



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3125872 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/20 (2006.01)
A61K 9/14 (2006.01)
A61K 9/16 (2006.01)
A61K 9/30 (2006.01)
A61K 31/335 (2006.01)
A61K 31/337 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2019.11.18
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.08.14
(86)	European Application Nr.	15773354.4
(86)	European Filing Date	2015.03.20
(87)	The European Application's Publication Date	2017.02.08
(30)	Priority	2014.03.31, WO, PCT/KR14/002734
(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	Hanmi Pharm. Co., Ltd., 214 Muha-ro Paltan-myeon Hwaseong-si, Gyeonggi-do 445-910, Sør-Korea
(72)	Inventor	SRINIVASAN, Shanmugam, 1-408 1034 Dongtanwoncheon-ro, Yeongtong-guSuwon-siGyeonggi-do 443-802, Sør-Korea IM, Ho Taek, 117-1204 27 Yonggu-daero 2394beon-gil, Giheung-guYongin-siGyeonggi-do 446-557, Sør-Korea YOON, Young Su, 302-ho 16 Daeheung-ro 24ra-gil, Mapo-guSeoul 121-870, Sør-Korea KIM, Yong Il, 147-2201 57 Hwasan-ro, Paldal-guSuwon-siGyeonggi-do 442-872, Sør-Korea PARK, Jae Hyun, 311-404 460 Yeongtong-ro, Yeongtong-guSuwon-siGyeonggi-do 443-737, Sør-Korea WOO, Jong Soo, 120-2303 85 Hwasan-ro, Jangan-guSuwon-siGyeonggi-do 440-710, Sør-Korea
(74)	Agent or Attorney	TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

(54)	Title	AMORPHOUS SOLID DISPERSION COMPRISING TAXANE, TABLET COMPRISING THE SAME, AND METHOD FOR PREPARING THE SAME
------	-------	--

(56) References

Cited:

US-A1- 2002 041 896

US-A1- 2008 160 095

WO-A2-2010/020799

WO-A1-2007/073389

KAWAKAMI, K. ET AL.: 'Microemulsion formulation for enhanced absorption of poorly soluble drugs: I. Prescription design' JOURNAL OF CONTROLLED RELEASE vol. 81, no. 1-2, 2002, ISSN 0168-3659 pages 65 - 74, XP004351104

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

- 5 **1.** Amorf fast dispersjon omfattende et taksan eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, polyvinylpyrrolidon, polysorbat og natriumlaurylsulfat.
- 10 **2.** Den amorfe faste dispersjonen ifølge krav 1, hvori taksanet er et hvilket som helst valgt fra gruppen som består av paklitaksel, docetaksel, cabazitaksel, larotaksel, ortataksel, tesetaksel, og en kombinasjon derav, hvor taksanet fortrinnsvis er paklitaksel.
- 3.** Den amorfe faste dispersjonen ifølge krav 1, hvori polyvinylpyrrolidonet er polyvinylpyrrolidon K-30.
- 15 **4.** Den amorfe faste dispersjonen ifølge krav 1, hvori vektforholdet mellom polyvinylpyrrolidonet og taksanet er i området 3:1 til 9:1 og fortrinnsvis 2,5:1 til 3,5:1.
- 5.** Den amorfe faste dispersjonen ifølge krav 1, hvori polysorbatet er polysorbat 80.
- 20 **6.** Den amorfe faste dispersjonen ifølge krav 1, hvori vektforholdet mellom polysorbat og natriumlaurylsulfat er 1:5 til 5:1.
- 7.** Den amorfe faste dispersjonen ifølge krav 1, hvori vektforholdet mellom taksanet og den kombinerte vekten av polysorbat og natriumlaurylsulfat er 1:1 til 1:3.
- 25 **8.** Den amorfe faste dispersjonen ifølge krav 1, hvori vektforholdet mellom den kombinerte vekten av polysorbat og natriumlaurylsulfat og polyvinylpyrrolidonet er 1:1 til 1:5.
- 30 **9.** Den amorfe faste dispersjonen ifølge krav 1, hvori polyvinylpyrrolidonet er i en mengde fra 10 til 80 vekt-% og mer foretrukket fra 40 til 60 vekt-%, basert på den totale mengden av den faste dispersjonen.
- 35 **10.** Den amorfe faste dispersjonen ifølge krav 1, hvori den kombinerte vekten av polysorbat og natriumlaurylsulfat er 10 til 50 vekt-% og mer foretrukket 30 til 40 vekt-%, basert på den totale mengden av den faste dispersjonen.

11. Den amorfe faste dispersjonen ifølge krav 1, hvori vektforholdet mellom polyvinylpyrrolidonet og taksanet er ca. 3:1 og vektforholdet mellom taksanet og den kombinerte vekten av polysorbat og natriumlaurylsulfat er ca. 1:2.

5 **12.** Tablett omfattende den amorfe faste dispersjonen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 11, en intragranulær eksipiens og en ekstragranulær eksipiens.

10 **13.** Tabletten ifølge krav 12, hvori den amorfe faste dispersjonen er i en mengde fra 15 til 50 vekt-% og mer foretrukket på 20 til 30 vekt-%, basert på den totale vekten av tabletten.

15 **14.** Tabletten ifølge krav 12, hvori de intragranulære og ekstragranulære eksipiensene hver velges fra gruppen som består av fyllstoffer, desintegreringsmidler, smøremidler, overflateaktive midler og en blanding derav.

15. Tabletten ifølge krav 12, hvori:

(1) den intragranulære eksipiensen velges fra gruppen som består av mikrokrySTALLINSK cellulose, kryskarmellosenatrium, natriumlaurylsulfat og en blanding derav; og/eller

20 (2) den ekstragranulære eksipiensen velges fra gruppen som består av mikrokrySTALLINSK cellulose, kryskarmellosenatrium, natriumstearylfumarat og en blanding derav.

16. Fremgangsmåte for å fremstille den amorfe faste dispersjonen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 11, omfattende trinnene:

25 (a) å oppløse et taksan eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, polyvinylpyrrolidon, polysorbat og natriumlaurylsulfat i et løsningsmiddel; og

(b) å tørke løsningen oppnådd i trinn (a).

17. Fremgangsmåte for å fremstille tabletten ifølge et hvilket som helst av kravene 12 til 15, omfattende trinnene:

30 (a) å oppløse et taksan eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, polyvinylpyrrolidon, polysorbat og natriumlaurylsulfat i et løsningsmiddel;

(b) å tørke løsningen oppnådd i trinn (a) for å produsere en fast dispersjon;

(c) å blande den faste dispersjonen sammen med en ekstragranulær eksipiens; og

(d) å komprimere den resulterende blandingen for å danne en tablett.

35

18. Fremgangsmåten ifølge krav 16 eller krav 17, hvori trinn (b) omfatter spraytørking, fortrinnsvis i et fluidsiktig og mer foretrukket i et fluidsiktig omfattende en intragranulær

eksipiens.

19. Fremgangsmåten ifølge krav 16, hvori taksanet løses opp i et organisk løsningsmiddel.

5

20. Fremgangsmåten ifølge krav 16 eller krav 17, hvori polyvinylpyrrolidonet, polysorbatet og natriumlaurylsulfatet løses opp i et vandig organisk løsningsmiddel, hvor det vandige organiske oppløsningsmidlet fortrinnsvis omfatter en blanding av etanol og vann.