



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2493457 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/20 (2006.01)
A61K 31/4468 (2006.01)
A61K 31/5517 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2018.01.22
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2017.08.09
(86)	European Application Nr.	10827255.0
(86)	European Filing Date	2010.10.26
(87)	The European Application's Publication Date	2012.09.05
(30)	Priority	2009.10.30, SG, 200907221
(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
(73)	Proprietor	IX Biopharma Ltd, 80 Robinson Road 02-00, Singapore 068898, SG-Singapore
(72)	Inventor	LIM, Chin Beng, Stephen, 35 The Pinnacle, Willetton, Western Australia 6155, AU-Australia SUNDERLAND, Vivian, Bruce, 12 Brown Street, Claremont, Western Australia 6010, AU-Australia LEE, Yip Hang, Eddy, 28 Scotts Road 07-05 Scotts 28, Singapore 228223, SG-Singapore
(74)	Agent or Attorney	Zacco Norway AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

(54)	Title	FAST DISSOLVING SOLID DOSAGE FORM
(56)	References Cited:	EP-A1- 1 621 186, EP-A1- 1 923 074, WO-A1-95/20377, CN-A- 101 332 197, JACOB, S. ET AL.: 'Novel Co-Processed Excipients of Mannitol and Microcrystalline Cellulose for Preparing Fast Dissolving Tablets of Glipizide' INDIAN JOURNAL OF PHARMACEUTICAL SCIENCES vol. 69, no. 5, 2007, pages 633 - 639, XP008156723, US-A- 5 558 880, US-A1- 2006 251 716, US-B1- 6 509 040, AHMED I. S. ET AL.: 'Formulation of a Fast-Dissolving Ketoprofen Tablet Using Freeze-Drying in Blisters Technique.' DRUG DEVELOPMENT AND INDUSTRIAL PHARMACY vol. 32, 2006, pages 437 - 442, XP008156710, US-A- 3 767 807

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

- 5 **1.** Hurtig desintegrerende og oppløsende fast porøs frysetørket smeltetablett-doseringsform egnet for frisetting av et biologisk aktivt materiale i en munnhule, hvori doseringsformen omfatter:
- a) et biologisk aktivt materiale; og
- b) et matriksdannende middel omfattende amylopektin i en konsentrasjon fra 2 % til 17 % av doseringsformens tørrvekt; hvori doseringsformen i det vesentlige løses opp i munnhulen.
- 10 **2.** Den hurtig desintegrerende og oppløsende faste doseringsformen ifølge krav 1, hvori det biologisk aktive materialet er til stede i en mengde fra 0,02 til 95 vekt-% av tørrvekten til doseringsformens sammensetning.
- 15 **3.** Den desintegrerende og hurtig oppløsende faste doseringsformen ifølge krav 1, ytterligere omfattende et andre matriksdannende middel, hvori det andre matriksdannende middelet er mikrokrySTALLINSK cellulose.
- 20 **4.** Den hurtig desintegrerende og oppløsende faste doseringsformen ifølge krav 3, hvori den mikrokrySTALLINSKE cellulosen er til stede i en mengde fra 1 til 10 vekt-% av tørrvekten til doseringsformens sammensetning.
- 25 **5.** Den hurtig desintegrerende og oppløsende faste doseringsformen ifølge krav 1, ytterligere omfattende et andre matriksdannende middel, hvori det andre matriksdannende middelet er glysin.
- 30 **6.** Den hurtig desintegrerende og oppløsende faste doseringsformen ifølge krav 5, hvori glysinet er til stede i en mengde fra 0,5 til 5 vekt-% av tørrvekten til doseringsformens sammensetning.
- 35 **7.** Den hurtig desintegrerende og oppløsende faste doseringsformen ifølge krav 1, ytterligere omfattende et andre matriksdannende middel, hvori det andre matriksdannende middelet er mannitol.
- 8.** Den hurtig desintegrerende og oppløsende faste doseringsformen ifølge krav 7, hvori mannitolen er til stede i en mengde fra 5 til 80 vekt-% av tørrvekten til doseringsformens sammensetning.

