



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3632448 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/585 (2006.01)
A61K 9/22 (2006.01)
A61P 15/18 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2022.05.09
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2022.01.12
(86)	European Application Nr.	19209672.5
(86)	European Filing Date	2011.06.28
(87)	The European Application's Publication Date	2020.04.08
(30)	Priority	2010.06.29, EP, 10305708 2010.07.28, US, 36839610 P
(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
(62)	Divided application	EP2588114, 2011.06.28
(73)	Proprietor	Laboratorios Leon Farma SA, c/ La Vallina s/n - Poligono Industrial Navatejera Villaquilambre, 24008 Leon, Spania
(72)	Inventor	PERRIN, Philippe, 10 rue Docteur Roux, 75015 Paris, Frankrike VELADA, José, Harlingenstraat 35, 3826 Amersfoort, Nederland DROUIN, Dominique, 32 rue des Gatines, 91370 Verrieres, Frankrike
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54)	Title	PHARMACEUTICAL COMPOSITION COMPRISING DROSPIRENONE FOR USE AS A CONTRACEPTIVE
(56)	References Cited:	EP-B1- 1 214 076, WO-A1-2009/138224, WO-A1-2010/015713, WO-A2-2008/031631, P. ROSENBAUM ET AL: "Inhibition of ovulation by a novel progestogen (drospirenone) alone or in combination with ethinylestradiol", EUROPEAN JOURNAL OF CONTRACEPTION AND REPRODUCTIVE HEALTH CARE, vol. 5, no. 1, 1 January 2000 (2000-01-01) , pages 16-24, XP55336066, GB ISSN: 1362-5187, DOI: 10.1080/13625180008500376 EDWARDS L A: "An update on oral contraceptive options", FORMULARY, ADVANSTAR COMMUNICATIONS, CLEVELAND, OH, US, vol. 39, no. 2, 1 February 2004 (2004-02-01), pages 104-121, XP008065761, ISSN: 1082-801X DAVID F. ARCHER ET AL: "Drospirenone-only oral contraceptive: results from a multicenter noncomparative trial of efficacy, safety and tolerability", CONTRACEPTION., vol. 92, no. 5, 1 November 2015 (2015-11-01), pages 439-444, XP055665922, US ISSN: 0010-7824, DOI: 10.1016/j.contraception.2015.07.014

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. Farmasøytisk sammensetning omfattende drospirenon for bruk som et prevensjonsmiddel for en kvinnelig pasient med behov for det, hvori:

(a) en daglig aktiv doseringsenhet av sammensetningen omfatter en mengde drospirenon på ca. 2 mg til ca. 6 mg drospirenon, en eller flere farmasøytisk akseptable hjelpestoffer, og inneholder ikke noe østrogen, og hvori den daglige aktive doseringsenheten blir administrert under et doseringsregime som omfatter administrering av nevnte daglige aktive doseringsenhet i 24 påfølgende dager etterfulgt av 4 påfølgende dager hvor ingen aktiv doseringsenhet administreres til nevnte pasient; og hvori

(b) oppløsningshastigheten til nevnte daglige aktive doseringsenhet er slik at når den utsettes for en *in vitro* oppløsningstest i henhold til USP XXIII Paddle Method,

(i) ikke mer enn 50% av drospirenonet som opprinnelig er til stede i den daglige aktive doseringsenheten er oppløst innen 30 minutter, og

(ii) minst 50% av drospirenonet som opprinnelig er tilstede i nevnte daglige aktive doseringsenhet er oppløst i et tidsrom fra 3 timer til 4 timer.

2. Farmasøytisk sammensetning for bruk ifølge krav 1, hvori sammensetningen er ytterligere **karakterisert ved at** minst 70% av drospirenonet er oppløst innen 6 timer.

3. Farmasøytisk sammensetning for bruk ifølge krav 1, hvori en placebo-doseenhet skal administreres i løpet av de 4 påfølgende dagene hvor ingen aktiv doseringsenhet administreres til nevnte pasient.

4. Farmasøytisk sammensetning for bruk ifølge hvilket som helst av kravene 1 eller 3, hvori sammensetningen i den aktive doseringsenheten er formulert i en fast form for oral administrering valgt fra gruppen bestående av tabletter, kapsler, granuler, piller, kapsler og pulvere.

5. Farmasøytisk sammensetning for bruk ifølge hvilket som helst av kravene 1 eller 3 til 4, hvori sammensetningen i den aktive doseringsenheten er formulert som en tablett.

6. Farmasøytisk sammensetning for bruk ifølge krav 5, hvori tablettene videre omfatter et belegg som omfatter et filmdannende middel og valgfritt et egnet hjelpestoff.

7. Farmasøytisk sammensetning for bruk ifølge krav 6, hvori nevnte filmdannende middel er valgt fra gruppen bestående av hydroksypropylmetylcellulose, hydroksypropylcellulose og etylcellulose.

8. Farmasøytisk sammensetning for bruk ifølge krav 6, hvori nevnte passende hjelpestoff er valgt fra gruppen bestående av et mykner, et fyllstoff og et fargestoff.

9. Farmasøytisk sammensetning for bruk ifølge hvilket som helst av kravene 1 eller 3 til 8, hvori drospirenonet er tilveiebrakt i partikkelform med en størrelsesfordeling **karakterisert ved at** (ii) en d_{50} partikkelstørrelse i området fra ca. 10 μm til ca. 60 μm .

10. Farmasøytisk sammensetning for bruk ifølge krav 9, hvori drospirenonpartiklene er oppnådd ved en prosess bestående av maling valgfritt kombinert med sikting.

11. Farmasøytisk sammensetning for bruk ifølge krav 10, hvori maleprosessen utføres av en mølle valgt fra gruppen bestående av: en fluidenergimølle, en kulemølle, en

stavmølle, en hammermølle, en skjæremølle og en oscillerende granulator.

12. Farmasøytisk sammensetning for bruk ifølge krav 9, hvori drospirenonpartiklene er oppnådd ved en prosess bestående av krystallisering eller utfelling valgfritt kombinert med et siktetrinn.

13. Farmasøytisk sammensetning for bruk ifølge hvilket som helst av kravene 1 eller 3 til 12, hvori drospirenonen er en ikke-mikronisert og i det vesentlige krystallisert form.

14. Farmasøytisk sammensetning for bruk ifølge hvilket som helst av kravene 1 eller 3 til 13, hvori den farmasøytiske sammensetningen omfatter som farmasøytisk akseptable hjelpestoffer: mikrokrystallinsk cellulose, vannfri laktose, silisiumdioksid og magnesiumstearat.

15. Farmasøytisk sammensetning for bruk ifølge hvilket som helst av kravene 1 eller 3 til 14, hvori drospirenonet er tilveiebrakt i en mengde på ca. 4 mg.