



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3895699 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl. *A61P 3/12 (2006.01)*
A61K 9/70 (2006.01) *A61P 5/18 (2006.01)*
A61K 9/00 (2006.01) *A61P 7/00 (2006.01)*
A61K 9/16 (2006.01) *A61P 7/08 (2006.01)*
A61K 9/20 (2006.01) *A61P 13/00 (2006.01)*
A61K 47/02 (2006.01) *A61P 13/12 (2006.01)*
A61P 3/00 (2006.01) *A61P 19/08 (2006.01)*
A61K 33/26 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2023.07.24
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.04.26
(86)	European Application Nr.	21176696.9
(86)	European Filing Date	2008.11.13
(87)	The European Application's Publication Date	2021.10.20
(30)	Priority	2007.11.16, EP, 07120837
(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
(62)	Divided application	EP3492069, 2008.11.13
(73)	Proprietor	Vifor Fresenius Medical Care Renal Pharma, Ltd., Rechenstrasse 37, 9014 St. Gallen, Sveits
(72)	Inventor	WEIBEL-FURER, Ludwig, -, deceased, Sveits PHILIPP, Erik, 9320 Arbon, Sveits
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54) Title **PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS COMPRISING IRON OXY-HYDROXIDE**

(56) References
Cited:

EP-A- 1 757 299
WO-A-92/01458
WO-A-2006/000547
DE-A1- 19 547 356
US-A- 5 514 281
OLAF HERGESELL ET AL: "Stabilized polynuclear iron hydroxide is an efficient oral phosphate binder in uraemic patients", NEPHROL DIAL TRANSPLANT, vol. 14, no. 4, 1 April 1999 (1999-04-01), pages 863-867, XP55423996, DOI: 10.1093/ndt/14.4.863
DANIEL W. COYNE ET AL: "Real-world effectiveness of sucroferric oxyhydroxide in patients on chronic hemodialysis: A retrospective analysis of pharmacy data", CLINICAL NEPHROLOGY, vol. 88, no. 08, 1 August 2017 (2017-08-01), pages 59-67, XP55606962, DE ISSN: 0301-0430, DOI: 10.5414/CN109021

GEISSER P ET AL: "PA21: a novel phosphate binder for the treatment of hyperphosphatemia in chronic kidney disease", CLINICAL NEPHROLOGY, DUSTRI VERLAG, NUENCHEN-DEISENHOFEN, DE, vol. 74, no. 1, 1 July 2010 (2010-07-01), pages 4-11, XP009152469, ISSN: 0301-0430

RUDOLF P. WÜTHRICH ET AL: "Randomized Clinical Trial of the Iron-Based Phosphate Binder PA21 in Hemodialysis Patients", CLINICAL JOURNAL OF THE AMERICAN SOCIETY OF NEPHROLOGY, vol. 8, no. 2, 2 November 2012 (2012-11-02), pages 280-289, XP55606959, ISSN: 1555-9041, DOI: 10.2215/CJN.08230811

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 som omfatter jernoksyhydroksid i høy belastning,

i en form egnet for oral administrering valgt fra tyggetabletter, granulat eller poser som inneholder disse granulene, hvori jernoksyhydroksidet er tilstede i en mengde på 10 til 80% (vekt/vekt), uttrykt i forhold til den totale vekten av sammensetningen, og i en mengde på 700 til 1700 mg per doseringsform, og hvori sammensetningen inneholder minst ett karbohydrat valgt fra gruppen bestående av sakkarose, dekstrin og stivelse, og mer enn 70% av den totale vekten av ingrediensene er dannet av ingrediensene valgt fra jernoksyhydroksid, sakkarose, naturlig stivelse, pregelatinisert stivelse, et superdesintegreringsmiddel, dekstrin og vann.

2. Sammensetning ifølge krav 1, hvori mer enn 70% opp til 100% av den totale vekten av ingrediensene er dannet av ingrediensene valgt fra jernoksyhydroksid, sakkarose, naturlig stivelse, pregelatinisert stivelse, et superdesintegreringsmiddel og vann.

3. Sammensetning ifølge krav 1, hvori mer enn 90% opp til 100% av den totale vekten av ingrediensene er dannet av ingrediensene valgt fra jernoksyhydroksid, sakkarose, naturlig stivelse, pregelatinisert stivelse, et superdesintegreringsmiddel, dekstrin og vann.

4. Sammensetning ifølge krav 3, hvori mer enn 90% opp til 100% av den totale vekten av ingrediensene er dannet av ingrediensene valgt fra jernoksyhydroksid, sakkarose, naturlig stivelse, pregelatinisert stivelse, et superdesintegreringsmiddel og vann.

5. Sammensetning ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 4, omfattende sakkarose og stivelse.

6. Sammensetning ifølge hvilket som helst av de foregående krav, hvori jernoksyhydroksidet inneholder beta-jernoksyhydroksid.

7. Sammensetning ifølge hvilket som helst av de foregående krav, hvori jernoksyhydroksid er tilstede i en mengde på 30 til 65% (vekt/vekt), uttrykt i forhold til sammensetningens totale vekt.

