



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2139494 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/70 (2006.01)
A61K 9/16 (2006.01)
A61K 9/20 (2006.01)
A61P 3/10 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2020.07.13
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.03.11
(86)	European Application Nr.	08732695.5
(86)	European Filing Date	2008.03.21
(87)	The European Application's Publication Date	2010.01.06
(30)	Priority	2007.03.22, US, 896286 P
(84)	Designated Contracting States:	AT ; BE ; BG ; CH ; CY ; CZ ; DE ; DK ; EE ; ES ; FI ; FR ; GB ; GR ; HR ; HU ; IE ; IS ; IT ; LI ; LT ; LU ; LV ; MC ; MT ; NL ; NO ; PL ; PT ; RO ; SE ; SI ; SK ; TR
	Designated Extension States:	AL ; BA ; MK ; RS
(73)	Proprietor	AstraZeneca AB, 151 85 Södertälje, Sverige
(72)	Inventor	BINDRA, Dilbir, S., 1 Squibb Drive, New Brunswick, NJ 08903, USA DALI, Mandar, V., 1 Squibb Drive, New Brunswick, NJ 08903, USA PARAB, Prakash, V., 1 Squibb Drive, New Brunswick, NJ 08903, USA PATEL, Jatin, M., 1 Squibb Drive, New Brunswick, NJ 08903, USA TAO, Li, 1 Squibb Drive, New Brunswick, NJ 08903, USA TEJWANI, Ravindra, W., 1 Squibb Drive, New Brunswick, NJ 08903, USA VATSARAJ, Nipa, 1 Squibb Drive, New Brunswick, NJ 08903, USA WU, Yongmei, 1 Squibb Drive, New Brunswick, NJ 08903, USA
(74)	Agent or Attorney	TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

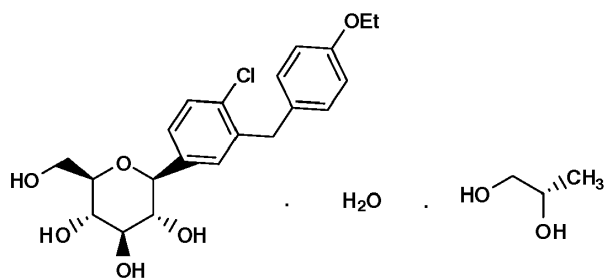
(54)	Title	PHARMACEUTICAL FORMULATIONS CONTAINING DAPAGLIFLOZIN PROPYLENE GLYCOL HYDRATE
(56)	References Cited:	WO-A-03/099836 WO-A-2008/002824 MENG WEI ET AL: "Discovery of dapagliflozin: A potent, selective renal sodium-dependent glucose cotransporter 2 (SGLT2) inhibitor for the treatment of type 2 diabetes" JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, vol. 51, no. 5, March 2008 (2008-03), pages 1145-1149, XP002491733 ISSN: 0022-2623

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. En direkte frigivelse farmasøytisk formulering i form av en stamgranulasjon for føring i kapsler eller forming av tabletter, eller i formen av en kapsel eller en tablett som inneholder stamgranulasjonen, hvor stamgranulasjonen omfatter:

a) dapagliflozin-propylenglykolhydrat som har formelen



b) ett eller flere bulkmidler;

c) ett eller flere bindemidler

d) ett eller flere desintegreringsmidler;

e) eventuelt ett eller flere glidemidler og/eller anti-adherents; og

f) eventuelt ett eller flere smøremidler.