- 5 **9.** Den hurtig desintegrerende og oppløsende faste doseringsformen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, ytterligere omfattende minst ett smøremiddel.
- 10 **10.** Den hurtig desintegrerende og oppløsende faste doseringsformen ifølge krav 9, hvori det minst ene smøremiddelet omfatter polyetylenglykol (PEG) 2000.
- 10 **11.** Den hurtig desintegrerende og oppløsende faste doseringsformen ifølge krav 10, hvori PEG 2000 er til stede i en mengde fra 0,05 til 5 vekt-% av tørrvekten til doseringsformens sammensetning.
- 15 **12.** Den hurtig desintegrerende og oppløsende faste doseringsformen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, ytterligere omfattende minst én bufferreagens.
- 20 **13.** Den hurtig desintegrerende og oppløsende faste doseringsformen krav 12, hvori den minst ene bufferreagensen omfatter natriumkarbonat.
- 20 **14.** Den hurtig desintegrerende og oppløsende faste doseringsformen ifølge krav 13, hvori natriumkarbonat er til stede i en mengde fra 0,01 til 10 vekt-% av tørrvekten til doseringsformens sammensetning.
- 25 **15.** Den hurtig desintegrerende og oppløsende faste doseringsformen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, ytterligere omfattende minst én absorpsjonsforsterker.
- 30 **16.** Den hurtig desintegrerende og oppløsende faste doseringsformen ifølge krav 15, hvori den minst ene absorpsjonsforsterkeren omfatter β -syklodekstrin.
- 30 **17.** Den hurtig desintegrerende og oppløsende faste doseringsformen ifølge krav 16, hvori β -syklodekstrinet er til stede i en mengde fra 0,01 til 10 vekt-% av tørrvekten til doseringsformens sammensetning.
- 35 **18.** Den hurtig desintegrerende og oppløsende faste doseringsformen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, ytterligere omfattende minst ett flokkuleringsmiddel.

- 5 **19.** Den hurtig desintegrerende og oppløsende faste doseringsformen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, ytterligere omfattende minst én surfaktant.
- 10 **20.** Den hurtig desintegrerende og oppløsende faste doseringsformen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, ytterligere omfattende minst ett additiv.
- 10 **21.** Den hurtig desintegrerende og oppløsende faste doseringsformen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, ytterligere omfattende minst ett fargemiddel.
- 15 **22.** Den hurtig desintegrerende og oppløsende faste doseringsformen ifølge krav 21, hvori det minst ene fargemiddelet er valgt fra gruppen bestående av FD & C fargestoffer blå nr. 2 og rød nr. 40 og blandinger derav.
- 20 **23.** Den hurtig desintegrerende og oppløsende faste doseringsformen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, ytterligere omfattende minst ett smaksmiddel.
- 25 **24.** Den hurtig desintegrerende og oppløsende faste doseringsformen ifølge krav 23, hvori det minst ene fargemiddelet er valgt fra gruppen bestående av appelsin, mynte, bringebær, karamell, aspartam, sakkarin og blandinger derav.
- 30 **25.** Den hurtig desintegrerende og oppløsende faste doseringsformen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori doseringsformen er en smeltetablett.
- 35 **26.** Den hurtig desintegrerende og oppløsende faste doseringsformen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori doseringsformen i det vesentlige løses opp når den plasseres i munnhulen over et tidsrom valgt fra gruppen bestående av: mindre enn 50 sekunder, mindre enn 40 sekunder, mindre enn 30 sekunder, mindre enn 20 sekunder, mindre enn 15 sekunder, mindre enn 10 sekunder, mindre enn 7,5 sekunder, mindre enn 5 sekunder, mindre enn 4 sekunder, mindre enn 3 sekunder, mindre enn 2 sekunder.

27. Den hurtig desintegrerende og oppløsende faste doseringsformen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, ytterligere omfattende minst én farmasøytisk akseptabel bærer.

5 **28.** Fremgangsmåte for å fremstille en hurtig desintegrerende og oppløsende porøs fast smeltetablett-doseringsform egnet for frisetting av et biologisk aktivt materiale i en munnhule, omfattende trinnene:

- 10 i) å kombinere et matriksdannende middel omfattende amylopektin i en konsentrasjon fra 2 % til 17 % av doseringsformens tørrvekt med et biologisk aktivt materiale for å danne en homogen blanding; og
- 15 ii) å frysetørke blandingen for å danne den faste doseringsformen hvori doseringsformen i det vesentlige løses opp i munnhulen.

15 **29.** Fremgangsmåte ifølge krav 28, ytterligere omfattende å måle blandingen i en preformet plast- eller aluminiumblisterform.

30. Fremgangsmåte ifølge krav 29, hvori frysetørkingsteknikken anvendes for å fjerne løsemiddelet fra blisterformen.

20 **31.** Fremgangsmåte ifølge krav 30, ytterligere omfattende å forsegle den faste doseringsformen med en plast- eller aluminiumfolie for å hindre fuktabsorpsjon.

25 **32.** Fremgangsmåte ifølge et hvilket som helst av kravene 28 til 31, ytterligere omfattende å tilsette et pH-regulerende middel for å holde blandingens pH innenfor et område mellom 3,0 og 8,0.

33. Fremgangsmåte ifølge et hvilket som helst av kravene 28 til 32, ytterligere omfattende et løsemiddel.

30 **34.** Kit omfattende

(a) en hurtig desintegrerende og oppløsende porøs fast smeltetablett-doseringsform egnet for frisetting av et biologisk aktivt materiale i en munnhule, hvori doseringsformen omfatter:

- 35 i) et biologisk aktivt materiale, og
- ii) et matriksdannende middel omfattende amylopektin i en konsentrasjon fra 2 % til 17 % av doseringsformens tørrvekt,

hvor i doseringsformen i det vesentlige løses opp i munnhulen, og hvor i doseringsformen fremstilles ved frysetørking, og
(b) instruksjoner for bruk av denne.