



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3130334 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/30 (2006.01)
A61J 3/00 (2006.01)
A61K 9/24 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2023.04.11
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.02.15
(86)	European Application Nr.	15776295.6
(86)	European Filing Date	2015.04.08
(87)	The European Application's Publication Date	2017.02.15
(30)	Priority	2014.04.08, CN, 201410139563
(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	Overseas Pharmaceuticals, Ltd., Room 201, Building C1, No. 11 Kaiyuan Avenue Huangpu District, Guangzhou, Guangdong Province, China 510530, Kina
(72)	Inventor	Wen, Xiaoguang, Room 1210 Building D National New Drug Innovation Base No.1 Yaocheng Ave., Taizhou, Jiangsu 225300, Kina
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54)	Title	CONTROLLED-RELEASE SOLID PREPARATION WITH PARTIAL COATING
(56)	References Cited:	EP-A2- 0 788 790 WO-A1-96/07401 WO-A1-96/19201 CN-A- 102 614 141 WO-A1-2009/002846 WO-A2-2005/013935 WO-A1-2008/006216

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. Et fast preparat med kontrollert frigjøring, er en tablett og består av en indre kjerne og et belegglag, den indre kjernen inneholder aktiv medisin og adjuvanter, belegglaget inneholder materiale med forsinket frigjøring/kontrollert frigjøring og belegglaget inneholder eller inneholder ikke aktiv medisin, **karakterisert ved at**, belegglaget er fremstilt ved kompresjonsbeleggingsmetode, toppoverflaten av den indre kjernen er ikke belagt med belegglaget, men eksponert til overflaten av fast preparat, og bunnen og sideoverflatene til nevnte indre kjerne er belagt med belegningsmaterialer, den aktive medisinen ved at den indre kjernen frigjøres bare gjennom den øvre overflaten, og

hvor i materialet med forsinket frigjøring/kontrollert frigjøring inneholdt i belegglaget er vannuløselig materiale, det vannoppløselige materialet er valgt fra en eller flere av gruppen bestående av etylcellulose, celluloseacetatpolymer, akrylharpiks, hvor i belegglaget også inneholder et vannløselig poredannende middel, som er valgt fra en eller flere av gruppen bestående av povidon, laktose, natriumklorid.

2. Fast preparat ifølge krav 1, hvor i den indre kjernen er ett lag eller flere lag, og laget er laget med forsinket frigjøring, eller inneholder både lag med hurtig frigjøring og lag med forsinket frigjøring; når den indre kjernen er to eller flere lag, frigjøres komponenter av forskjellige lag i rekkefølge: det ytterste laget frigjøres først, deretter frigjøres det sekundære ytre laget, til sist frigjøres komponenten av det innerste laget av indre kjerne.

3. Fast preparat ifølge hvilket som helst av kravene 1-3, det er et annet belegglag på den ytre overflaten av belegglaget, det andre belegglaget inneholder eller inneholder ikke aktive ingredienser.

4. Fremgangsmåte for fremstilling av det faste preparatet ifølge hvilket som helst av kravene 1-3, tablettpressing utføres i tablettpressemaskin med følgende trinn:

- a) blande alle komponentene for å klargjøre tablettkjernen, og den første pressingen utføres ved å bruke modellnummer I hullestempel for å oppnå tablettkjernen;
- b) modellnummer II hullestempel brukes til å erstatte modellnummer I hullestempel og, etter å ha blandet alle komponentene for å forberede tablettbelegglaget, fylle midtmodulen;
- c) fylling av tablettkjernen fremstilt i trinn a) i midten av midtmodulen og utførelse av den andre pressingen, og det faste preparatet oppnås;

diameteren til nevnte modellnummer I hullestempelet er mindre enn den til modellnummer II hullestempelet.

5. Fremgangsmåten for fremstilling ifølge krav 4, hvor i trinn b) og c) er som følger: etter at modellnummer I hullestempelet er erstattet med modellnummer II hullestempelet, fylles tablettkjerne fremstilt i trinn 1) først i midten av midten modul, og deretter fylles de jevnt blandede belegglagskomponentene rundt tablettkjernen i midtmodulen for å utføre den andre pressingen for å lage bunnflaten og siden av den indre kjernen belagt med beleggmateriale.

