



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3542792 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

A61K 9/48 (2006.01)

A61K 31/593 (2006.01)

A61K 47/06 (2006.01)

A61K 47/14 (2017.01)

A61K 47/44 (2017.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2023.10.16
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.06.28
(86)	European Application Nr.	19172946.6
(86)	European Filing Date	2008.04.25
(87)	The European Application's Publication Date	2019.09.25
(30)	Priority	2007.04.25, US, 91385307 P
(84)	Designated Contracting States:	AT ; BE ; BG ; CH ; CY ; CZ ; DE ; DK ; EE ; ES ; FI ; FR ; GB ; GR ; HR ; HU ; IE ; IS ; IT ; LI ; LT ; LU ; LV ; MC ; MT ; NL ; NO ; PL ; PT ; RO ; SE ; SI ; SK ; TR
(73)	Proprietor	EirGen Pharma Ltd., Westside Business Park Old Kilmeaden Road, Waterford X91 YV67, Irland Opko Renal, LLC, 4400 Biscayne Boulevard, Miami, FL 33137, USA
(72)	Inventor	Bishop, Charles W., 801 S Miami Avenue Unit 5101-10, Miami, FL 33130, USA Tabash, Samir P., 131 Toscana Drive, Whitby, Ontario L1R 2Z9, Canada Agudoawu, Sammy A., 3123 Cabano Crescent, Mississauga, Ontario L5M 0C5, Canada White, Jay A., 194 Stellick Avenue, Newmarket, Ontario L3X 1T3, Canada Crawford, Keith H., 610 N Pines Trl., Parker, CO 80138, USA Messner, Eric J., 1308 Edgewood Road, Lake Forest, IL Illinois 60045, USA Petkovich, P. Martin, 35 Lakeland Point Drive, Kingston, Ontario K7M 4E8, Canada
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54) Title **CONTROLLED RELEASE 25-HYDROXYVITAMIN D**

(56) References

Cited: WO-A-91/12807
 US-A1- 2004 101 554
 WO-A-03/047595
 WO-A-03/039521

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. En farmasøytisk sammensetning som omfatter en oral formulering av 25-hydroksyvitamin D₃ for bruk i en fremgangsmåte for behandling av sekundær hyperparatyreose hos en menneskelig pasient med kronisk nyresykdom,

hvor i fremgangsmåten for behandling omfatter administrering av sammensetningen til pasienten, hvor i pasienten behandles uten å forårsake suprafysiologiske stigninger i blodnivåer av 25-hydroksyvitamin D₃, og hvor i den farmasøytiske sammensetningen omfatter 25-hydroksyvitamin D₃ sammen med et frigjøringsmodifiserende middel som kontrollerer frigjøringshastigheten til vitamin D-forbindelsen fra doseringsformen for å redusere C_{max} og/eller forsinke T_{max} og/eller redusere C_{max24 timer}/C_{24 timer}.

2. Farmasøytisk sammensetning for bruk i en fremgangsmåte for behandling ifølge krav 1, hvor i pasienten har stadium 3 eller stadium 4 kronisk nyresykdom.

3. Farmasøytisk sammensetning for bruk i en fremgangsmåte for behandling ifølge krav 1 eller 2, hvor i pasienten har kronisk nyresykdom assosiert med en glomerulær filtreringshastighet under 60 ml/min/1,73m².

4. Farmasøytisk sammensetning for bruk i en fremgangsmåte for behandling ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, hvor i pasienten som skal behandles har lave serum totalt 25-hydroksyvitamin D-nivåer ved behandlingsstart.

5. Farmasøytisk sammensetning for bruk i en fremgangsmåte for behandling ifølge krav 4, hvor i pasienten som skal behandles har serum totalt 25-hydroksyvitamin D-nivåer på mindre enn 30 ng/ml ved behandlingsstart.

