



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2844233 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/24 (2006.01)
A61K 31/397 (2006.01)
A61K 31/505 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2020.08.31
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.05.06
(86)	European Application Nr.	13785009.5
(86)	European Filing Date	2013.05.01
(87)	The European Application's Publication Date	2015.03.11
(30)	Priority	2012.05.01, US, 201261641013 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	Althera Life Sciences, LLC, 1448 89 Headquarters Plaza, Morristown, NJ 07960, USA
(72)	Inventor	DIAS, Marie, Charmaine, 144889 Headquarters Plaza, Morristown, NJ 07960, USA
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54)	Title	ORAL TABLET FORMULATION CONSISTING OF FIXED COMBINATION OF ROSUVASTATIN AND EZETIMIBE FOR TREATMENT OF HYPERLIPIDEMIA AND CARDIOVASCULAR DISEASES
------	-------	--

(56)	References Cited:	WO-A2-2009/024889 WO-A1-2012/064307 WO-A2-2011/019326 US-A1- 2003 072 800 US-A1- 2010 204 195 WO-A1-2010/021608 WO-A2-2011/139256 US-A1- 2004 126 423 US-A1- 2010 247 645 US-A1- 2011 262 497
------	----------------------	--

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. Fast doseringsform av rosuvastatin og ezetimib kombinert i en tolags tablettformulering omfattende et fast lag av rosuvastatin formulert med mikrokrySTALLinsk cellulose, et separat fast
5 lag av ezetimib formulert uten mikrokrySTALLinsk cellulose ved å løse opp ezetimib og montere det på laktose og farmasøytisk akseptable tilsetningsstoffer egnet for fremstilling av faste doseringsformer av en kombinasjon av rosuvastatin og ezetimib.
2. Den faste doseringsformen ifølge krav 1, hvori rosuvastatindoseringen varierer fra
10 2,5 mg til 40 mg, og ezetimib varierer fra 5 mg til 20 mg.
3. Den faste doseringsformen ifølge krav 1, som omfatter et rosuvastatinlag som består av rosuvastatin, stivelse 1–15 vekt-%, dikalsiumfosfat 0,5–10 vekt-%, cellulose 20–90 vekt-%, krysspovidon 2–30 vekt-% og et smøremiddel, så som natriumstearylfulmarat, 0,1–2 vekt-% og
15 eventuelt et antioksidasjonsmiddel, så som butylert hydroksyanisol, 0,05–2 vekt-% eller et dispersjonsmiddel, så som Aerosil, 1–10 vekt-%.
4. Den faste doseringsformen ifølge krav 3, som omfatter et ezetimiblag som består av ezetimib, et overflateaktivt middel, så som natriumlaurylsulfat, 2–20 vekt-%, laktose
20 20–90 vekt-%, et desintegreringsmiddel, så som krysskarmellose, 5–30 vekt-%, et bindemiddel, så som polyvinylpyrrolidon, 0,5–10 vekt-% og magnesiumstearat 0,2–5 vekt-%.
5. Fremgangsmåten for å fremstille en fast oral doseringsform av rosuvastatin og ezetimib ifølge krav 1, omfattende trinnene:
25
 - a) å blande rosuvastatinkalsium med pregelatinert stivelse, kalsiumhydrogenfosfatdihydrat, mikrokrySTALLinsk cellulose og krysspovidon, som passerer gjennom sil og smører blandingen med smøremiddel så som natriumstearylfulmarat for å lage rosuvastatinlagsblanding,
 - b) å blande ezetimib med et fuktemiddel så som natriumlaurylsulfat, og dispergere
30 materiale i tilstrekkelig mengde av isopropylalkohol og diklormetanblanding,
 - c) å absorbere dispersjonen på laktose og blande grundig,
 - d) å lufttørke dispersjonen, og passere gjennom sil, blande med krysskarmellosenatrium, og blande,
 - e) å granulere blandingen med polyvinylpyrrolidonløsning og tørke for å oppnå

ezetimibgranulene,

f) å lage den ønskede to-lags tablett ved å komprimere de to utpregede forskjellige granulsettene i en to-lags kompresjonsmaskin, etterfulgt av filmbelegg av den orale doseringsformen.

5

6. Fast doseringsform av rosuvastatin og ezetimib ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4 for anvendelse i behandling av hyperlipidemi, hjerte-kar-sykdommer, kongestiv hjertesvikt, hjerteinfarkt, åreforkalkning hos en pasient som har behov for en slik behandling.