



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2915525 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/00 (2006.01)
A61K 9/20 (2006.01)
A61K 31/4748 (2006.01)
A61K 31/485 (2006.01)
A61P 25/04 (2006.01)
A61P 25/30 (2006.01)
A61P 25/36 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.11.08
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.08.11
(86)	European Application Nr.	15156024.0
(86)	European Filing Date	2012.09.18
(87)	The European Application's Publication Date	2015.09.09
(30)	Priority	2011.09.19, US, 201161536180 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
(62)	Divided application	EP2706986, 2012.09.18
(73)	Proprietor	Orexo AB, Box 303, 751 05 Uppsala, Sverige
(72)	Inventor	Fischer, Andreas, Orexo ABBox 303, SE-751 05 Uppsala, Sverige
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54)	Title	Sublingual abuse-resistant tablets comprising buprenorphine and naloxone
(56)	References Cited:	WO-A1-2008/068471 US-A1- 2011 033 542 WO-A1-2005/117838 Anonymous: "Suboxone : European public assessment report - Scientific Discussion", , 19 October 2006 (2006-10-19), XP055621162, Retrieved from the Internet: URL: https://www.ema.europa.eu/en/documents/scientific-discussion/suboxone-epar-scientific-discussion_en.pdf [retrieved on 2019-09-11]

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/>

EP2915525

1

Patentkrav

1. Tablett som er egnet for sublingual administrering, omfattende:

- 5 (a) mikropartikler av en farmakologisk effektiv mengde buprenorfin eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav;
- (b) partikler av en svak syre;
- (c) partikler av en farmakologisk effektiv mengde nalokson eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav;
- 10 (d) et doseforhold mellom buprenorfin:nalokson på 4:1 ($\pm 10\%$; beregnet som frie baser); og
- (e) et desintegreringsmiddel,
- hvori når pH-en måles ved å dryppe en vandig USP/NF-kaliumfosfatbuffer med en pH på 6,8 med en rate på 2 ml per minutt gjennom et rør med en indre diameter på 3 mm på tablettens plassert på toppen av et silikafilter med
- 15 porøsitet 1 med 20 mm diameter i en glasstrakt med en øvre indre diameter på 55 mm, i hvilken avstanden mellom enden av røret og silikafilteret i trakten er 7,5 cm, og pH måles ved utløpet av glasstrakten, utviser tablettens:
- (i) et maksimalt pH-fall fra 6,8 mellom 0,5 og 5 pH-enheter innen 1 minutt ($\pm 10\%$); etterfulgt av
- 20 (ii) en retur til den opprinnelige pH-en ($\pm 0,5$) innen 3 minutter ($\pm 10\%$), der med pH-fallet og økningen måles fra begynnelsen av drypp fra utløpet av glasstrakten.

2. Tablett ifølge krav 1, hvori dosen buprenorfin er 11,4 mg, 8,6 mg, 5,7 mg, 25 2,9 mg eller 1,4 mg; og dosen nalokson er henholdsvis 2,9 mg, 2,2 mg, 1,4 mg, 0,7 mg og 0,4 mg.

3. Tablett ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori mikropartiklene av buprenorfin eller salt derav iblandes assosiativt sammen med 30 partiklene av svak syre.

4. Tablett ifølge krav 3, hvori iblandingen omfatter å blande mikropartiklene av buprenorfin eller salt derav, sammen med partiklene av svak syre.

EP2915525

2

5 **5.** Tablett ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori det svakt sure materialet omfatter sitronsyre, vinsyre, eplesyre, fumarsyre, adipinsyre, ravsyre, melkesyre, eddiksyre, oksalsyre, maleinsyre, ammoniumklorid eller en kombinasjon derav.

5 **6.** Tablett ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, i hvilken mikropartikler av buprenorfin eller farmasøytisk akseptabelt salt derav er festet til, klebet til eller assosiert med overflatene til større bærerpartikler.

10 **7.** Tablett ifølge krav 6, i hvilken partiklene av den svake syren i det minste delvis, presenteres på overflatene av og/eller mellom bærerpartiklene.

15 **8.** Tablett ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori desintegreringsmiddelet er valgt fra gruppen krysskarmellosenatrium, natriumstivelsesglykolat, kryssbundet polyvinylpyrrolidon eller blandinger derav.