jay P, California, 94044, USA
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54)	Title	CAPSULE FORMULATIONS
(56)	References Cited:	US-A1- 2018 179 160 PIROW BEKKER ET AL: "Characterization of Pharmacologic and Pharmacokinetic Properties of CCX168, a Potent and Selective Orally Administered Complement 5a Receptor Inhibitor, Based on Preclinical Evaluation and Randomized Phase 1 Clinical Study", PLOS ONE, vol. 11, no. 10, 21 October 2016 (2016-10-21), pages e0164646, XP055602780, DOI: 10.1371/journal.pone.0164646

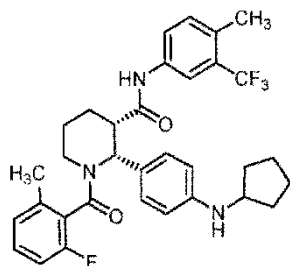
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters 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/>

4233850

1

Patentkrav

1. Fast løsningskapselformulering omfattende Forbindelse 1 som en fri base i sin nøytrale form



(Compound 1)

- 5 og et vehikkel som omfatter
- i det minste ett ikke-ionisk tensid valgt fra gruppen bestående av polyoksyetylen-40-ricinusolje, makrogol-40-glyserolhydroksystearat, makrogolglyserolricinoleat, makrogol-15-hydroksystearat, polyoksyetylen-60-ricinusolje, polyoksyetylen-60-hydrert ricinusolje, polyoksyetylen-100-hydrert ricinusolje, polyoksyetylen-200-ricinusolje og polyoksyetylen-200-hydrert ricinusolje, og
- 10 i det minste én vannløselig løselighetsformidler valgt fra gruppen bestående av PEG-1000, PEG-1500, PEG-1540, PEG-2000, PEG-3000, PEG-3350, PEG-4000, PEG-6000, PEG-8000, PEG-10000, PEG-20000, poloksamer 188, poloksamer 237, poloksamer 338 og poloksamer 407.
- 15

2. Fast løsningskapselformulering ifølge krav 1,

- (a) hvor vehikkelet omfatter cirka 97 til 99 vekt-% av den samlede fyllvekt av nevnte faste løsningskapselformulering; og/eller
- 20 (b) omfattende cirka 1 til 3 vekt-% av Forbindelse 1 av den samlede fyllvekt av nevnte faste løsningskapselformulering.

3. Fast løsningskapselformulering ifølge krav 2,

- (a) hvor vehikkelet omfatter cirka 98 vekt-% av den samlede fyllvekt av nevnte faste løsningskapsel; og/eller
- 25 (b) omfattende cirka 2 vekt-% av Forbindelse 1 av den samlede fyllvekt av nevnte faste løsningskapselformulering.

4233850

2

4. Fast løsningskapsel-formulering ifølge et hvilket som helst av kravene **1** til **3**, hvor:

- (a) den samlede vekt av vehikkelet omfatter et forhold på 30:70 til 65:35 av i det minste ett ikke-ionisk tensid til i det minste én vannløselig løselighetsformidler; eller
- 5 (b) den samlede vekt av vehikkelet omfatter et forhold på 35:65 til 65:35 av i det minste ett ikke-ionisk tensid til i det minste én vannløselig løselighetsformidler; eller
- (c) den samlede vekt av vehikkelet omfatter et forhold på 40:60 til 60:40 av i det minste ett ikke-ionisk tensid til i det minste én vannløselig
- 10 løselighetsformidler; eller
- (d) den samlede vekt av vehikkelet omfatter et forhold på 45:55 til 55:45 av i det minste ett ikke-ionisk tensid til i det minste én vannløselig løselighetsformidler, eller
- (e) den samlede vekt av vehikkelet omfatter et forhold på cirka 50:50 av i det
- 15 minste ett ikke-ionisk tensid til i det minste én vannløselig løselighetsformidler.

5. Fast løsningskapsel-formulering ifølge et hvilket som helst av kravene **1** to **4**, hvor det i det minste ene ikke-ioniske tensid er makrogol-40-glyserolhydroksystearat eller makrogolglyserolricinoleat.

20

6. Fast løsningskapsel-formulering ifølge krav 5, hvor det i det minste ene ikke-ioniske tensid er makrogol-40-glyserolhydroksystearat.

25 **7.** Fast løsningskapsel-formulering ifølge et hvilket som helst av kravene **1** to **6**, hvor den i det minste ene vannløselige løselighetsformidler velges fra gruppen bestående av PEG-1540, PEG-2000, PEG-3000, PEG-3350, PEG-4000, PEG-6000.

30 **8.** Fast løsningskapsel-formulering ifølge krav 7, hvor den i det minste ene vannløselige løselighetsformidler er PEG-4000.

4233850

3

9. Fast løsningskapselformulering ifølge et hvilket som helst av kravene **1** til **8**, hvor:

- 5 (a) den samlede fyllvekt av nevnte faste løsningskapsel er fra cirka 130 mg til 900 mg, fortrinnsvis hvor den samlede fyllvekt av nevnte faste løsningskapsel er cirka 500 mg; og/eller
- (b) kapselstørrelsen velges fra gruppen bestående av #00, #0, #1, #2, #3, #4 eller #5, fortrinnsvis hvor kapselstørrelsen er #0; og/eller
- (c) kapselen er en hard kapsel.