6. Fast preparat ifølge krav 1, hvor i den indre kjernen har to lag; komponenter av forskjellige lag frigjøres i rekkefølge: det ytterste laget frigjøres først, deretter frigjøres det innerste laget; det ytterste laget er laget med forsinket frigjøring; det innerste laget er et lag med hurtig frigjøring;

komponenter og innhold av nevnte forsinket frigjøringslag per 1000 tabletter er som følger: prednisolonacetat 20 g, hydroksypropylmetylcellulose K4M 60 g, laktose 116 g, magnesiumstearat 2 g, mikropulver silikagel 2 g;
komponenter og innhold av nevnte hurtigfrigjørende lag per 1000 tabletter er som følger: prednisolonacetat 10 g, laktose 40 g, mikrokrySTALLinsk cellulose 44 g, tverrbundet natriumkarboksymetylcellulose 5 g, sitrongult 0,3 g, magnesiumstearat 0,7 g;
komponenter og innhold av nevnte belegglag i per 1000 tabletter er som følger: etylcellulose 390 g, laktose 100 g, magnesiumstearat 5 g, mikropulver silikagel 5 g.

7. Fast preparat ifølge krav 1, hvori den indre kjernen har to lag; komponenter av forskjellige lag frigjøres i rekkefølge: det ytterste laget frigjøres først, deretter frigjøres det innerste laget; det ytterste laget er forsinket frigjøringslag 1; det innerste laget er forsinket frigjøringslag 2;

komponenter og innhold av nevnte forsinket frigjøringslag 1 i per 1000 tabletter er som følger: Lamotrigin 30 g, hydroksypropylmetylcellulose K4M 37,5 g, laktose 79,5 g, magnesiumstearat 1,5 g, mikropulver silikagel 1,5 g;
komponenter og innhold av nevnte forsinket frigjøringslag 2 i per 1000 tabletter er som følger: Lamotrigin 30 g, hydroksypropylmetylcellulose K100LV 52,5 g, laktose 66 g, naturlig matfarge 0,15 g, magnesiumstearat 1,05 g;
komponenter og innhold av belegglaget per 1000 tabletter er som følger: etylcellulose 390 g, laktose 100 g, magnesiumstearat 5 g, mikropulver silikagel 5 g.

8. Fast preparat ifølge krav 1, hvori den indre kjernen har tre lag; det ytterste laget frigjøres først, så frigjøres det sekundære ytre laget, til sist frigjøres komponenten av det innerste laget av indre kjerne,

nevnte faste preparat består også av filmbelegglag, nevnte filmbelegglag som det ytterste laget av nevnte faste preparat;
komponenter og innhold i det ytterste laget i per 1000 tabletter er som følger: ropinirolhydroklorid 0,5 g, hydroksypropylmetylcellulose K100LV 20 g, mikrokrySTALLinsk cellulose 15 g, laktose 61,5 g, magnesiumstearat 1,5 g, mikropulver silikagel 1,5 g;
komponenter og innhold av det sekundære ytre laget per 1000 tabletter er som følger: ropinirolhydroklorid 0,5 g, hydroksypropylmetylcellulose K100LV 35 g, laktose 62,5 g, magnesiumstearat 1,5 g, mikropulver silikagel 1,5 g;
komponenter og innhold av det innerste laget per 1000 tabletter er som følger: ropinirolhydroklorid 0,5 g, hydroksypropylmetylcellulose K100LV 25 g, mikrokrySTALLinsk cellulose 72,5 g, magnesiumstearat 1 g, mikropulver silikagel 1 g;
komponenter og innhold av nevnte belegglag per 1000 tabletter er som følger: duloksetinhydroklorid 50 g, etylcellulose 340 g, laktose 100 g, magnesiumstearat 5 g, mikropulver silikagel 5 g;
komponenter og innhold av nevnte filmbelegglag per 1000 tabletter er som følger: ropinirolhydroklorid 0,25 g, Opadry K295 beleggpulver 15,75 g.