2. Formulering som definert i krav 1, hvor

a) nevnte dapagliflozin-propylenglykolhydrat er tilstede i en mengde innenfor området fra 0,1 til 70 vekt% av stamgranulasjon eller av tablett- eller kapselfylling;

b) bulkmidlet er til stede i en mengde innenfor området fra 1 til 95 vekt% av stamgranulasjonen eller av tablett- eller kapselfylling;

c) bindemidlet er tilstede i en mengde av opptil 20 vekt% av stamgranulasjon eller av tablett- eller kapselfylling;

d) desintegreringsmidlet er til stede i en mengde av opptil 20 vekt% av stamgranulasjon eller av tablett- eller kapselfylling;

e) glidemiddelet og/eller nevnte anti-adherent, hvis til stede, er til stede i en mengde innenfor området fra 0 til 20 vekt% av stamgranulasjon eller av tablett- eller kapselfylling; og

f) smøremidlet, hvis til stede, er til stede i en mengde innenfor området fra 0 til 5 vekt% tablett av stamgranulasjon eller av tablett- eller kapselfylling.

3. Formulering ifølge krav 1, hvor bulkmidlet er mikrokrySTALLinsk cellulose og/eller laktosemonohydrat, bindemidlet er pre-gelatinert stivelse, desintegreringsmidlet er natriumstivelsesglykolat, crospovidon og/eller croscarmellose-natrium, glidemidlet og/eller anti-adherent er silisiumdioksid og/eller talkum, og smøremidlet er magnesiumstearat.

4. Formulering ifølge krav 1, i formen av en kapsel som er fylt med stamgranulasjonen, hvor kapselen inneholder en mengde av nevnte dapagliflozin-propylenglykolhydrat som er ekvivalent med 2,5 mg eller 10 mg dapagliflozin, hvor stamgranulasjonen omfatter:

a) dapagliflozin-propylenglykolhydrat, hvor nevnte dapagliflozin-propylenglykolhydrat er tilstede i en mengde på 10,0 vekt% av kapselfylling;

b) mikrokrySTALLinsk cellulose, hvor den mikrokrySTALLinske cellulosen er til stede i en mengde på 68,75 vekt% av kapselfylling;

c) pre-gelatinert stivelse, hvor den pre-gelatinerte stivelsen er til stede i en mengde på 15,0 vekt% av kapselfylling;

d) natriumstivelsesglykolat, hvor nevnte natriumstivelsesglykolat er til stede i en mengde på 3,0 vekt% av kapselfylling;

e) silisiumdioksid, hvor silisiumdioksidet er til stede i en mengde på 2,0 vekt% av kapselfylling; og

f) magnesiumstearat, hvor magnesiumstearatet er til stede i en mengde på 1,25 vekt% av kapselfylling.

5. Formulering som definert i krav 1, i formen av en kapsel som er fylt med stamgranulasjonen, hvor kapselen inneholder en mengde av nevnte dapagliflozin-propylenglykolhydrat som er ekvivalent med 100 mg dapagliflozin, hvor stamgranulasjonen omfatter:

a) dapagliflozin-propylenglykolhydrat, hvor nevnte dapagliflozin-propylenglykolhydrat er til stede i en mengde på 22,8 vekt% av kapselfylling;

b) mikrokrySTALLinsk cellulose, hvor den mikrokrySTALLinske cellulosen er til stede i en mengde på 55,95 vekt% av kapselfylling;

5 c) pre-gelatinert stivelse, hvor den pre-gelatinerte stivelsen er til stede i en mengde på 15 vekt% av kapselfylling;

d) natriumstivelsesglykolat, hvor nevnte natriumstivelsesglykolat er til stede i en mengde på 3,0 vekt% av kapselfylling;

10 e) silisiumdioksid, hvor silisiumdioksidet er til stede i en mengde på 2,0 vekt% av kapselfylling; og

f) magnesiumstearat, hvor magnesiumstearatet er til stede i en mengde på 1,25 vekt% av kapselfylling.

