



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3072510 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/05 (2006.01)
A61K 31/232 (2006.01)
A61K 31/7024 (2006.01)
A61P 9/00 (2006.01)
A61P 9/14 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2019.08.19
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.05.08
(86)	European Application Nr.	16165946.1
(86)	European Filing Date	2013.03.11
(87)	The European Application's Publication Date	2016.09.28
(30)	Priority	2012.03.30, US, 201261618161 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
(73)	Proprietor	Micelle BioPharma, Inc., 2129 N. Congress Avenue, Riviera Beach, Florida 33404, USA
(72)	Inventor	SANCILIO, Frederick, 19060 S.E. Reach Island Lane, Jupiter, Florida 33458, USA CACACE, Janice, 8442 6th ST N, St. Petersburg, Florida 33702, USA DAHIM, Mohand, 45 Orchard Drive, Gaithersburg, Maryland 20878, USA PERSICANER, Peter, 17070 Royal Cove Way, Boca Raton, Florida 33496, USA
(74)	Agent or Attorney	Nordic Patent Service A/S, Bredgade 30, 1260 KØBENHAVN K, Danmark

(54) Title **OMEGA-3 FATTY ACID ESTER COMPOSITIONS**

(56) References
Cited:

WO-A1-00/48592
EP-A1- 1 946 755
EP-A1- 2 433 630
WO-A2-2012/032414
WO-A1-2011/048493
WO-A2-2012/032417
EP-A1- 1 782 807
WO-A1-99/29316

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 minst én omega-3-fettsyreester og minst ett overflateaktivt middel; hvori den minst ene omega-3-fettsyreesteren omfatter minst 40 vekt-%
5 av sammensetningen, hvori det minst ene overflateaktive midlet omfatter en kombinasjon av minst ett polysorbat og minst én poloksamer, det minst ene polysorbatet omfatter fra 15 til 31 vekt-%, hvori den minst ene poloksameren omfatter fra 0,5 til 5 vekt-% av sammensetningen, hvori den minst ene poloksameren er poloksamer 237, og hvori sammensetningen er fri for omega-3-frie fettsyrer.
10
2. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1, hvori polysorbatet er polysorbat 80.
3. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori den minst ene omega-3-fettsyreesteren er valgt fra heksadekatriensyre,
15 α -linolensyre, stearidonsyre, eikosatriensyre, eikosapentaensyre, heneikosapentaensyre, dokosapentensyre, dokosaheksaensyre, tetrakosapentensyre, tetrakosaheksaensyre, eller kombinasjoner derav.
4. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 2 eller 3, hvori omega-3-
20 fettsyreesteren er et etylesterderivat av omega-3-fettsyreesteren.
5. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori omega-3-fettsyreesteren er DHA-ester eller EPA-ester.
- 25 6. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 5, hvori DHA-esteren eller EPA-esteren er hovedsakelig ren.
7. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori den minst ene omega-3-fettsyreesteren omfatter en første omega-3-fettsyreester
30 valgt fra gruppen som består av en ester av heksadekatriensyre, α -linolensyre, stearidonsyre, eikosatriensyre, eikosapentaensyre, heneikosapentaensyre, dokosapentensyre, dokosaheksaensyre, tetrakosapentensyre, tetrakosaheksaensyre, eller kombinasjoner derav og en andre omega-3-fettsyreester valgt fra gruppen som består av en ester av heksadekatriensyre, α -linolensyre, stearidonsyre, eikosatriensyre, eikosapentaensyre, heneikosapentaensyre,

dokosapentensyre, dokosaheksaensyre, tetrakosapentensyre, tetrakosaheksaensyre eller kombinasjoner derav, hvori de første og andre omega-3-fettsyreesterne er forskjellige.

8. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 3 eller 4, hvori omega-3-fettsyreesteren er et etylesterderivat av omega-3-fettsyreesteren.
9. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 7 eller 8, hvori den første omega-3-fettsyreesteren er EPA og den andre omega-3-fettsyreesteren er DHA.
10. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 9, hvori DHA-et er hovedsakelig rent.
11. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori sammensetningen videre omfatter minst én antioksidant.
12. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 11, hvori den minst ene antioksidanten er valgt fra gruppen som består av minst ett tokoferol, minst ett tokotrienol eller en kombinasjon derav.
13. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 12, hvori sammensetningen omfatter fra 0,01 vekt-% til 5 vekt-% av det minst ene tokoferolet, det minst ene tokotrienolet, eller kombinasjonen derav.
14. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori sammensetningen videre omfatter minst ett terpen.
15. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 14, hvori det minst ene terpenet er d-limonen eller naturlig appelsinolje.
16. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 15, hvori sammensetningen omfatter fra 0,01 vekt-% til 5 vekt-% av det d-limonen eller naturlig appelsinolje.
17. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1, hvori den minst ene omega-3-fettsyreesteren er en ester av en farmasøytisk blandet fettsyresammensetning hvor minst 80 vekt-% av den farmasøytisk blandede fettsyresammensetningen omfatter en kombinasjon av

(alle-Z omega-3)-5,8,11,14,17-eikosapentaensyrer (EPA) og (alle-Z-omega-3)-4,7,10,13,16,19-dokosaheksaensyrer (DHA) i et vektforhold av EPA:DHA på fra 1:2 til 2:1; og hvori (alle-Z-omega-3)-6,9,12,15,18-heneikosapentaensyre er til stede i en mengde på minst én vektprosent.

