



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2588114 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/585 (2006.01)
A61K 9/22 (2006.01)
A61P 15/18 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2020.03.02
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.12.25
(86)	European Application Nr.	11727985.1
(86)	European Filing Date	2011.06.28
(87)	The European Application's Publication Date	2013.05.08
(30)	Priority	2010.06.29, EP, 10305708 2010.07.28, US, 368396 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
(73)	Proprietor	Laboratorios Leon Farma SA, c/ La Vallina s/n - Poligono Industrial Navatejera Villaquilambre, 24008 Leon, Spania
(72)	Inventor	PERRIN, Philippe, 10 rue Docteur Roux, 75015 Paris, Frankrike VELADA, José, Harlingenstraat 35, 3826 Amersfoort BA, Nederland DROUIN, Dominique, 32 rue des Gatines, 91370 Verrieres, Frankrike
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54)	Title	PHARMACEUTICAL COMPOSITION COMPRISING DROSPIRENONE AND CONTRACEPTIVE KIT
(56)	References Cited:	WO-A2-2008/031631 WO-A1-2009/138224

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. Prevensjonssett omfattende en eller flere forpakningsenheter hvor hver forpakningsenhet omfatter 21 til 28 daglige aktive doseringsenheter og hvor
- 5 (a) mengden drospirenon i hver daglig aktiv doseringsenhet er minst 2 mg, uten noe østrogen, og
- (b) hver daglig aktiv doseringsenhet består av en prevensjonssammensetning egnet for oral administrering som omfatter drospirenon, hvor drospirenon har en d50-partikkelstørrelse som varierer fra 10 μm til 60 μm , slik at:
- 10 (i) ikke mer enn 50% av drospirenonet som opprinnelig var tilstede i nevnte daglige aktive doseringsenhet oppløses i løpet av 30 minutter og
- (ii) minst 50% av det nevnte drospirenonet er oppløst i et tidsrom fra 3 timer til 4 timer,
- når den daglige aktive doseringsenheten utsettes for en *in vitro*-oppløsningstest i henhold til USP XXIII Paddle Method, hvor prosentene av
- 15 drospirenon er relatert til mengden drospirenon som opprinnelig var tilstede i den nevnte daglige aktive doseringsenheten
2. Prevensjonssett ifølge krav 1, hvor drospirenon har en partikkelstørrelsesfordeling
- karakterisert av:**
- 20 (i) en d90-partikkelstørrelse på mindre enn 100 μm ;
- (ii) en d50-partikkelstørrelse fra 10 μm til 60 μm ; og
- (iii) en d10-partikkelstørrelse på mer enn 3 μm .
3. Prevensjonssett ifølge et hvilket som helst av kravene 1 eller 2, hvor drospirenonet
- 25 er den eneste prevensjonsbestanddelen.
4. Prevensjonssett ifølge et av kravene 1 til 3, hvor mengden drospirenon i hver daglig aktiv enhetsdosering varierer fra ca. 2,0 mg til ca. 6,0 mg, fortrinnsvis fra ca. 3,0 mg til ca. 4,5 mg, mer fortrinnsvis ca. 4 mg.
- 30
5. Prevensjonssett ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, hvor en eller flere forpakningsenheter videre omfatter fra 1 til 7 daglige doseringsenheter av et farmasøytisk akseptabelt placebo.
- 35 6. Prevensjonssett ifølge et av kravene 1 til 5, hvor hver forpakningsenhet omfatter 24 daglige aktive doseringsenheter.

7. Prevensjonssett ifølge krav 6, videre omfattende 4 daglige placebodoseringsenheter.

8. Prevensjonssett ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 7, hvor nevnte

5 prevensjonssammensetning omfatter:

- drospirenon i en mengde som utgjør 1 til 10 vekt%,
- minst ett bindemiddel som utgjør 50 til 65 vekt%,
- minst ett fyllstoff som utgjør 25 til 35 vekt%,
- minst ett glidemiddel som utgjør 0,2 til 6 vekt%, og
- 10 - minst ett smøremiddel som utgjør 0,2 til 0,6 vekt%,

vektprosentene er relatert til den totale vekten av nevnte prevensjonssammensetning.

9. Prevensjonssett ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8, hvor nevnte

prevensjonssammensetning omfatter drospirenon, minst ett bindemiddel, minst ett

15 fyllstoff, minst ett glidemiddel og minst ett smøremiddel hvor:

- (i) det minst ene bindemiddelet er mikrokrySTALLinsk cellulose,
- (ii) det minst ene fyllstoffet er vannfri laktose,
- (iii) det minst ene glidemiddelet er silisiumdioksid, og
- (iv) det minst ene smøremiddelet er magnesiumstearat.

20

10. Farmasøytisk sammensetning egnet for oral administrering omfattende drospirenon hvor:

(a) en daglig aktiv doseringsenhet av nevnte sammensetning omfatter en mengde drospirenon på minst 2 mg, uten noe østrogen, og

25

(b) den nevnte daglige aktive doseringsenheten omfatter drospirenon, og drospirenon har en d50-partikkelstørrelse i intervallet fra 10 µm til 60 µm, slik at:

- (i) ikke mer enn 50% av drospirenonet som opprinnelig var tilstede i nevnte daglige aktive doseringsenhet oppløses i løpet av 30 minutter, og
- 30 (ii) minst 50% av nevnte drospirenon er oppløst i et tidsrom fra 3 timer til 4 timer,

når den daglige aktive doseringsenheten utsettes for en *in vitro*-

oppløsningstest i henhold til USP XXIII Paddle Method, hvor prosentene av

drospirenon er relatert til mengden drospirenon som opprinnelig var tilstede i

35

nevnte daglige aktive doseringsenhet,

for anvendelse som et prevensjonsmiddel for en kvinnelig pasient med behov derav.

11. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 10, hvor nevnte sammensetning er som definert i hvilket som helst av kravene 1 til 4, 8 eller 9.

5 12. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 10 eller 11, hvor de daglige doseringsenhetene av sammensetningen administreres til nevnte kvinnelige pasient i løpet av en periode på 21 til 28 påfølgende dager.

10 13. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 10 til 12, hvor de daglige doseringsenhetene av sammensetningen administreres omfattende to faser:

- en første fase hvor aktive daglige doseringsenheter administreres til den kvinnelige pasienten over en periode på 21 til 27 påfølgende dager, etterfulgt av
- 15 ▪ en andre fase der ikke noe prevensjonsmiddel administreres til den kvinnelige pasienten over en periode på 1 til 7 påfølgende dager.

14. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 13, hvor daglige placebodoseringsenheter administreres i løpet av nevnte andre fase.

20

15. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 13 eller 14, hvor den første fasen varer i 24 påfølgende dager og den andre fasen varer i 4 påfølgende dager.