



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2413899 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/00 (2006.01)
A61K 31/245 (2006.01)
A61K 31/4174 (2006.01)
A61P 23/02 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.05.31
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.01.27
(86)	European Application Nr.	10714119.4
(86)	European Filing Date	2010.04.02
(87)	The European Application's Publication Date	2012.02.08
(30)	Priority	2009.04.03, US, 166680 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 ; MK ; MT ; NL ; NO ; PL ; PT ; RO ; SE ; SI ; SK ; SM ; TR
	Designated Extension States:	AL ; BA ; ME ; RS
(73)	Proprietor	St. Renatus, LLC, 101 E Harmony Rd. Suite A89, Fort Collins, Colorado 80525, USA
(72)	Inventor	KOLLAR, Mark David, 5308 Golden Willow Drive, Fort CollinsColorado 80528, USA
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54)	Title	DENTAL ANESTHETIC COMPRISING TETRACAINE AND A VASOCONSTRICTOR FOR INTRANASAL ADMINISTRATION
(56)	References Cited:	US-A- 3 832 460 US-A- 5 585 398 US-A1- 2004 131 665 US-B1- 6 413 499 JP-A- 2004 196 786

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:

- a) ca. 3% (vekt/volum) tetrakain, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav;
- b) en vasokonstriktor; og
- c) en farmasøytisk akseptabel bærer.

2. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, hvor nevnte farmasøytiske sammensetning er for intranasal administrering.

3. Farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1-2, hvor nevnte vasokonstriktor er valgt fra gruppen bestående av: indirekte α_1 -adrenerge agonister; kalsiumkanalblokkere; meperidin; imidazolmedisiner; α_2 -adrenerge agonister; imidazolin (I_1)-ligander; direkte α_2 -adrenerge agonister; substans P-blokkere/-reduksjonsmidler; I-mentol; icilin; glutamatreseptorhemmere; og farmasøytisk akseptable salter derav.

4. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 3, hvor nevnte vasokonstriktor er oksymetazolin, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

5. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 4, hvor nevnte oksymetazolin er oksymetazolin-HCl-salt.

6. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 5, hvor nevnte sammensetning omfatter ca. 0,01-1,0% (vekt/volum) oksymetazolin-HCl.

7. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 6, hvor nevnte sammensetning omfatter ca. 0,05% (vekt/volum) oksymetazolin-HCl.

8. Farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1-7, hvor nevnte sammensetning videre omfatter et konserveringsmiddel.

9. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 8, hvor nevnte konserveringsmiddel er valgt fra listen bestående av: sukkeralkoholer, etanol, benzylalkohol, isopropanol, kresol, klorkresol, og fenol.

10. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 9, hvor nevnte konserveringsmiddel er benzylalkohol.
- 5 11. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 10, hvor nevnte sammensetning omfatter ca. 0,5-2,0% (vekt/volum) benzylalkohol.
12. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 11, hvor nevnte sammensetning omfatter ca. 0,9% (vekt/volum) benzylalkohol.
- 10 13. Farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1-12, hvor nevnte sammensetning videre omfatter et viskositetsforbedrende middel.
14. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 13, hvor nevnte viskositetsforbedrende middel er valgt fra listen bestående av: metylcellulose, hydroksyetylcellulose,
15 hydroksypropylmetylcellulose og smart hydrogel.
15. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 14, hvor nevnte viskositetsforbedrende middel er hydroksyetylcellulose.
- 20 16. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 15, hvor nevnte sammensetning omfatter ca. 0,01-1,0% (vekt/volum) hydroksyetylcellulose.
17. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 16, hvor nevnte sammensetning omfatter ca. 0,05% (vekt/volum) hydroksyetylcellulose.
- 25 18. Farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1-17, hvor nevnte farmasøytisk akseptable bærer er vann, en sukkeralkohol, eller en alkohol.
19. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 18, hvor nevnte farmasøytiske
30 akseptable bærer er vann.
20. Farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1-19, hvor nevnte sammensetning har en pH på 4,0-6,5.
- 35 21. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 20, hvor nevnte sammensetning har en pH på 5,5-6,5.

22. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1 eller 2, hvor nevnte sammensetning videre omfatter et konserveringsmiddel og et viskositetsforbedrende middel.

23. Farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1-2, hvor nevnte sammensetning omfatter:

Ingrediens	Formulering (% vekt/volum)
Tetrakainhydroklorid, USP	3,00
Oksymetazolinhydroklorid, USP	0,05
Vannfri sitronsyre, USP	1,00
Natriumhydroksid, NF	q.s.
Benzylalkohol, NF	0,90
Saltsyre, NF	q.s.
Hydroksyetylcellulose, NF (5000 cps)	0,05
Renset vann, USP	q.s. til 100%

24. Farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1-2, hvor nevnte sammensetning omfatter: tetrakain-HCl, oksymetazolin-HCl, vannfri sitronsyre (for pH-kontroll), natriumhydroksid (for pH-justering), benzylalkohol, saltsyre (for pH-kontroll), hydroksyetylcellulose, og renset vann.

25. Farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1-23 for anvendelse ved bedøvelse av minst en del av et individs maksillære tannbue i et individ.

26. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 25, hvorved den farmasøytiske sammensetningen selektivt leveres inn i nesebihulene eller baksiden av nesehulen til individet, hvor minst en del av den farmasøytiske sammensetningen absorberes av nesevevet lokalisert på baksiden av nesehulen i nærheten av den maksillære bihulen.

27. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 26, hvor minst en del av den farmasøytiske sammensetningen skal absorberes av nesevev plassert på baksiden av nesehulen i nærheten av den fremre tannpleksus, forlengelser av den midtre overordnede nerven, den bakre overordnede alveolære nerven, nociceptorene i ansikts- og bukkalnerven, eller sfenopalatin (pterygopalatin)-ganglion.

28. Farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1-23 for anvendelse ved levering til et individs V2-V3 trigeminusganglion.

5 29. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 26-27, hvor nevnte farmasøytiske sammensetning leveres ved forstøvning eller sprøyting.

10 30. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 29, hvor nevnte leverte spray er en strøm eller en sky.

31. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 30, hvor den selektive leveringen inn i nesebihulene eller baksiden av nesehulen omfatter å sprøyte nevnte farmasøytiske sammensetning 1-5 ganger inn i hvert av neseborene til nevnte individ.

15 32. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 31, hvor nevnte selektive levering til nesebihulene eller baksiden av nesehulen omfatter å sprøyte nevnte farmasøytiske sammensetning 3 ganger inn i hvert av neseborene til nevnte individ.

20 33. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 32, hvor hver av de 3 sprøytingene inn i hvert av neseborene til nevnte individ er skilt med et intervall på 4 minutter.

25 34. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 26-27, hvor ca. 12-50 mg tetrakain leveres inn i nesebihulene eller baksiden av nesehulen til nevnte pasient.

35. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 34, hvor ca. 15-24 mg tetrakain leveres i nesebihulene eller baksiden av nesehulen til nevnte individ.

30 36. Farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1-2 for anvendelse ved bedøvelse av minst en del av en kroppsdel, et organ, eller et vev.

35 37. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 36, hvor nevnte vev er epitelvev.

38. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 37, hvor nevnte vev er slimhinnevev.
- 5 39. Anordning for levering av en farmasøytisk sammensetning, hvor nevnte anordning omfatter en farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1-2.
40. Anordning ifølge krav 39, hvor nevnte anordning er for intranasal levering av en farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1-2.
- 10 41. Anordning ifølge krav 40, hvor nevnte anordning er i stand til å levere nevnte farmasøytiske sammensetning til nesevevet plassert på baksiden av nesehulen i nærheten av sfenopalatin (pterygopalatin)-ganglion og maksillære nerve.
- 15 42. Anordning ifølge krav 41, hvor nevnte anordning er forhåndsfylt med en farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1-2.
43. Anordning ifølge et hvilket som helst av kravene 40-42, hvor nevnte anordningen er en sprøyteanordning.