



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2907506 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/16 (2006.01)
A61K 9/20 (2006.01)
A61K 31/4412 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2018.04.23
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2017.11.15
(86)	European Application Nr.	15161929.3
(86)	European Filing Date	2012.07.13
(87)	The European Application's Publication Date	2015.08.19
(30)	Priority	2011.07.19, MX, 2011007675
(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	CELL THERAPY AND TECHNOLOGY, S.A. DE C.V., Calzada de la Bombas n° 128 Bodega 1 Col. Ex-Hacienda Coapa Delegacion Coyoacan, CP 04980 Mexico, Federal District, MX-Mexico
(72)	Inventor	Armendariz Borunda, Juan, Av. Prolongacion Division del Norte No. 4280, Col.Prado Coapa,, C.P. 14300 Mexico, D.F., MX-Mexico Magaña Castro, José Augustin Rogelio, Av. Prolongacion Division del Norte No. 4280, Col.Prado Coapa,, C.P. 14300 Mexico, D. F., MX-Mexico Cervantes Guadarrama, Jorge, Av. Prolongacion Division del Norte No. 4280, Col.Prado Coapa,, C. P. 14300 Mexico, D.F., MX-Mexico
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 2003 Víka, 0125 OSLO, Norge

(54)	Title	METHOD FOR MANUFACTURING A PHARMACEUTICAL COMPOSITION IN THE FORM OF EXTENDED-RELEASE TABLETS CONTAINING PIRFENIDONE AND USE THEREOF IN THE REGRESSION OF CHRONIC RENAL INSUFFICIENCY, BREAST CAPSULAR CONTRACTURE AND HEPATIC FIBROSIS IN HUMANS
(56)	References Cited:	EP-A1- 1 356 816, US-A1- 2008 319 026, CN-A- 101 972 236, WO-A2-2007/038315

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. Farmasøytisk sammensetning i form av tablett med vedvarende frisetting, **karakterisert ved at** tablettene med vedvarende frisetting omfatter følgende kvantitative formel:

Forbindelse	Mengde
Pirfenidon	100, 200, 400 eller 600,0 mg
Mikrokrystallinsk cellulose	119,8 mg
Lavviskositets-HPMC	70,0 mg
Høyviskositets-HPMC	46,5 mg
Silisiumdioksid	8,5 mg
Natriumstearylfumarat	6,2 mg

2. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1, **karakterisert ved at** den farmasøytiske sammensetningen oppnås ved en fremgangsmåte omfattende følgende trinn:

Trinn 1. Pirfenidon og silisiumdioksid siktes gjennom en 30 mesh-sikt i den oscillerende granulatoren og plasseres i båndblanderen og blandes i 5 minutter;

Trinn 2. Mikrokrystallinsk cellulose, hydroksypropylmetylcellulose (HPMC) med lav viskositet og hydroksypropylmetylcellulose (HPMC) med høy viskositet siktes gjennom en 30 mesh-sikt i den oscillerende granulatoren og plasseres i båndblanderen i trinn 1 og blandes i 15 minutter;

Trinn 3. Natriumstearylfumarat siktes gjennom en 30 mesh-sikt i den oscillerende granulatoren og plasseres i båndblandemaskinen i trinn 1 og blandes i 3 minutter; og

Trinn 4. Det oppnådde granulatet formes til tablett i Stokes tablettmaskinen utstyrt med avlange stempler med følgende kompresjonsparametre: gjennomsnittlig vekt: 850 mg + 5 %; hardhet: maksimalt 10 kgF; sprøhet: lavere enn 1 %.

3. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge hvilke som helst av kravene 1 eller 2 for anvendelse i behandling av kronisk nyresvikt sekundært til primær glomerulosklerose.

4. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge hvilke som helst av kravene 1 eller 2 for anvendelse i behandling av deletære effekter ved brystkapselkontraktur.

5

5. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 4 for anvendelse i behandling av de deletære effektene ved brystkapselkontraktur observert etter kirurgisk implantasjon av brystimplantater hos mennesker.

10

6. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge hvilke som helst av kravene 1 eller 2 for anvendelse i behandling av hepatisk fibrose.

7. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 6, som har en anti-TNF- α - og anti-TGF- β 1-virkning for behandling av hepatisk fibrose.

15

8. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge hvilke som helst av kravene 1 til 7 for anvendelse i farmasøytisk behandling ved oral administrasjon av omtrent 600 mg til 2400 mg pirfenidon per dag.

20

9. Fremgangsmåte for fremstilling av en farmasøytisk sammensetning i form av tablett med vedvarende frisetting ifølge krav 1 omfattende 100, 200, 400 eller 600 mg pirfenidon, der fremgangsmåten omfatter følgende trinn:

Trinn 1. Pirfenidon og silisiumdioksid siktes gjennom en 30 mesh-sikt i den oscillerende granulatoren og plasseres i båndblanderen og blandes i 5 minutter;

25

Trinn 2. Mikrokrystallinsk cellulose, hydroksypropylmetylcellulose (HPMC) med lav viskositet hydroksypropylmetylcellulose (HPMC) og med høy viskositet siktes gjennom en 30 mesh-sikt i den oscillerende granulatoren og plasseres i båndblanderen i trinn 1 og blandes i 15 minutter;

30

Trinn 3. Natriumstearylfumarat siktes gjennom en 30 mesh-sikt i den oscillerende granulatoren og plasseres i båndblanderen i trinn 1 og blandes i 3 minutter; og

Trinn 4. Det oppnådde granulatet formes til tablett i Stokes tablettmaskinen utstyrt med avlange stempler med følgende kompresjonsparametre: gjennomsnittlig vekt: 850 mg + 5 %; hardhet: maksimalt 10 kgF; sprøhet: lavere enn 1 %.

35