8. Sammensetning ifølge hvilket som helst av de foregående krav, hvori karbohydratet er tilstede i en total mengde på 1 til 50% (vekt/vekt), fortrinnsvis 5 til 30% (vekt/vekt), uttrykt i forhold til sammensetningens totale vekt.

9. Sammensetning ifølge hvilket som helst av de foregående krav, videre omfattende ett eller flere smaksstoffer, søtningsmidler, smaksforbedrende midler og/eller fargestoffer.

10. Sammensetning ifølge krav 9, hvori søtningsmidlet er naturlig eller unaturlig søtningsmiddel valgt fra et sukker, en polyol, aspartam, sukralose, acesulfamin K og/eller sakkarin og det smaksforbedrende midlet er valgt fra glykosider slik som neohesperidin dihydrochalcon, glycyrrhizin, glutamat.

11. Sammensetning ifølge krav 9 eller 10, hvori søtningsmidlet er tilstede i en mengde på 0,01 til 2,5% (vekt/vekt), og det smaksforbedrende middel i en mengde på 0,1 til 10 ppm, hver uttrykt i forhold til totalvekten av sammensetningen.

12. Sammensetning ifølge krav 9, hvori smaksstoffet er tilstede i en mengde på 0,01 til 10% (vekt/vekt), fortrinnsvis 0,1 til 5% (vekt/vekt), mest foretrukket 0,1 til 1%

(vekt/vekt), uttrykt i forhold til sammensetningens totale vekt.

13. Sammensetning ifølge hvilket som helst av de foregående kravene omfattende ett eller flere hjelpestoffer, valgt fra superdesintegreringsmidler, glidemidler, antioksidanter.

14. Sammensetning ifølge hvilket som helst av de foregående kravene omfattende et enkelt superdesintegreringsmiddel eller en kombinasjon av superdesintegreringsmidler eller en kombinasjon med ett eller flere vanlige desintegreringsmidler.

15. Sammensetning ifølge krav 13 eller 14, hvori superdesintegreringsmidlet er valgt fra gruppen bestående av tverrbundne polyvinylpyrrolidoner, modifiserte stivelser og modifiserte celluloser, fortrinnsvis er superdesintegreringsmidlet valgt fra gruppen bestående av tverrbundet polyvinylpyrrolidon.

16. Sammensetning ifølge krav 13, 14 eller 15, hvori superdesintegreringsmidlet er tilstede i en mengde på 0,1 til 10% (vekt/vekt), fortrinnsvis 0,5 til 8% (vekt/vekt), mer foretrukket 2,5 til 6% (vekt/vekt), uttrykt i forhold til sammensetningens totale vekt.

17. Sammensetning ifølge krav 13, hvori glidemidlet er valgt fra gruppen bestående av magnesiumstearat, silikaderivater, slik som kolloidalt silika, pyrogen silika, hydratisert natriumsilikoaluminat, kolloidalt silisiumdioksid, talkum og blandinger derav, fortrinnsvis magnesiumstearat, kolloidalt silika eller talkum.

18. Sammensetning ifølge krav 13 eller 17, hvori glidemidlet er tilstede i en mengde på 0,01 til 10% (vekt/vekt), fortrinnsvis 0,1 til 5% (vekt/vekt), uttrykt i forhold til sammensetningens totale vekt.

19. Sammensetning ifølge hvilket som helst av de foregående kravene som har en jernfrigjøringshastighet på under 2,5% vekt/vekt.

20. Sammensetning ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, hvori jernoksyhydroksidet er stabilisert av et stabiliseringsmiddel.

21. Sammensetning ifølge hvilket som helst av de foregående kravene valgt fra tyggetabletter.

22. Sammensetning ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 20 i form av granuler.

23. Sammensetning ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 20 og 22 i form av poser som inneholder granuler.

24. Sammensetninger ifølge hvilket som helst av de foregående krav for anvendelse i behandlingen av pasienter som lider av hyperfosfatemi.

25. Sammensetninger ifølge hvilket som helst av de foregående krav for bruk i behandling av pasienter med kronisk nyresvikt.

26. Sammensetninger ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, som i det vesentlige er ikke-bioabsorberbare.

27. Fremgangsmåte for fremstilling av sammensetningen ifølge hvilket som helst av de foregående krav 1-21, og 24-26 i form av en tablett, nevnte fremgangsmåte involverer direkte komprimering eller tørrgranulering.

28. Fremgangsmåte for fremstilling av sammensetningen ifølge hvilket som helst av de foregående kravene 1-20 og 22-26 i form av granuler, nevnte fremgangsmåte involverer

høyskjærgranulering, fluidisert sjiktgranulering eller (tørr) blandingsprosesser.

29. Fremgangsmåte for fremstilling av sammensetningen ifølge hvilket som helst av de foregående kravene 1-21, og 24-27 i form av en tablett, hvori en vandig suspensjon, omfattende minst 90% (vekt/vekt) av ingrediensene basert på den totale vekten av den endelige sammensetningen, tilberedes, hvilken som deretter utsettes for spraytørking for å oppnå et flytbart pulver, som eventuelt blandes med de resterende ingrediensene og deretter komprimeres for å oppnå en tablett.