



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3087989 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

A61K 31/7048 (2006.01) A61K 47/14 (2017.01)
A61K 9/20 (2006.01) A61K 47/26 (2006.01)
A61K 47/02 (2006.01) A61K 47/32 (2006.01)
A61K 47/10 (2017.01) A61K 47/36 (2006.01)
A61K 47/12 (2006.01) A61K 47/38 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2019.03.18
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.12.19
(86)	European Application Nr.	14874030.1
(86)	European Filing Date	2014.12.26
(87)	The European Application's Publication Date	2016.11.02
(30)	Priority	2013.12.27, JP, 2013273060
(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	Chugai Seiyaku Kabushiki Kaisha, 5-1, Ukima 5-chome, Kita-kuTokyo 115-8543, Japan
(72)	Inventor	WADA, Kenta, c/o Chugai Seiyaku Kabushiki Kaisha5-1 Ukima 5-chomeKita-ku, Tokyo 115-8543, Japan HIRAYAMA, Tomoaki, c/o Chugai Pharma Manufacturing Co. Ltd.2500 Takayanagi, Fujieda-shiShizuoka 426-0041, Japan SAKAI, Kenichi, c/o Chugai Seiyaku Kabushiki Kaisha5-1 Ukima 5-chomeKita-ku, Tokyo 115-8543, Japan YOSHIMURA, Shiho, c/o Chugai Seiyaku Kabushiki Kaisha5-1 Ukima 5-chomeKita-ku, Tokyo 115-8543, Japan
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54) Title **SOLID PREPARATIONS COMPRISING TOFOGLIFLOZIN AND METHOD FOR PRODUCING THE SAME**

(56) References
Cited:

WO-A1-2006/080421, WO-A1-2012/107476, WO-A1-2014/161836, SHUJI KITAGAWA BASIC YAKUGAKU KYOKASHO SERIES 20 YAKUZAIGAKU 10 April 2013, pages 87 - 88 , 113, XP008183775, MITSUO MATSUMOTO ET AL. YAKUZAIGAKU MANUAL vol. 89, 20 March 1989, pages 107 - 108, XP008183774, WO-A1-2009/154276, WO-A1-2012/115249, RINSHO SHIKEN JOHO: 'JapicCTI-101349' 14 November 2012, XP055355937 Retrieved from the Internet: <URL:http://www.clinicaltrials.jp/user/cteD etail. jsp?clinicalTrialId=8116> [retrieved on 2015-03-04], 'Apleway 20mg Tablets' KANJA MUKE IYAKUHIN GUIDE May 2014, XP008183978 Retrieved from the Internet: <URL:http://e-mr.sanofi.co.jp/di/pg/apleway.pdf?date=2014060 3163 444> [retrieved on 2015-03-04]

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/>

P A T E N T K R A V

1. Fremgangsmåte for fremstilling av en farmasøytisk sammensetning som er en tablett som omfatter tofogliflozin som en aktiv bestanddel, hvor fremgangsmåten
5 omfatter:
blanding av et additiv og tofogliflozin for å fremstille en pulverblanding, og
oppnåelse av en tablett fra pulverblandingen ved direkte komprimering,
hvor additivet omfatter minst ett fyllstoff.
- 10 2. Fremgangsmåte ifølge krav 1, hvor fyllstoffet er valgt fra gruppen bestående av
maisstivelse, potetstivelse, hvetestivelse, risstivelse, delvis alfa-stivelse, alfa- stivelse,
laktosehydrat, fruktose, glukose, mannitol, vannfritt dibasisk kalsiumfosfat,
krystallinsk cellulose og kalsiumkarbonatpresipitat.
- 15 3. Fremgangsmåte ifølge krav 1 eller 2, hvor additivet videre omfatter minst ett
desintegreringsmiddel.
4. Fremgangsmåte ifølge krav 3, hvor desintegreringsmiddelet er valgt fra
gruppen bestående av natriumstivelseglykolat, karboksymetylcellulose,
20 karboksymetylcellulosekalsium, karboksymetylstivelsenatrium, krysskarmellose-
natrium, krysspovidon, lavsubstituert hydroksypropylcellulose og
hydroksypropylstivelse.
5. Fremgangsmåte ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, hvor additivet
25 videre omfatter minst ett smøremiddel.
6. Fremgangsmåte ifølge krav 5, hvor smøremidlet er valgt fra gruppen bestående
av magnesiumstearat, kalsiumstearat, talkum, sukrosefettsyreester,
natriumstearylfumarat og hydrogenert olje.
- 30 7. Fremgangsmåte ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6, hvor
sammensetningen er i det vesentlige fri for kalsiumsilikat.
8. Fremgangsmåte ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7, hvor tofogliflozin
35 omfatter en krystallform I, en krystallform II, en krystallform III, en ko-krystall med
natriumacetat, en ko-krystall med kaliumacetat, en amorf form eller en blanding

derav.

9. Fremgangsmåte ifølge krav 8, hvor tofogliflozin omfatter en krystallform I, en krystallform II, en amorf form eller en blanding derav.

5

10. Fremgangsmåte ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 9, hvor et vektforhold av den aktive bestanddelen tofogliflozin varierer fra 2,5 til 40 vekt% i forhold til totalvekten av sammensetningen.

10

11. Fremgangsmåte ifølge et hvilket som helst av kravene 5 til 10, hvor et vektforhold av smøremidlet varierer fra mindre enn 4,0 vekt% av totalvekten av sammensetningen.

15

12. Fremgangsmåte ifølge et hvilket som helst av kravene 3 til 11, hvor et vektforhold av fyllstoffet varierer fra 20 til 80 vekt% av totalvekten av sammensetningen og et vektforhold av desintegreringsmiddelet varierer fra 1,0 til 4,0 vekt% av totalvekten av sammensetningen.

20

13. Fremgangsmåte ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 12, hvor additivet omfatter laktosehydrat, krystallinsk cellulose, krysskarmellosenatrium og hydrogenert olje og/eller magnesiumstearat.

25

14. Farmasøytisk sammensetning som er en tablett fremstilt ved fremgangsmåten ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 13.

15. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 14, som omfatter tofogliflozin som en aktiv bestanddel, laktosehydrat, krystallinsk cellulose, krysskarmellosenatrium og hydrogenert olje og/eller magnesiumstearat.

30