



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2648702 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/46 (2006.01)
A61K 31/663 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2019.06.24
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.03.06
(86)	European Application Nr.	11846465.0
(86)	European Filing Date	2011.12.05
(87)	The European Application's Publication Date	2013.10.16
(30)	Priority	2010.12.06, US, 419972 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	Effrx Pharmaceuticals SA, Wolleraustrasse 41 B, 8807 Freienbach, Sveits
(72)	Inventor	HAYWARD, Marshall, A., 655 Carlene Drive, Bridgewater, NJ 08807, USA SCHMIDT, Timo, Neuhofstrasse 6, 8834 Schindellegi, Sveits
(74)	Agent or Attorney	Nordic Patent Service A/S, Bredgade 30, 1260 KØBENHAVN K, Danmark

(54)	Title	STABLE EFFERVESCENT BISPHOSPHONATE FORMULATIONS WITH RAPID SOLUBILIZATION CHARACTERISTICS
------	-------	--

(56)	References Cited:	WO-A1-2010/101537 US-A- 5 415 870 US-A1- 2001 002 395 US-A1- 2006 240 103 US-B2- 7 488 496 GB-A- 2 153 225 US-A- 5 462 932 US-A1- 2001 041 165 EP-A2- 1 197 213
------	----------------------	---

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. Lagringsstabil brusende tablettetsammensetning, som omfatter:

en effektiv mengde mikronisert natriumalendronattrihydrat av størrelsesfordeling rundt $X_{10} = 2,7 \mu\text{m}$, ca. $X_{50} = 6,2 \mu\text{m}$, ca. $X_{90} = 13 \mu\text{m}$, som en bisfosfonatbenresorpsjonsinhibitor,

5 en brusende organisk syrekomponent som inneholder sitronsyre og 20-70 % mononatriumcitrat, en brusende basiskomponent valgt fra gruppen som består av natriumbikarbonat, natriumkarbonat, kaliumbikarbonat, kaliumkarbonat, natriumseskvikarbonat, natriumglysinkarbonat og blandinger derav;

hvori tablettten er blitt oppnådd ved anvendelse av en granuleringsprosess med fluidisert sjikt,

10 som inkluderer blanding i en granulator med fluidisert sjikt, den brusende organiske syrekomponenten og den brusende basiskomponenten sprøytegranulert med rensset vann, tilsetning av natriumalendronattrihydratet dertil og tableettering av den resulterende sammensetningen for å oppnå en hardhet på 35 til 120 Newton,

15 hvori tablettten har en totalvekt på 3,500 mg til 6,000 mg, er fri for polyolbindere og tableetteringssmøremidler; har et tap ved tørking på 0,25 % (m/m) eller mindre; har en fullstendig oppløsningstid på ikke mer enn 180 sekunder når den plasseres i 88,72 til 236,59 ml (3 til 8 fluid unzer) vann ved mellom 5-20 °C; og alendronatet løses fullstendig opp i vannet innen 2 minutter uten omrøring.

2. Sammensetningen ifølge krav 1, som har tablettthardheter i området fra 60 til 20 90 Newton.

3. Sammensetningen ifølge krav 1, som har en desintegrasjonstid mellom 60 og 130 sekunder.

4. Sammensetningen ifølge krav 1, hvori den brusende organiske syrekomponenten inneholder 30-60 % mononatriumcitrat.

25 5. Sammensetningen ifølge krav 1, hvori den brusende organiske syrekomponenten inneholder 40-50 % mononatriumcitrat.

6. Sammensetningen ifølge krav 1, hvori den brusende organiske syrekomponenten og den brusende basiskomponenten tilveiebringer et buffersystem av natriumkarbonat, natriumbikarbonat og 20-70 % mononatriumcitrat, som resulterer i en pH på 4-7 når den løses 30 opp i 200 ml vann.

7. Sammensetningen ifølge krav 6, hvori buffersystemet resulterer i en pH på 5-6 når den løses opp i 200 ml vann.

8. Sammensetningen ifølge krav 6, som har en syrenøytraliseringskapasitet på 5-20 mEq per tablett.

9. Sammensetningen ifølge krav 6, som har en syrenøytraliseringskapasitet på 10-16 mEq per tablett.
10. Sammensetningen ifølge krav 6, som bufrer pH-en i en pasients mage i minst 15 minutter.
- 5 11. Sammensetningen ifølge krav 1, som omfatter en daglig, ukentlig, to-ukentlig eller månedlig oral dose av natriumalendronattrihydrt.
12. Sammensetningen ifølge krav 1, som videre omfatter en smaksstoffkomponent valgt fra gruppen som består av jordbær, aprikos, sitrus og kirsebær, som eventuelt inneholder søtningsmidler valgt fra gruppen som består av aspartam, acesulfam K, sukralose, sakkarin, 10 syklamat, taumatin, steviosider eller neohesperidin.
13. Sammensetningen ifølge krav 1, som videre omfatter et steroidhormon, vitamin D eller et annet ytterligere terapeutisk middel gitt i kombinasjon med natriumalendronattrihydrt.