



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3650016 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/20 (2006.01)
A61K 9/28 (2006.01)
A61K 9/48 (2006.01)
A61K 31/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45) Translation Published 2021.10.18

(80) Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent 2021.05.05

(86) European Application Nr. 19217651.9

(86) European Filing Date 2014.03.14

(87) The European Application's Publication Date 2020.05.13

(30) Priority 2013.03.15, US, 201361801896 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 EP3332773, 2014.03.14

(73) Proprietor EirGen Pharma Ltd., Westside Business Park Old Kilmeaden Road, Waterford X91 YV67, Irland

(72) Inventor White, Jay A., 194 Stelick Ave., Newmarket, Ontario L3X 1T3, Canada
Melnick, Joel Z., 1214 Forest Ave, Evanston, IL 60202, USA
Agudoawu, Sammy A., 3123 Cabano Crescent, Mississauga, Ontario L5M 0C5, Canada
Tabash, Samir P., 131 Toscana Drive, Whitby, Ontario L1R 2Z9, Canada

(74) Agent or Attorney Valet Patent Services, LLP, Siedlungsstrasse 4 A, 85253 ERDWEG, Tyskland

(54) Title **STABILIZED MODIFIED RELEASE VITAMIN D FORMULATION AND METHOD OF ADMINISTERING SAME**

(56) References Cited: WO-A1-2008/134512
WO-A1-96/00074
WO-A2-2012/145491
RAPURI P B ET AL: "Effect of vitamins D2 and D3 supplement use on serum 25OHD concentration in elderly women in summer and winter", CALCIFIED TISSUE INTERNATIONAL, NEW YORK, NY, US, vol. 74, no. 2, 1 February 2004 (2004-02-01), pages 150-156, XP002454820, ISSN: 0171-967X, DOI: 10.1007/S00223-003-0083-8

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. Stabilisert formulering for vedvarende frigjøring av en vitamin D-forbindelse, idet formuleringen omfatter en blanding av:
 - 5 én eller begge av 25-hydroksyvitamin D₂ og 25-hydroksyvitamin D₃; og
 - et stabiliseringsmiddel omfattende et materiale valgt fra gruppen bestående av:
 celluloseforbindelser, poloksamerer, polyetylenoksydpolymerer, povidoner, pyrogen
 silisiumdioksyd og kombinasjoner derav, idet stabiliseringsmidlet er tilstede i en mengde på
 minst ca. 5% av formuleringen basert på den totale vekten av formuleringen unntatt hvilket
 som helst ytterligere belegg eller overtrekk (vekt%), hvilket belegg eller overtrekk er i stand
10 til, på hvilket som helst tidspunkt etter fire timers oppløsning in vitro av formuleringen på
 forhånd utsatt til to måneders lagringsforhold ved 25 °C og 60 % relativ fuktighet, å
 opprettholde en forskjell på mindre enn 30% frigjort mengde vitamin D-forbindelse
 sammenlignet med mengden vitamin D-forbindelse frigjort ved samme tidspunkt under
 oppløsningen in vitro utført før formuleringen ble utsatt for lagringsforholdene.
- 15 2. Formulering ifølge krav 1, omfattende en matrise som løsbart binder den ene eller begge av
 25-hydroksyvitamin D₂ og 25-hydroksyvitamin D₃ og som styrer deres frigjøring.
3. Formulering ifølge krav 1 eller 2, omfattende en lipofil matrise omfattende den ene eller begge
 av 25-hydroksyvitamin D₂ og 25-hydroksyvitamin D₃.
4. Formulering ifølge krav 3, hvor den lipofile matriksen omfatter en voks.
- 20 5. Formulering ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvor formuleringen er en
 oral formulering for vedvarende frigjøring av vitamin D-forbindelsen i mage-tarmkanalen til et
 individ som inntar formuleringen.
6. Formulering ifølge hvilket som helst av de foregående krav, hvor stabiliseringsmidlet omfatter
 en celluloseforbindelse.
- 25 7. Formulering ifølge krav 6, hvor celluloseforbindelsen omfatter en celluloseeter.
8. Formulering ifølge krav 7, hvor celluloseeteren omfatter én eller flere av metylcellulose,
 hydroksypropylmetylcellulose, hydroksyetylmetylcellulose, hydroksyetylcellulose og
 hydroksypropylcellulose.
9. Formulering ifølge krav 8, hvor celluloseforbindelsen omfatter hydroksypropylmetylcellulose.
- 30 10. Formulering ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, hvor vitamin D-forbindelsen
 omfatter 25-hydroksyvitamin D₃.
11. Stabilisert formulering for vedvarende frigjøring av en vitamin D-forbindelse, hvor
 formuleringen omfatter en blanding av:
 én eller begge av 25-hydroksyvitamin D₂ og 25-hydroksyvitamin D₃;

- en ikke-voks matrise; og
et stabiliserende middel omfattende et materiale valgt fra gruppen bestående av:
celluloseforbindelser, poloksamere, polyetylenoksydpolymerer, povidoner, pyrogen
silisiumdioksyd og kombinasjoner derav.
- 5 12. Doseringsform for vedvarende frigjøring i form av en kapsel, tablett, pose, drage eller
stikkpiller som omfatter en formulering ifølge et hvilket som helst av de foregående krav.
13. Doseringsform for vedvarende frigjøring ifølge krav 12, hvor doseringsformen inneholder 5 til
80 µg 25-hydroksyvitamin D₃, fortrinnsvis 30 µg eller 60 µg 25-hydroksyvitamin D₃.
14. Produkt som er en stabilisert formulering for vedvarende frigjøring ifølge et hvilket som helst
10 av kravene 1-11, eller en doseringsform med langvarig frigjøring ifølge et hvilket som helst av
kravene 12-13 for anvendelse ved behandling av en vitamin D følsom sykdom.
15. Produkt for anvendelse ved behandling ifølge krav 14, hvor den vitamin D følsomme
sykdommen:
- 15 (a) er valgt fra kreft, dermatologiske lidelser, paratyreoidismeforstyrrelser, beinlidelser og
autoimmune lidelser; eller
(b) er valgt fra psoriasis, hyperparatyreoidisme, sekundær hyperparatyreoidisme og
osteoporose; eller
(c) er sekundær hyperparatyreoidisme.
16. Produkt for anvendelse ved behandling ifølge krav 14 eller 15, hvor pasienten:
- 20 (a) har kronisk nyresykdom (CKD); eller
(b) har kronisk nyresykdom som er trinn 3 eller 4; eller
(c) har kronisk nyresykdom som er trinn 3 eller 4 og vitamin D mangel; eller
(d) har kronisk nyresykdom som er trinn 3 eller 4 og vitamin D mangel.
17. Produkt for anvendelse ved behandling ifølge krav 14, hvor den vitamin D følsomme
25 sykdommen er hyperparatyreoidisme som følge av kronisk nyresykdom.
18. Produkt for anvendelse ved behandling ifølge krav 17, hvor den vitamin-D følsomme
sykdommen er hyperparatyreoidisme som følge av kronisk nyresykdom i trinn 3 eller 4.
19. Produkt for anvendelse ved behandling ifølge et hvilket som helst av kravene 14 til 18, hvor
30 pasienten er:
- (a) et menneske; eller
(b) et voksent menneske.
20. Produkt for anvendelse ved behandling i samsvar med et hvilket som helst av kravene 14 til
19, hvor 5 til 80 µg 25-hydroksyvitamin D₃, fortrinnsvis 30 µg eller 60 µg 25-hydroksyvitamin D₃
35 gis per dag.