



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2877155 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/00 (2006.01)
A61K 31/485 (2006.01)
A61K 47/34 (2017.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.03.22
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.10.28
(86)	European Application Nr.	13744494.9
(86)	European Filing Date	2013.07.26
(87)	The European Application's Publication Date	2015.06.03
(30)	Priority	2012.07.26, US, 201213558463 2013.03.28, US, 201361806185 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
	Designated Extension States:	BA ; ME
(73)	Proprietor	Camurus AB, Ideon Science Park, 223 70 Lund, Sverige
(72)	Inventor	TIBERG, Fredrik, Camurus ABIdeon Science Park, 223 70 Lund, Sverige HARWIGSSON, Ian, Camurus ABIdeon Science Park, 223 70 Lund, Sverige JOHNSSON, Markus, Camurus ABIdeon Science Park, 223 70 Lund, Sverige
(74)	Agent or Attorney	TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

(54)	Title	OPIOID FORMULATIONS
(56)	References Cited:	US-A1- 2005 112 188 WO-A2-2011/154724 WO-A1-2006/075125 US-A1- 2011 230 569

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 depotforløperformulering som omfatter:

- 5 a) en lipidkontrollert frigjøringsformulering som omfatter:
- (i) i det minste ett nøytralt diacyllipid og/eller i det minste et tokoferol; og
- (ii) i det minste ett fosfolipid;
- b) 20 til 40 vekt% av i det minste ett oksygenholdig organisk løsemiddel; og
- c) 21 til 55 vekt% av i det minste ett aktivt middel, som er valgt fra buprenorfin
- 10 og salter derav, beregnet som buprenorfinfri base;
- hvor et vektforhold av i):ii) er fra 90:10 til 20:80; og
- hvor komponent b) omfatter i det minste ett av et amid eller et sulfoksyd;
- som danner et depotsammensetning ved administrering til kroppen av subjektet.

- 15 **2.** Depotforløperformulering ifølge krav 1, hvor det i det minste ene aktive midlet er valgt fra buprenorfin og salter derav er til stede i et nivå på 31 til 45 vekt% av buprenorfin (beregnet som buprenorfinfri base).

- 20 **3.** Depotforløperformulering ifølge krav 1, hvor komponentene i) og/eller ii) omfatter i det minste 50 vekt% av komponenter som har C16 til C18 acylgrupper, hvor slike grupper har null, én eller to umettede bindinger.

- 25 **4.** Depotforløperformulering ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvor komponent b) omfatter dimetylacetamid (DMA), N-metyl-2-pyrrolidon (NMP), 2-pyrrolidon eller dimetylsulfoksid (DMSO).

- 5.** Depotforløperformulering ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvor komponent b) omfatter NMP.

- 30 **6.** Depotforløperformulering ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvor komponent c) omfatter buprenorfin som den frie basen.

- 7.** Depotforløperformulering av et hvilket som helst av de foregående kravene, for administrasjon en gang i måneden.

8. Depotforløperformulering ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, som har en dose i området fra 10 til 200 mg buprenorfin (beregnet som fri base), spesielt fra 20 til 200 mg, mer foretrukket fra 40 til 140 mg.

5

9. Depotforløperformulering ifølge et hvilket som helst foregående kravene, i administrasjonsklar form.

10. Depotforløperformulering ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, som har en viskositet på 1 til 1000 mPas ved 20 °C.

10

11. Depotforløperformulering ifølge krav 1, som omfatter:

a) (i) 15-25 vekt% av glyseroldioleat (GDO)

(ii) 10-25 vekt% av fosfatidylkolin (PC);

15

b) 20 til 35 vekt% av NMP; og

c) 31 til 40 vekt% av buprenorfin og salter derav, beregnet som buprenorfinfri base.

12. En depotsammensetning som er dannet ved administrering til et humant subjekt av en depotforløperformulering ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene.

20

13. En depotsammensetning ifølge krav 12, som omfatter:

a) en lipidformulering som omfatter:

(i) i det minste ett nøytralt diacyllipid og/eller i det minste et tokoferol; og

25

(ii) et fosfolipid;

b) eventuelt i det minste oksygenholdig organisk løsemiddel, som omfatter i det minste ett av et amid eller et sulfoksyd;

c) 21 til 55 vekt% av i det minste ett aktivt middel, som er valgt fra buprenorfin og salter derav; og

30

d) i det minste et vandig fluid;

hvor et vektforhold på i):ii) er fra 90:10 til 20:80.

14. En forløperformulering ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 11 for bruk i en fremgangsmåte for behandling eller profylakse av et humant eller ikke-humant dyrsubjekt.

15. En forløperformulering ifølge krav 14, for bruk i behandling av smerte, for opioidopprettholdelsesterapi eller for behandlingen av opioidavhengighet ved avgiftning og/eller opprettholdelse eller for behandlingen eller profylakse av symptomene av opioidavvenning og/eller kokainavvenning.

16. En forløperformulering for bruk ifølge krav 15, for bruk i en fremgangsmåte for opprettholdelsesbehandling av et humant subjekt, hvor subjektet har eller har hatt en opioidavhengighet, addiksjon eller vane, som omfatter flere administrasjoner av en forløperformulering ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 11, en gang i uke, en gang i annenhver uke, eller en gang i måneden.

17. En forløperformulering for bruk ifølge krav 16, hvor fremgangsmåten omfatter i det minste seks administrasjoner av nevnte forløperformulering i perioder på 28 ± 7 dager mellom hver administrering.

18. En forløperformulering ifølge krav 14, for bruk i en fremgangsmåte for overgang fra buprenorfin, en gang om dagen sublingual, til en vedvarende buprenorfin-formulering, ved et subjekt, som omfatter administrering av en månedlig buprenorfin-depotforløperformulering ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 11, til nevnte subjekt, som omfatter 0,5 til 3 ganger den forrige daglige buprenorfin-dosen.