5 18. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 17, hvori andre omega-3-fettsyrer enn EPA og DHA er til stede i en mengde på minst 1,5 vekt-% av de totale fettsyrene.

19. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 17, hvori minst 3 vekt-% av sammensetningen omfattes av andre omega-3-fettsyrer enn EPA og DHA som har 18, 20, 21
10 eller 22 karbonatomer.

20. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1, hvori den minst ene omega-3-fettsyreesteren er en ester av en farmasøytisk blandet fettsyresammensetning hvor minst 90 vekt-% av sammensetningen omfattes av langkjedede, flerumettede omega-3 fettsyrer; hvori
15 minst 80 vekt-% av den farmasøytisk blandede fettsyresammensetningen omfattes av en kombinasjon av (alle-Z-omega-3)-5,8,11,14,17-eikosapentaensyre (EPA) og (alle-Z-omega-3)-4,7,10,13,16,19-dokosaheksaensyre (DHA) i et vektforhold av EPA:DHA på fra 1:1 til 2: 1, hvor EPA utgjør 40 til 60 vekt-% av sammensetningen og DHA utgjør 25 til 45 vekt-% av
20 sammensetningen; hvori minst 4,5 vekt-% av sammensetningen omfattes av andre omega-3-fettsyrer enn EPA og DHA som har 18, 20, 21 eller 22 karbonatomer; hvori fra 1 til 4 vekt-% av sammensetningen omfattes av (alle-Z-omega-3)-6,9,12,15,18-heneikosapentaensyre; og hvori sammensetningen er i oral doseringsform og inkluderer en effektiv mengde av en farmasøytisk akseptabel antioksidant.

25 21. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 9, hvori EPA- og DHA-etylsterne til sammen omfatter fra 40 til 95 vekt-% av de totale omega-3-fettsyreesterne i sammensetningen.

22. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 9, hvori forholdet mellom EPA:DHA-etylsterne er 2,4:1 og hvori EPA- og DHA-etylsterne til sammen omfatter fra 40 til 85 vekt-% av de totale omega-3-fettsyreesterne i sammensetningen.
30

23. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 9, hvori vektforholdet mellom EPA:DHA er fra 1:1 til 2:1.

24. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori sammensetningen er for oral administrering.

5 25. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 24, hvori sammensetningen tilveiebringes i en doseringsform som er en gel eller inne i et kapselskall.

26. Farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst foregående krav for anvendelse som et medikament.

10

27. Farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst foregående krav for anvendelse i behandling av en sykdom eller lidelse valgt fra: metabolsk syndrom, makuladegenerasjon, omega-3-mangel, kognitiv svikt, inkludert som et resultat av kirurgi eller traumatisk hjerneskade (som for eksempel som følge av hjernerystelse), alvorlig depresjon, 15 selvmord, fødselsdepresjon, betennelse, primær skleroserende kolangitt, borderline personlighetsforstyrrelse hos kvinner, brystkreft, ikke-alkoholrelatert fetttsyreleversykdom og forbedring i erkjennelse og atferd hos barn.

28. Farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst foregående krav for 20 anvendelse i behandling av en kardiovaskulær tilstand eller lidelse.

29. Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 28, hvori den kardiovaskulære tilstanden eller lidelsen er valgt fra hypertensjon, hyperlipidemi, hypertriglyseridemi, aterosklerose, forbigående iskemisk angrep, systolisk dysfunksjon, 25 diastolisk dysfunksjon, aneurisme, aortadisseksjon, hjerteinfarkt, akutt hjerteinfarkt (AMI), akutt ST-segment forhøyet hjerteinfarkt (STEMI), akutt ikke-ST-segment forhøyet hjerteinfarkt (NSTEMI), angina pectoris, ustabil angina (UA), og stabil angina (SA), hjerteinfarkt, kongestiv hjertesvikt, utvidet kongestiv kardiomyopati, hypertrofisk kardiomyopati, restriktiv kardiomyopati, corpulmonale, arytmi, valvulær hjertesykdom, 30 endokarditt, lungeemboli, venøs trombose, perifer vaskulær sykdom og perifer arteriesykdom.

30. Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 27 til 29, hvori sammensetningen er for administrering med minst ett lipidsenkende eller kolesterolsenkende middel valgt fra gruppen som består av kolesterolabsorpsjonsinhibitorer,

gallesyresekvestranter/harpikser, statiner, niacin og derivater, MTP-inhibitorer, fibrater og CETP-inhibitorer.

31. Funksjonell mat omfattende sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1
5 til 30.