



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3079671 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/20 (2006.01)
A61K 31/56 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2018.02.26
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2017.10.25
(86)	European Application Nr.	14814804.2
(86)	European Filing Date	2014.12.10
(87)	The European Application's Publication Date	2016.10.19
(30)	Priority	2013.12.12, EP, 13196904
(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	Donesta Bioscience B.V., Boslaan 11, 3701 CH Zeist, NL-Nederland
(72)	Inventor	PLATTEEUW, Johannes Jan, Newtonplein 41, NL-5283 JH Boxtel, NL-Nederland COELINGH BENNINK, Herman Jan Tijmen, Boslaan 11, NL-3701 CH Zeist, NL-Nederland
(74)	Agent or Attorney	Zacco Denmark A/S, Arne Jacobsens Allé 15, DK-2300 KØBENHAVN S, Danmark

(54)	Title	ORALLY DISINTEGRATING SOLID DOSAGE UNIT CONTAINING AN ESTETROL COMPONENT
------	-------	---

(56)	References Cited:	US-A1- 2004 198 671, COELINGH BENNINK ET AL: "Ovulation inhibition by estetrol in an in vivo model", CONTRACEPTION, GERON-X, INC., LOS ALTOS, CA, US, vol. 77, no. 3, 22 January 2008 (2008-01-22), pages 186-190, XP022477670, ISSN: 0010-7824, DOI: 10.1016/J.CONTRACEPTION.2007.11.014, US-A1- 2007 286 819
------	----------------------	---

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. Oralt desintegrerende fast farmasøytisk doseringsenhet med en vekt på mellom 50 og 1000 mg, der doseringsenheten består av:

- 4-95 vekt-% granuler bestående av:
 - 3-80 vekt-% av en estetrolbestanddel valgt fra estetrol, estetrolestere og kombinasjoner derav;
 - 20-97 vekt-% C₄-C₁₂-sukkeralkohol;
 - 0-45 vekt-% av én eller flere andre farmasøytisk akseptable ingredienser;
 - 5-96 vekt-% av én eller flere farmasøytisk akseptable eksipienter;
- der den faste doseringsenheten omfatter minst 0,1 mg av estetrolbestanddelen.

2. Den faste doseringsenheten ifølge krav 1, hvori estetrolbestanddelen er estetrol, foretrukket vannfri estetrol.

3. Den faste doseringsenheten ifølge krav 1 eller 2, hvori granulene representerer mellom 5 og 90 vekt-% av doseringsenheten.

4. Den faste doseringsenheten ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori granulene har en volumvektet gjennomsnittlig størrelse på mellom 30 og 200 µm, foretrukket mellom 40 og 150 µm.

5. Den faste doseringsenheten ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori C₄-C₁₂-sukkeralkohlen er valgt fra mannitol, erytritol, isomalt og kombinasjoner derav.

6. Den faste doseringsenheten ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori den ene eller de flere farmasøytisk akseptable eksipientene omfatter minst 30 vekt-% av den ene eller de flere farmasøytisk akseptable eksipientene av partikler inneholdende et desintegrerende middel dispergert i en matriks inneholdende C₄-C₆-sukkeralkohol.

7. Den faste doseringsenheten ifølge krav 6, hvori partiklene inneholder 10-50 vekt-% desintegrerende middel og 40-90 vekt-% C₄-C₆-sukkeralkohol.

8. Den faste doseringsenheden ifølge krav 7, hvori det desintegrerende middelet er valgt fra krysspovidon, hydroksypropylcellulose, krysskarmellosenatrium og krystallinsk cellulose og kombinasjoner derav

5 **9.** Den faste doseringsenheden ifølge et hvilket som helst av kravene 6-8, hvori C₄-C₆-sukkeralkoholen er valgt fra mannitol, xylitol og kombinasjoner derav.

10. Den faste doseringsenheden ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori doseringsenheden inneholder 0,05-10 mg progestogen.

10

11. Den faste doseringsenheden ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene for anvendelse i medisinsk behandling eller for anvendelse i hormonerstatningsterapi hos kvinner, der anvendelsen omfatter sublingual, bukkal eller sublabial administrering av doseringsenheden.

15

12. Den faste doseringsenheden for anvendelse ifølge krav 11, der anvendelsen omfatter administrering én gang daglig over en periode på minst 1 uke.

20

13. Fremgangsmåte for prevensjon for kvinner, der fremgangsmåten omfatter sublingual, bukkal eller sublabial administrering av en doseringsenhet ifølge et hvilket som helst av kravene 1-10.

14. Fremgangsmåten ifølge krav 13, der fremgangsmåten omfatter administrering én gang daglig over en periode på minst 1 uke.

25

15. Fremgangsmåte for å fremstille den faste doseringsenheden ifølge et hvilket som helst av kravene 1-10, der fremgangsmåten omfatter trinnene:

30

- å tilveiebringe en varm pumpbar blanding av estetrolbestanddelen, C₄-C₁₂-sukkeralkoholen og den eventuelle ene eller flere andre farmasøytisk akseptable ingredienser, der den varme pumpbare blandingen har en temperatur på minst 105 °C;

- å avkjøle den varme pumpbare blandingen for å gjøre C₄-C₁₂-sukkeralkoholen fast og bryte opp den pumpbare blandingen før eller etter avkjølingen for å frembringe faste granuler;

35

- å blande granulene med den ene eller de flere farmasøytisk akseptable eksipientene; og

- å forme blandingen til en fast doseringsenhet.

16. Fremgangsmåten ifølge krav 15, hvori den pumpbare blandingen har en temperatur på minst 160 °C, foretrukket på 180 til 240 °C.

5 **17.** Fremgangsmåten ifølge krav 15 eller 16, hvori den varme pumpbare blandingen utsettes for spraykjøling for å frembringe de faste granulene.