



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2968121 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/00 (2006.01)
A61K 31/485 (2006.01)
A61K 45/06 (2006.01)
A61K 47/18 (2017.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2019.03.18
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.12.19
(86)	European Application Nr.	14721650.1
(86)	European Filing Date	2014.03.14
(87)	The European Application's Publication Date	2016.01.20
(30)	Priority	2013.03.15, US, 201313842543 2014.03.04, US, 201414196082
(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
(73)	Proprietor	Aquestive Therapeutics, Inc., 30 Technology Drive, Warren, NJ 07059, USA
(72)	Inventor	MYERS, Garry, L., 2353 Pendragon Road, Kingsport, TN 37660, USA DADEY, Eric, 3320 Lancashire Road, Furlong, PA 18925, USA
(74)	Agent or Attorney	Nordic Patent Service A/S, Bredgade 30, 1260 KØBENHAVN K, Danmark

(54)	Title	SUBLINGUAL AND BUCCAL FILM COMPOSITIONS
(56)	References Cited:	WO-A1-2005/117838, US-A1- 2011 033 542, US-A1- 2011 033 541

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. Selvbærende mukoadhesiv filmdoseringssammensetning som omfatter:

a. en polymerbærermatrise;

b. en terapeutisk effektiv mengde av buprenorfin eller et farmasøytisk akseptabelt

5 salt derav;

c. en terapeutisk effektiv mengde av nalokson eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav; og

d. en kelator;

hvorfor forholdet mellom nalokson eller farmasøytisk akseptabelt salt derav til kelatoren

10 er fra 40:1 til 1:10 i vekt;

og hvorfor kelatoren er valgt fra gruppen som består av etylendiamintetraeddiksyre eller et salt derav, et protein, en polynukleinsyre, glutaminsyre, histidin, en organisk disyre, et polypeptid, fytokelatin, hemoglobin, klorofyll, huminsyre, et fosfonat, transferrin, desferoksamin og kombinasjoner derav.

15

2. Sammensetningen ifølge krav 1, hvorfor forholdet mellom nalokson eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav og kelatoren er fra 4:1 til 1:10 i vekt.

3. Sammensetningen ifølge krav 1, hvorfor forholdet mellom nalokson eller et farmasøytisk

20 akseptabelt salt derav og kelatoren er fra 5:1 til 1:2 i vekt.

4. Sammensetningen ifølge krav 1, hvorfor forholdet mellom nalokson eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav og kelatoren er fra 1:2 til 2:1 i vekt.

25 5. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, hvorfor kelatoren er etylendiamintetraeddiksyre eller et salt derav, for eksempel etylendiamintetraeddiksyredinatriumsalt, etylendiamintetraeddiksyretetraammoniumsalt, etylendiamintetraeddiksyretetranatriumsalt, etylendiamintetraeddiksyrekalsiumdinatriumsalt, etylendiamintetraeddiksyretetrakaliumsalt eller etylendiamintetraeddiksyrediammoniumsalt.

30

6. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, hvorfor kelatoren er etylendiamintetraeddiksyredinatriumsalt.

7. Sammensetningen ifølge krav 1, hvorfor kelatoren er til stede i en mengde på 0,1 til 10

vekt-% av den totale filmdoseringssammensetningen; eventuelt hvori kelatoren er til stede i en mengde av:

- (i) 0,5 til 7,5 vekt-% av den totale filmdoseringssammensetningen; eller
- (ii) 1 til 2 vekt-% av den totale filmdoseringssammensetningen.

5

8. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst foregående krav, som videre omfatter en buffer; eventuelt hvori bufferen er til stede i en mengde fra 2:1 til 1:5 i vekt mellom buffer og buprenorfin.

10 9. Filmdoseringssammensetningen ifølge krav 8, hvori bufferen omfatter natriumsitrat, sitronsyre, ravsyre, eplesyre, fosforsyre, borsyre og kombinasjoner derav.

10. Sammensetningen ifølge krav 1, hvori polymermatrisen omfatter polyetylenoksid alene eller i kombinasjon med en andre polymerkomponent.

15

11. Sammensetningen ifølge krav 10, hvori polyetylenoksidet er til stede i en mengde på 30 til 70 vekt-% av polymermatrisen.

20 12. Sammensetningen ifølge krav 10 eller krav 11, hvori den andre polymerkomponenten omfatter en vannløselig polymer, en vannsvellbar polymer, en vannuløselig polymer, en bionedbrytbar polymer eller en hvilken som helst kombinasjon derav.

13. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst foregående krav, hvori buprenorfinet eller det farmasøytisk akseptable saltet derav er til stede i en mengde på fra 2 til 16 mg.

25

14. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst foregående krav, hvori vektforholdet mellom buprenorfin og nalokson er fra 6:1 til 2:1, fortrinnsvis hvori vektforholdet mellom buprenorfin og nalokson er 4:1.

30 15. Sammensetningen ifølge krav 1, hvori buprenorfinet eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav er buprenorfinhydroklorid; hvori naloksonet eller det farmasøytisk akseptable saltet derav er naloksonhydroklorid; hvori kelatoren er etylendiamintetraeddiksyredinatriumsalt; hvori forholdet mellom naloksonhydroklorid og etylendiamintetraeddiksyredinatriumsalt er fra 4:1 til 1:2 i vekt; og hvori sammensetningen videre omfatter sitronsyre.

16. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst foregående krav, hvori sammensetningen ikke omfatter en antioksidant.

5 17. Sammensetning ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene for anvendelse ved behandling av smerte.

18. Sammensetningen for anvendelsen ifølge krav 17, hvori
 10 filmdoseringssammensetningen administreres til brukeren gjennom en slimhinne-membran; eventuelt hvori sammensetningen administreres bukkalt eller sublingualt.

19. Anvendelse av et chelateringsmiddel valgt fra etylendiamintetraeddiksyre eller et salt derav, et protein, en polynukleinsyre, glutaminsyre, histidin, en organisk disyre, et polypeptid, fytochelatin, hemoglobin, klorofyll, huminsyre, et fosfonat, transferrin, desferoksamin, og
 15 kombinasjoner derav, for å forhindre eller redusere oksidasjon av nalokson i en filmsammensetning som omfatter nalokson;

eventuelt hvori filmsammensetningen er en selvbærende filmdoseringssammensetning ifølge krav 1;

eventuelt hvori kelatoren er valgt fra etylendiamintetraeddiksyre eller et salt derav, for
 20 eksempel etylendiamintetraeddiksyredinatriumsalt,
 etylendiamintetraeddiksyretetraammoniumsalt, etylendiamintetraeddiksyretetranatriumsalt,
 etylendiamintetraeddiksyrekalsiumdinatriumsalt, etylendiamintetraeddiksyretetrakaliumsalt
 eller etylendiamintetraeddiksyrediammoniumsalt.