



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2892507 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/28 (2006.01)
A61K 31/4412 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2017.06.12
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2017.02.01
(86)	European Application Nr.	13762967.1
(86)	European Filing Date	2013.09.05
(87)	The European Application's Publication Date	2015.07.15
(30)	Priority	2012.09.06, EP, 12183331
(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
	Designated Extension States:	BA ME
(73)	Proprietor	Bayer HealthCare LLC, 100 Bayer Boulevard, Whippany, NJ 07981-0915, US-USA
(72)	Inventor	SKRABS, Susanne, Eschengraben 139, 13189 Berlin, DE-Tyskland FUNKE, Adrian, Insterburgallee 33a, 14055 Berlin, DE-Tyskland KRESSE, Mayk, Dohnenstieg 4, 14195 Berlin, DE-Tyskland OBERDIECK, Ulrich, Machnower Str. 79, 14165 Berlin, DE-Tyskland
(74)	Agent or Attorney	Tandbergs Patentkontor AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

(54)	Title	COATED PHARMACEUTICAL COMPOSITION CONTAINING REGORAFENIB
(56)	References Cited:	WO-A1-2006/026500 WO-A1-2007/068381 WO-A1-2009/054550

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. En farmasøytisk sammensetning omfattende regorafenib, et hydrat, solvat, metabolitt,
5 eller et farmasøytisk akseptabelt salt av regorafenib, eller en polymorf derav og minst én farmasøytisk akseptabel eksipiens, hvor den farmasøytiske sammensetningen er belagt med et belegg som omfatter en polyvinylalkohol-basert polymer og eventuelt én eller flere ytterligere farmasøytisk akseptable eksipienser, hvor metabolitten er valgt fra gruppen bestående av 4-[4-({[4-klor-3-(trifluormetyl)fenyl]karbamoyl}amino)-3-fluorfenoksy]-N-metylpyridin-2-karboksamid-1-oksid, 4-[4-({[4-klor-3-(trifluormetyl)-
10 fenyl]karbamoyl}amino)-3-fluorfenoksy]-N-(hydroksymetyl)pyridin-2-karboksamid, 4-[4-({[4-klor-3-(trifluormetyl)fenyl]karbamoyl}amino)-3-fluorfenoksy]pyridin-2-karboksamid og 4-[4-({[4-klor-3-(trifluormetyl)fenyl]karbamoyl}amino)-3-fluorfenoksy]-pyridin-2-karboksamid-1-oksid.
15
2. Sammensetningen ifølge krav 1, omfattende regorafenib som aktiv bestanddel.
3. Sammensetningen ifølge hvilket som helst av kravene 1 eller 2, som er en tablett.
- 20 4. Sammensetningen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 3 er en tablett med umiddelbar frigjøring.
5. Sammensetningen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 4, hvor den polyvinylalkohol-baserte polymer er en hydrolysert polyvinylalkohol-polymer, en delvis
25 hydrolysert polyvinylalkohol-polymer, en forestret polyvinylalkohol-polymer, en kopolymer derav med polyetylenglykol eller en blanding derav.
6. Sammensetningen ifølge krav 5, hvor den polyvinylalkohol-baserte polymer er en delvis hydrolysert polyvinylalkohol-polymer.
30
7. Sammensetningen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 6, hvor den polyvinylalkohol-baserte polymer er til stede i en mengde på 30 til 70 vekt% av det totale belegg.
- 35 8. Sammensetningen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 7, hvor belegget omfatter polyetylenglykol, propylenglykol, sorbitol, glycerol, maltitol, xylitol, mannitol, erytritol, glyceroltrioleat, tributylcitrat, trietylcitrat, trietylacetyl-trietylacetyl, glyceryltriacetat, stearinsyre, medium-kjedede triglyserider eller en blanding derav som mykningsmiddel.

9. Sammensetningen ifølge krav 8, hvor mykningsmidlet er polyetylenglykol.

10. Sammensetningen ifølge hvilket som helst av kravene 8 eller 9, hvor mykningsmidlet er i en mengde på 5 til 30 vekt% av det totale belegg.

5

11. Sammensetningen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 10, omfattende en fast dispersjon omfattende regorafenib.

12. Sammensetningen ifølge krav 11, omfattende regorafenib i en amorf tilstand og en farmasøytisk akseptabel matriks, hvor matriksen omfatter polyvinylpyrrolidon, vinylpyrrolidon/vinylacetat-kopolymer, polyalkylenglykol, hydroksyalkyl, hydroksyalkyl-metylcellulose, karboksymetylcellulose, natriumkarboksymetylcellulose, etylcellulose, polymetakrylater, polyvinylalkohol, polyvinylacetat, vinylalkohol/vinylacetat-kopolymer, polyglykoliserte glycerider, xantangummi, karragenan, chitosan, chitin, polydekstrin, dekstrin, stivelse, proteiner, sakkarose, laktose, fruktose, maltose, raffinose, sorbitol, laktitol, mannitol, maltitol, erytritol, inositol, trehalose, isomalt, inulin, maltodekstrin, β -cyklodekstrin, hydroksypropyl- β -cyklodekstrin eller sulfobutyleter-cyklodekstrin eller en blanding derav.

13. Sammensetningen ifølge hvilket som helst av kravene 11 til 12, omfattende regorafenib og matriks-middelet i et vektforhold på 1:0,5 til 1:20.

14. Sammensetningen ifølge hvilket som helst av kravene 11 til 13, omfattende regorafenib og polyvinylpyrrolidon, natrium-croscarmellose og/eller mikrokrySTALLinsk cellulose.

15. Sammensetningen ifølge krav 14, omfattende regorafenib og summen av natrium-croscarmellose og/eller mikrokrySTALLinsk cellulose i et vektforhold på 1:0,5 til 1:20.

30