



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2442791 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61P 7/02 (2006.01)
A61K 9/16 (2006.01)
A61K 9/20 (2006.01)
A61K 31/4545 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2020.03.09
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.11.27
(86)	European Application Nr.	10727611.5
(86)	European Filing Date	2010.06.15
(87)	The European Application's Publication Date	2012.04.25
(30)	Priority	2009.06.16, US, 187442 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 ; SE ; SI ; SK ; SM ; TR
(73)	Proprietor	Pfizer Inc., 235 East 42nd Street, New York, NY 10017, USA Bristol-Myers Squibb Holdings Ireland Unlimited Company, Hinterbergstrasse 16, 6312 Steinhausen, Sveits
(72)	Inventor	NAUSE, Richard, G., C/o Pfizer Inc. Easton Point Rd. Ms 8156-21, Groton, CT 06340, USA
(74)	Agent or Attorney	TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

(54) Title **DOSAGE FORMS OF APIXABAN**

(56) References
Cited: EP-A2- 1 027 887
 US-A1- 2003 104 063
 US-B1- 6 706 283
 WO-A2-2007/022165
 US-A1- 2007 259 913

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. Doseringsform som tilveiebringer kontrollert frigivelse av apiksaban, doseringsformen omfattende en løselighetsforbedret form av apiksaban som er en fast amorf dispersjon
5 omfattende apiksabanet og hydroksypropylmetylcelluloseacetatsuksinatet (HPMCAS).
2. Doseringsformen ifølge krav 1, hvori doseringsformen er en doseringsform med kontrollert frigivelse som frigjør *in vitro* 70 vekt-% av apiksabanet i løpet av 2 timer eller mer etter administrering av doseringsformen til et vandig miljø for anvendelse.
10
3. Doseringsformen ifølge krav 1, hvori doseringsformen med kontrollert frigivelse er en osmotisk doseringsform med kontrollert frigivelse.
4. Doseringsformen ifølge krav 3, hvori doseringsformen med kontrollert frigivelse er en
15 to-lags osmotisk doseringsform med kontrollert frigivelse.
5. Doseringsformen ifølge krav 1, hvori den faste amorfe dispersjonen er en spraytørket dispersjon.
- 20 6. Doseringsformen ifølge krav 4, hvori den faste amorfe dispersjonen omfattende apiksabanet og polymeren er en spraytørket dispersjon.
7. Doseringsformen ifølge krav 6, hvori den osmotiske doseringsformen med kontrollert frigivelse omfatter en to-lags tablett omfattende en åpning.
25
8. Doseringsformen ifølge krav 1, hvori doseringsformen med kontrollert frigivelse er en matriksdoseringsform med kontrollert frigivelse.
9. Doseringsformen ifølge krav 8, hvori den faste amorfe dispersjonen er en spraytørket
30 dispersjon.
10. Doseringsformen ifølge krav 1 som har en *in-vitro* oppløsningsrate, hvori *in-vitro*-oppløsningsraten er hvori mindre enn ca. 10 vekt-% apiksaban frigjøres i løpet av en time, ca. 20 vekt-% apiksaban til ca. 40 vekt-% apiksaban frigjøres i løpet av fire timer, ca. 60 vekt-% apiksaban til ca. 80 vekt-% apiksaban frigjøres i løpet av ca. åtte timer,
35 og mer enn ca. 70 vekt-% apiksaban frigjøres i løpet av ti timer.

- 11.** Doseringsformen ifølge krav 1 som har en *in-vitro* oppløsningsrate, hvori in-vitro-oppløsningsraten er hvori mindre enn ca. 20 vekt-% apiksaban frigjøres i løpet av en time, ca. 20 vekt-% apiksaban til ca. 40 vekt-% apiksaban frigjøres i løpet av to timer, ca. 50 vekt-% apiksaban til ca. 75 vekt-% apiksaban frigjøres i løpet av ca. fire timer, og
5 mer enn ca. 70 vekt-% apiksaban frigjøres i løpet av seks timer.
- 12.** Doseringsformen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-11, for anvendelse i behandling av tromboemboliske lidelser.
- 10 **13.** Doseringsformen for anvendelse ifølge krav 12, hvori den tromboemboliske lidelsen er venøs tromboembolisme, dyp venetrombose, akutt koronarsyndrom eller arteriell trombose.