6. Farmasøytisk sammensetning for bruk i en fremgangsmåte for behandling ifølge krav 4 eller 5, hvor i fremgangsmåten for behandling omfatter å administrere sammensetningen til pasienten slik at 25-hydroksyvitamin D-tilstrekkelighet og/eller mangel hos pasienten behandles uten å forårsake suprafysiologiske økninger i blodnivåer av 25-hydroksyvitamin D₃.

7. Farmasøytisk sammensetning for bruk i en fremgangsmåte for behandling ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, hvor i pasienten er et voksent menneske.

8. Farmasøytisk sammensetning for bruk i en fremgangsmåte for behandling ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, hvor i det frigjøringsmodifiserende middelet er et magesaftresistent belegg.

9. Farmasøytisk sammensetning for bruk i en fremgangsmåte for behandling ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, hvor i fremgangsmåten for behandling:

- (a) den maksimale serumkonsentrasjonen av 25-hydroksyvitamin D₃ i et doseintervall (C_{max}) er redusert sammenlignet med C_{max} for en ekvivalent mengde av 25-hydroksyvitamin D₃ administrert ved bolus IV-injeksjon og/eller en oral doseringsform med øyeblikkelig frigjøring, eller
- (b) forholdet mellom maksimal serumkonsentrasjon innen 24 timer etter administrering av 25-hydroksyvitamin D₃ til konsentrasjonen 24 timer etter administrering (C_{max24 timer} / C_{24 timer}) er redusert sammenlignet med C_{max24 timer} / C_{24 timer}, for en tilsvarende mengde av 25-hydroksyvitamin D₃ administrert ved bolus IV-injeksjon og/eller en oral doseringsform med øyeblikkelig frigjøring, eller

(c) tiden for plasmakonsentrasjonen av 25-hydroksyvitamin D₃ for å nå sitt maksimum i et doseintervall etter administrering (T_{max}) økes sammenlignet med T_{max} for en ekvivalent mengde av 25-hydroksyvitamin D₃ administrert ved bolus IV-injeksjon og/eller en oral doseringsform med umiddelbar frigjøring.

- 10.** Farmasøytisk sammensetning for bruk i en fremgangsmåte for behandling ifølge krav 9, hvori C_{max} er redusert med en faktor på minst 20 %.
- 11.** Farmasøytisk sammensetning for bruk i en fremgangsmåte for behandling ifølge krav 9, hvori T_{max} økes med en faktor på minst 25 %.
- 12.** Farmasøytisk sammensetning for bruk i en fremgangsmåte for behandling ifølge krav 9, hvori C_{max}_{24 timer} /C_{24 timer}, reduseres med en faktor på minst 20 %.
- 13.** Farmasøytisk sammensetning for bruk i en fremgangsmåte for behandling ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, hvori 25-hydroksyvitamin D₃ administreres oralt i dosemengder på fra 1 til 100 µg, fortrinnsvis fra 5 til 100 µg, per dag.
- 14.** Farmasøytisk sammensetning for bruk i en fremgangsmåte for behandling ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, hvori 25-hydroksyvitamin D₃ administreres oralt i dosemengder på fra 200 til 400 µg.
- 15.** Farmasøytisk sammensetning for bruk i en fremgangsmåte for behandling ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, hvori 25-hydroksyvitamin D₃ administreres oralt i dosemengder fra 5 til 80 µg, fortrinnsvis fra 30 til 80 µg, mer foretrukket fra 30 til 60 µg.
- 16.** Farmasøytisk sammensetning for bruk i en fremgangsmåte for behandling ifølge krav 15, hvori 25-hydroksyvitamin D₃ administreres oralt i en doseringsmengde på 10 µg.
- 17.** Farmasøytisk sammensetning for bruk i en fremgangsmåte for behandling ifølge krav 15, hvori 25-hydroksyvitamin D₃ administreres oralt i en dose på 30 eller 60 µg.
- 18.** Farmasøytisk sammensetning for bruk i en fremgangsmåte for behandling ifølge hvilket som helst av kravene 13 til 17, hvori 25-hydroksyvitamin D₃ gis oralt en gang daglig.