



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 2344141 B1

NORWAY

(19) NO  
(51) Int Cl.  
**A61K 9/20 (2006.01)**  
**A61K 31/138 (2006.01)**  
**A61K 31/4422 (2006.01)**

**Norwegian Industrial Property Office**

---

|      |                                                                            |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |
|------|----------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| (21) | Translation Published                                                      | 2019.10.07                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
| (80) | Date of The European<br>Patent Office Publication of<br>the Granted Patent | 2019.05.01                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
| (86) | European Application Nr.                                                   | 09748467.9                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
| (86) | European Filing Date                                                       | 2009.09.30                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
| (87) | The European Application's<br>Publication Date                             | 2011.07.20                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
| (30) | Priority                                                                   | 2008.09.30, HU, 0800591                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |
| (84) | Designated Contracting<br>States:                                          | AT ; BE ; BG ; CH ; CY ; CZ ; DE ; DK ; EE ; ES ; FI ; FR ; GB ; GR ; HR ; HU ; IE ;<br>IS ; IT ; LI ; LT ; LU ; LV ; MC ; MK ; MT ; NL ; NO ; PL ; PT ; RO ; SE ; SI ; SK ; SM<br>; TR                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |
|      | Designated Extension<br>States:                                            | AL ; BA ; RS                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |
| (73) | Proprietor                                                                 | Egis Gyógyszergyár Zrt., Keresztúri út 30-38, 1106 Budapest, Ungarn                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          |
| (72) | Inventor                                                                   | WAGNER, László, XI. utca 36, H-1172 Budapest, Ungarn<br>ZSIGMOND, Zsolt, Mátyás király u. 67, H-2234 Maglód, Ungarn<br>UJFALUSSY, György, Dózsa György u. 13, H-1028 Budapest, Ungarn<br>LEVENTISZNÉ HUSZÁR, Magdolna, Virányos út 24/a, H-1125 Budapest, Ungarn<br>TONKA-NAGY, Péter, Ököl u. 4/b 9, H-1171 Budapest, Ungarn<br>BÁRCZAY, Erzsébet, Bökényföldi u. 23, H-1165 Budapest, Ungarn<br>GÓRA, Lászlóné, Gyöngyvirág u. 3, H-2117 Isaszeg, Ungarn<br>SZELECZKI, Edit, Osztály u. 6-10/D I.2, H-1165 Budapest, Ungarn<br>FÜLÖP, Ágnes, Szilágyi Dezső u. 87, H-1174 Budapest, Ungarn |
| (74) | Agent or Attorney                                                          | Orsnes Patent ApS, Forskerparken 10, 5230 ODENSE, Danmark                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    |

---

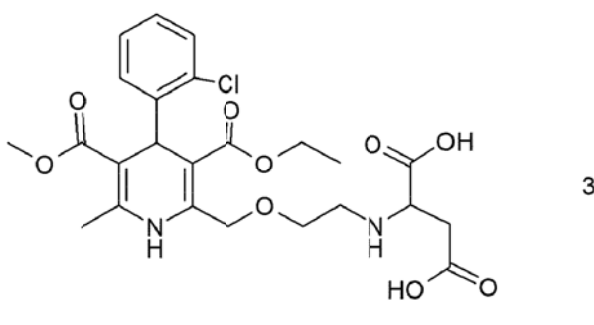
|      |                      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |
|------|----------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| (54) | Title                | <b>COMPOSITIONS COMPRISING AMLODIPINE AND BISOPROLOL</b>                                                                                                                                                                                                                                                                               |
| (56) | References<br>Cited: | IN-A1- 224 215<br>DE-U1- 20 116 428<br>WO-A1-2005/099699<br>BURGES R A ET AL: "PHARMACOLOGIC PROFILE OF AMLODIPINE" AMERICAN JOURNAL<br>OF CARDIOLOGY, CAHNERS PUBLISHING CO., NEWTON, MA, US LNKD-<br>DOI:10.1016/0002-9149(89)90956-9, vol. 64, no. 17, 7 November 1989 (1989-11-07), pages 10I-<br>20I, XP000946560 ISSN: 0002-9149 |

ABDOH A ET AL: "AMLODIPINE BESYLATE-EXCIPIENTS INTERACTION IN SOLID DOSAGE FORM", PHARMACEUTICAL DEVELOPMENT AND TECHNOLOGY, NEW YORK, NY, US, vol. 9, no. 1, 1 January 2004 (2004-01-01) , pages 15-24, XP008034356, ISSN: 1083-7450, DOI: 10.1081/PDT-120027414

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. Stabil fast farmasøytisk blanding som inneholder en homogenisert pulverblanding av amlodipinbase eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme og bisoprololfumarat og farmasøytisk akseptable hjelpestoffer pakket i en dampsikker pakke, og omfatter videre mindre enn 0,5 % av forbindelsen med formelen



basert på vekten av de aktive bestanddelene, hvori blandingen i tillegg omfatter et organisk eller uorganisk fyllmateriale, desintegreringsmiddel, smøremiddel og valgfritt et bindemiddel.

2. Farmasøytisk blanding ifølge krav 1, **karakterisert ved at** blandingen inneholder amlodipinbesylat.

3. Farmasøytisk blanding ifølge krav 1, **karakterisert ved at** blandingen inneholder mindre enn 0,3 % av forbindelsen med formelen (3).

4. Farmasøytisk blanding ifølge krav 1, **karakterisert ved at** blandingen inneholder mindre enn 0,2 % av forbindelsen med formelen (3).

5. Farmasøytisk blanding ifølge krav 1, **karakterisert ved at** blandingen er pakket inn i en kaldformet blære (såkalt Cold Blister /CFF/) av OPA/AL/PVC-komposittfolie dekket med en aluminiumdekkfolie.