6. Formulering som definert i krav 1 i formen av en tablett omfattende:

15 a) dapagliflozin-propylenglykolhydrat i en mengde på 3,08 mg;

b) mikrokrySTALLinsk cellulose, hvor den mikrokrySTALLinske cellulose er til stede i en mengde på 67,11 mg;

c) vannfri laktose, hvor den vannfrie laktosen er til stede i en mengde på 25,00 mg;

20 d) crospovidon, hvor nevnte crospovidon er til stede i en mengde på 8,75 mg; og croscarmellosenatrium, hvor nevnte croscarmellosenatrium er til stede i en mengde på 3,75 mg;

e) talkum, hvor nevnte talkum er til stede i en mengde på 12,5 mg; og silisiumdioksid, hvor silisiumdioksidet er til stede i en mengde på 2,88 mg; og

25 f) magnesiumstearat, hvor magnesiumstearatet er til stede i en mengde på 1,94 mg.

7. Formulering som definert i krav 1 i formen av en tablett omfattende:

- a) nevnte dapagliflozin-propylenglykolhydrat i en mengde på 12,30 mg;
- b) mikrokrySTALLinsk cellulose, hvor den mikrokrySTALLinske cellulosen er til stede i en mengde på 57,89 mg;
- c) vannfri laktose, hvor den vannfrie laktosen er til stede i en mengde på 25,00 mg;
- d) crospovidon, hvor nevnte crospovidon er til stede i en mengde på 8,75 mg; og croscarmellosenatrium, hvor nevnte croscarmellosenatrium er tilstede i en mengde på 3,75 mg;
- e) talkum, hvor nevnte talkum er til stede i en mengde på 12,50 mg; og silisiumdioksid, hvor silisiumdioksidet er til stede i en mengde på 2,88 mg; og
- f) magnesiumstearat, hvor magnesiumstearatet er til stede i en mengde på 1,94 mg.

8. Formulering som definert i krav 1 i formen av en tablett omfattende:

- a) dapagliflozin-propylenglykolhydrat, hvor nevnte dapagliflozin-propylenglykolhydrat er til stede i en mengde på 61,66 mg;
- b) mikrokrySTALLinsk cellulose, hvor den mikrokrySTALLinske cellulosen er til stede i en mengde på 114,09 mg;
- c) vannfri laktose, hvor den vannfrie laktosen er til stede i en mengde på 62,6 mg;
- d) crospovidon, hvor nevnte crospovidon er til stede i en mengde på 21,91 mg;
- e) croscarmellosenatrium, hvor nevnte croscarmellosenatrium er til stede i en mengde på 9,39 mg;
- f) talkum, hvor nevnte talkum er til stede i en mengde på 31,3 mg;
- g) silisiumdioksid, hvor silisiumdioksidet er til stede i en mengde på 7,2 mg; og
- h) magnesiumstearat, hvor magnesiumstearatet er til stede i en mengde på 4,85 mg.

9. Formulering som definert i et hvilket som helst av kravene 1 til 3, videre omfattende et eller flere terapeutiske midler som er valgt fra gruppen bestående av antidiabetiske midler, antihyperglykemiske midler, hypolipidemiske/lipidsenkende midler; midler mot overvekt; midler mot blodhøytrykk og appetittdependerende midler.

5

10. Formulering som definert i et hvilket som helst av kravene 1 til 3, videre omfattende saksagliptin.

11. Formulering som definert i et hvilket som helst av kravene 1 til 3, videre omfattende metformin.

10

12. Farmasøytisk formulering ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 11 for anvendelse ved behandling eller forsinkelse av progresjonen eller begynnelsen av diabetes type I og type II, nedsatt glukosetoleranse, insulinresistens, nefropati, retinopati, nevropati, katarakter, hyperglykemi, hyperinsulinemi, hyperkolesterolemi, dyslipidemi, forhøyede blodnivåer av frie fettsyrer eller glyserol, hyperlipidemi, hypertriglyseridemi, overvekt, sårheling, vevs iskemi, aterosklerose, hypertensjon eller syndrom X (Metabolsk syndrom).

15

13. Farmasøytisk formulering ifølge et hvilket som helst av kravene 1-12 for anvendelse ved behandling eller forsinkelse av progresjonen eller begynnelsen av diabetes type II.

20