



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3157508 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/107 (2006.01)
A61K 9/16 (2006.01)
A61K 9/20 (2006.01)
A61K 9/48 (2006.01)
A61K 31/58 (2006.01)
A61K 47/14 (2017.01)
A61K 47/44 (2017.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.04.19
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.12.09
(86)	European Application Nr.	15729188.1
(86)	European Filing Date	2015.06.17
(87)	The European Application's Publication Date	2017.04.26
(30)	Priority	2014.06.19, EP, 14173067
(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	Solural Pharma Aps, Energivej 42, 2750 Ballerup, Danmark
(72)	Inventor	HØJGAARD, Bent, Morelvænget 5, DK-3450 Allerød, Danmark
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54)	Title	SOLID ORAL DOSAGE FORM OF LIPOPHILIC COMPOUNDS
(56)	References Cited:	WO-A1-95/24893 US-A1- 2011 160 168 US-A1- 2013 303 495 WO-A1-2014/096139 WO-A1-00/09093

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. Fast oral doseringsformsammensetning omfattende en lipofil forbindelse som har en log P på minst 5, og en vehikkel, hvori vehikkelen omfatter (a) en fettkomponent i en mengde
5 på minst 700 mg tilstrekkelig til å oppnå lymfatisk absorpsjon i et pattedyr, hvori fettkomponenten velges fra et mono- og et tri-glyserid av langkjedede fettsyrer, hvori de langkjedede fettsyrene i monoglyseridene velges fra fettsyrekjeder som har fra 14 til 24 karbonatomer og de langkjedede fettsyrene i triglyseridene velges fra fettsyrekjeder som har fra 14 til 24 karbonatomer, hvori vektforholdet mellom triglyserider og monoglyserider er i et
10 område fra 2,8:1 til 1:5, og (b) et hydrofilt overflateaktivt middel hvori vektforholdet (a):(b) er fra 10:1 til 1:2.
2. Sammensetningen ifølge krav 1, hvori fettkomponenten omfatter et monoglyserid og et triglyserid av langkjedede fettsyrer, hvori vektforholdet mellom triglyserider og
15 monoglyserider er i et område fra 2:1 til 1:3.
3. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori sammensetningen utviser en $AUC(0-\infty)$ (fastet) / $AUC(0-\infty)$ (matet)) på minst 0,8.
- 20 4. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori vektforholdet mellom (a):(b) er i området fra 4:1 til 1:2.
5. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori de langkjedede fettsyrene i monoglyseridene velges fra linolensyre, oljesyre, palmitinsyre,
25 linolsyre eller stearinsyre.
6. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene 1–5, hvori de langkjedede fettsyrene i triglyseridene velges fra linolensyre, oljesyre, palmitinsyre, linolsyre eller stearinsyre.
30
7. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene 1–6, hvori fettkomponenten omfattende et triglyserid av langkjedede fettsyrer velges fra en naturlig avledet olje.

8. Sammensetningen ifølge krav 7, hvori den naturlig avlede olje velges fra soyabønneolje, olivenolje, sesamolje, saflorolje, peanøttolje, rapsolje, solsikkeolje, kokosnøttolje, maisolje, solsikkeolje, bomullsfrøolje, palmeolje, arakidisolje eller en hvilken som helst kombinasjon derav.

5

9. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori fettkomponenten velges fra olivenolje, soyabønneolje, blandinger av olivenolje og glyserolmonooleat, og blandinger av soyabønneolje og glyserolmonooleat.

10 **10.** Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori vehikkelen er selvemulgerende.

11. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori sammensetningen, ved fortynning i renset vann, danner dråper som har en d50 på mindre enn 200 mikrometer, slik som mindre enn 40 mikrometer, slik som mindre enn 20 mikrometer, mindre enn 10 mikrometer eller mindre enn 5 mikrometer.

12. Sammensetningen ifølge krav 1, som velges fra en granul, en kapsel eller tablett.

20 **13.** Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori det hydrofile overflateaktive midlet velges fra hydrogenerte ricinusoljeetoksylater, polysorbater eller et hvilket som helst annet hydrofilt overflateaktivt middel med en hydrofil-lipofil balanse (HLB)-verdi på 10 eller høyere, og en hvilken som helst kombinasjon derav.

25 **14.** Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori den lipofile forbindelsen velges fra abirateronacetat, acitretin, allylestrenol, alfa-tokoferol, amidaron, aprepitant, atorvastatin, beksaroten, bromokriptin, kandesartan, cinacalcet, klomifen, diethylstilbestrol, dihomogamma-linolsyre, ebastin, ergokalsiferol, fenofibrat, fusidinsyre, halofantrin, irbesartan, isotretinoin, itrakonazol, lapatinib, liraglutid, loratidin, nandrolondekanoat, nelfinavir, olmesartan, orlistat, posakonazol, probukol, raloksifen, ritonavir, tamoksifen, telmisartan, teprenon, tipranavir, valsartan og zuklopentiksol.

30

15. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori den lipofile forbindelsen velges fra en forbindelse som er modifisert ved festing av en lipofil del for

å øke lipofiliteten til den lipofile forbindelsen til minst $\log P$ på minst 5, noe som gjør den egnet for lymfatisk opptak.

- 5 **16.** Sammensetningen ifølge krav 15, hvori den lipofile forbindelsen velges fra paklitakselprodrugs, slik som dokosaheksaenoat, paklitakselundekanoat, paklitakseloleat og paklitakselstearat; oktreotid kovalent festet til en fettsyre med minst 20 karbonatomer i en amiddannelse; leuprolid kovalent festet til en fettsyreester via den alifatiske eller aromatiske hydroksylgruppen til stede i peptidet; og propofol kovalent festet til en fettsyreester via den fenoliske aromatiske hydroksygruppen.