6. Farmasøytisk blanding ifølge krav 1, **karakterisert ved at** blandingen er pakket inn i en blære av varmformet dampsikker komposittfolie og dekket med en aluminiumdekkfolie.

7. Farmasøytisk blanding ifølge krav 1, **karakterisert ved at** blandingen er pakket inn i en glass- eller polypropylenbeholder forsynt med et lufttett beholderlokk av polyetylen eller polypropylen.

8. Farmasøytisk blanding ifølge ett av kravene 1-7, som er en tablett eller en kapsel.

9. Farmasøytisk blanding ifølge krav 8, som er en tablett pakket i en dampsikker pakke, **karakterisert ved at** den omfatter 2 %-20 %, fortrinnsvis 2 %-10 %, mer foretrukket, 1-6 %

amlodipinbesylat, 2 %-20 %, fortrinnsvis 2 %-10 %, mer foretrukket 1 %-6 % bisoprololfumarat, i tillegg omfatter 60 %-90 %, fortrinnsvis 70 %-90 %, mer foretrukket 80 %-90 % fyllmateriale, 1 %-10 %, fortrinnsvis 4 %-6 % desintegreringsmiddel, 0,5 %-3 %, fortrinnsvis 1 %-2 % smøremiddel, 0,3 %-2 %, fortrinnsvis 0,1 %-5 % bindemiddel basert på vekten av tablettene.

10. Farmasøytisk blanding ifølge krav 1, som er en tablett pakket inn i en kaldformet blære (såkalt Cold Blister /CFF/) av OPA/AL/PVC-komposittfolie dekket med en aluminiumdekkfolie, eller inn i en blære av varmformbar, dampsikker komposittfolie og dekket med en aluminiumdekkfolie, eller inn i en glass- eller polypropylenbeholder forsynt med et lufttett beholderlokk av polyetylen eller polypropylen, omfatter 1 %-6 % amlodipinbesylat, 1 %-6 % bisoprololfumarat, 80 %-90 % mikrokrySTALLinsk cellulose, 4 %-6 % natriumstivelsesglykolat, 1 %-2 % magnesiumstearat, 0,5 %-1 % kolloidal silika basert på vekten av tablettene.

11. Farmasøytisk blanding ifølge krav 1, som er en kapsel pakket inn i en kaldformet blære (såkalt Cold Blister /CFF/) av OPA/AL/PVC-komposittfolie dekket med en aluminiumdekkfolie, eller inn i en blære av varmformbar dampsikker komposittfolie og dekket med en aluminiumdekkfolie, eller inn i en glass- eller polypropylenbeholder forsynt med et lufttett beholderlokk av polyetylen eller polypropylen, omfatter 10 %-15 % amlodipinbesylat, 10 %-15 % bisoprololfumarat, i tillegg 55 %-65 % mikrokrySTALLinsk cellulose, 4 %-6 % natriumstivelsesglykolat, 1 %-2 % magnesiumstearat, 0,5 %-1 % kolloidal silika basert på vekten av fyllmaterialet i kapselen.

12. Framgangsmåte for framstilling av en stabil fast farmasøytisk blanding som inneholder amlodipinbase eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme og bisoprololfumarat, **karakterisert ved at** amlodipinbasen eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme og bisoprololfumaratet, et desintegreringsmiddel, et smøremiddel og om nødvendig i tillegg hjelpestoffer som brukes i den farmasøytiske industrien homogeniseres, deretter tilsettes et anti-adhesiv, hvori homogeniseringen fortsettes, hvoretter

a.) homogenisatet presses til tabletter ved bruk av en direkte komprimeringsprosess eller,

b.) fylles inn i harde gelatinkapsler på en kjent måte,

hvoretter de oppnådde tablettene eller kapslene pakkes inn i dampsikre beskyttende pakker på en kjent måte.

13. Framgangsmåte for framstilling av tabletter ifølge krav 12, **karakterisert ved at** det anvendes 2 %-20 %, fortrinnsvis 2 %-10 %, mer foretrukket 1-6 % amlodipinbase eller et farmasøytisk akseptabelt syreaddisjonssalt av samme, fortrinnsvis amlodipinbesylat, 2 %-20 %, fortrinnsvis 2 %-10 %, mer foretrukket 1 %-6 % bisoprololfumarat, i tillegg 60 %-90 %, fortrinnsvis 70 %-90 %, mer foretrukket 80 %-90 % fyllmateriale, 1 %-10 %, fortrinnsvis 4 %-6 % desintegreringsmiddel, 0,5 %-3 %, fortrinnsvis 1 %-2 % smøremiddel, 0,3 %-2 %, fortrinnsvis 1 %-10 %, fortrinnsvis 0,5 %-1 % bindemiddel, basert på vekten av tablettene.
14. Framgangsmåte for framstilling av kapsler ifølge krav 12, **karakterisert ved at** det anvendes 5 %-80 %, fortrinnsvis 5 %-18 %, mer foretrukket, 10-15 % amlodipinbase eller et farmasøytisk akseptabelt syreaddisjonssalt av samme, fortrinnsvis amlodipinbesylat, 5 %-80 %, fortrinnsvis 5 %-15 %, mer foretrukket 10 %-15 % bisoprololfumarat, i tillegg 1 %-10 %, fortrinnsvis 4 %-6 % desintegreringsmiddel, 0,5 %-3 %, fortrinnsvis 1 %-2 % smøremiddel, 0,3 %-2 %, fortrinnsvis 0,5 %-1 % anti-klebemiddel, og om nødvendig 10 %-75 %, fortrinnsvis 45 %-75 %, mer foretrukket 55 %-65 % fyllmateriale, basert på vekten av fyllmaterialet i kapselen.