



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2729128 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/16 (2006.01)
A61K 9/20 (2006.01)
A61K 31/34 (2006.01)
A61K 31/635 (2006.01)
A61K 45/06 (2006.01)
A61K 47/38 (2006.01)
A61P 31/18 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2016.12.05
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2016.07.27
(86)	European Application Nr.	12732668.4
(86)	European Filing Date	2012.07.06
(87)	The European Application's Publication Date	2014.05.14
(30)	Priority	2011.07.07, EP, 11173066
(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	Janssen Sciences Ireland UC, Eastgate Village, Eastgate, Little Island, County Cork, IE-Ireland
(72)	Inventor	DELAET, Urbain Alfons C, Wildenest 37, B-2490 Balen, BE-Belgia HEYNS, Philip Erna H, Elsakker 19, B-2350 Vosselaar, BE-Belgia JANS, Eugene Maria Jozef, Bevrijdingslaan 132, B-2450 Meerhout, BE-Belgia
(74)	Agent or Attorney	Tandbergs Patentkontor AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

(54) Title **DARUNAVIR FORMULATIONS**

(56) References
Cited: WO-A2-2009/000853
 WO-A2-2009/013356
 WO-A2-2009/081174
 WO-A2-2011/048604

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. En darunavirgranulatsammensetning bestående av darunavir eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav, hypromellose og eventuelt gjenværende vann fra granuleringen.
- 10 2. En darunavirgranulatsammensetning ifølge krav 1, hvor darunavir er til stede i form av dets etanolat, og hypromellose er hypromellose 2910 15 mPa.s.
- 15 3. En oral doseringsform omfattende 0,4 til 0,6 vekt% (vekt/vekt) av et smøremiddel, omtrent 2 til 4 vekt% (vekt/vekt) av et disintegreringsmiddel, mikrokrySTALLinsk cellulose, og omtrent 50 til 90 vekt% (vekt/vekt) av et darunavirgranulat ifølge krav 1 eller 2, der kjernen eventuelt er belagt med et filmbelegg.
- 20 4. En oral doseringsform ifølge krav 3, hvor nevnte kjerne videre omfatter en ytterligere aktiv bestanddel.
- 5 5. En oral doseringsform ifølge krav 4, hvor den ytterligere aktive bestanddel er en cytokrom P450-inhibitor.
- 25 6. En oral doseringsform ifølge hvilket som helst av de foregående krav, omfattende omtrent 0,5 vekt% (vekt/vekt) av et smøremiddel
- 30 7. En oral doseringsform ifølge krav 6, som omfatter omtrent 800 mg fri form tilsvarende darunavir.
- 35 8. Fremgangsmåte for fremstilling av en oral doseringsform ifølge hvilket som helst av de foregående krav, omfattende følgende trinn:
 - tilveiebringe granulert darunavir ved; å blande vann og hypromellose 2910 15 mPa.s, å sprøyte denne første blanding med et pulver av darunavir eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav, og å tørke det således oppnådde darunavirgranulat,
 - tilveiebringe en andre blanding omfattende mikrokrySTALLinsk cellulose og et disintegreringsmiddel,
 - tilføre granulert darunavir til blandingen og påfølgende tørrblanding,
 - tilføre et smøremiddel og blande til det er homogent,

- sammenpresse blandingen for å tilveiebringe den orale doseringsformen, idet nevnte orale doseringsform så blir eventuelt filmbelagt.

5 **9.** En oral doseringsform ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 7, for anvendelse i medisin.

10. En oral doseringsform ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 7, for anvendelse ved behandling av HIV-infeksjon.