10 **10.** Fast løsningskapselformulering som definert i et hvilket som helst av kravene **1** til **9** for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av et individ som lider av eller er utsatt for en sykdom eller lidelse som involverer patologisk aktivering av C5a-reseptorer, idet fremgangsmåten omfatter å administrere til individet en virksom mengde av den faste løsningskapselformulering.

15

11. Fast løsningskapselformulering for anvendelse ifølge krav **10**, hvor sykdommen eller lidelsen er en inflammatorisk sykdom eller lidelse.

20 **12.** Fast løsningskapselformulering for anvendelse ifølge krav **11**, hvor sykdommen eller lidelsen velges fra gruppen bestående av nøytropeni, sepsis, septisk sjokk, Alzheimers sykdom, multippel sklerose, slag, inflammatorisk tarmsykdom, aldersrelatert makuladegenerasjon, kronisk obstruktiv lungesykdom, inflammasjon assosiert med forbrenninger, lungeskade, osteoartritt, atopisk dermatitt, kronisk urticaria, iskemi-reperfusjonsskade, akutt lungesviktsyndrom, systemisk

25 inflammatorisk responssyndrom, multiorgansvikt, avstøtning av vevstransplantat, kreft og hyperakutt avstøtning av transplanterte organer.

13. Fast løsningskapselformulering for anvendelse ifølge krav **10**, hvor sykdommen eller lidelsen er en kardiovaskulær eller cerebrovaskulær lidelse.

30

14. Fast løsningskapselformulering for anvendelse ifølge krav **13**, hvor sykdommen eller lidelsen velges fra gruppen bestående av myokardinfarkt, koronartrombose,

4233850

4

vaskulær okklusjon, postoperativ vaskulær reokklusjon, arteriosklerose, traumatisk skade i sentralnervesystemet og iskemisk hjertesykdom.

5 **15.** Fast løsningskapselformulering for anvendelse ifølge krav **10**, hvor sykdommen eller lidelsen er en autoimmun lidelse.

10 **16.** Fast løsningskapselformulering ifølge krav **15**, hvor sykdommen eller lidelsen velges fra gruppen bestående av revmatoid artritt, C3-glomerulopati (C3G), hidradenitis suppurativa (HS), systemisk lupus erythematosus, Guillain-Barrés syndrom, pankreatitt, lupusnefritt, lupus glomerulonefritt, psoriasis, immunglobulin A-nefropati (IgA-nefropati), Crohns sykdom, vaskulitt, irritabel tarm-sykdom, dermatomyositt, multippel sklerose, bronkial astma, pemfigus, pemfigoid, skleroderma, myasthenia gravis, autoimmune hemolytiske og trombocytopeniske tilstander, Goodpastures syndrom, immunvaskulitt, avstøtning av vevstransplantat
15 og hyperakutt avstøtning av transplanterte organer.

17. Fast løsningskapselformulering for anvendelse ifølge krav **10**, hvor sykdommen eller lidelsen er:

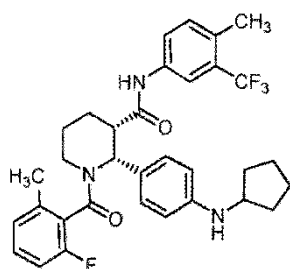
- 20 (a) en patologisk følgesykdom assosiert med gruppen bestående av insulinavhengig diabetes mellitus, lupus-nefropati, Heyman-nefritt, membranøs nefritt, glomerulonefritt, kontaktsensitivitetsreaksjoner og inflammasjon som oppstår fra kontakt av blod med kunstige overflater; eller
(b) valgt fra gruppen bestående av ANCA-vaskulitt (anti-nøytrofile cytoplasmatiske antistoffer), C3-glomerulopati, hidradenitis suppurativa og
25 lupusnefritt; eller
(c) ANCA-vaskulitt (anti-nøytrofile cytoplasmiske antistoffer); eller
(d) C3-glomerulopati; eller
(d) hidradenitis suppurativa; eller
(e) lupusnefritt.

30

18. Enkelt enhetsdosekapsel omfattende cirka 2,6 mg til 25,2 mg av Forbindelse 1 som en fri base i sin nøytrale form

4233850

5



(Compound 1)

og et vehikkel omfattende

makrogol-40-glyserolhydroksystearat, og

PEG-4000

- 5 hvor den samlede vekt av vehikkelet omfatter et forhold på cirka 50:50 av makrogol-40-glyserolhydroksystearat til PEG-4000.

19. Enkelt enhetsdosekapsel ifølge krav **18**, omfattende cirka 2,6 mg til 18 mg av Forbindelse 1 som en fri base i sin nøytrale form.

10

20. Enkelt enhetsdosekapsel ifølge krav **19**, omfattende cirka 10 mg av Forbindelse 1 som en fri base i sin nøytrale form.

21. Enkelt enhetsdosekapsel ifølge et hvilket som helst av kravene **18** til **20**, hvor
15 den samlede fyllvekt av nevnte faste løsningskapsel er fra cirka 130 mg til 900 mg.

22. Kit som omfatter én eller flere faste løsningskapselformuleringer ifølge et hvilket som helst av kravene **1** til **9**, eller én eller flere enkelte doseenheter ifølge et hvilket som helst av kravene **18** til **21**.