



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3079669 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/16 (2006.01)
A61K 9/20 (2006.01)
A61K 9/28 (2006.01)
A61K 9/48 (2006.01)
A61K 9/50 (2006.01)
A61K 38/10 (2006.01)
A61P 1/04 (2006.01)
A61P 1/12 (2006.01)
A61P 1/14 (2006.01)
A61P 29/02 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.01.18
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.09.30
(86)	European Application Nr.	14824655.6
(86)	European Filing Date	2014.12.11
(87)	The European Application's Publication Date	2016.10.19
(30)	Priority	2013.12.11, US, 201361914951 P 2013.12.11, US, 201361914952 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	Ironwood Pharmaceuticals, Inc., 100 Summer Street, Suite 2300, Boston, MA 02110, USA Forest Laboratories Holdings Limited, Victoria Place, 5th Floor 31 Victoria Street, Hamilton, Bermuda
(72)	Inventor	FRETZEN, Angelika, 7 Avon Street, Somerville, MA 02143, USA CURRIE, Mark G., 197 8th Street, PH21, Boston, MA 02129, USA HASHASH, Ahmad, 5 Oland Lane, Southborough, MA 01772, USA DEDHIYA, Mahendra, 1 Lea Court, Pomona, NY 10970, USA MO, Yun, 60 Fairfield Way Apt. 1, Commack, NY 11725, USA CHHETTRY, Anil, 11 Hickory Hill Drive, Holtsville, NY 11742, USA MILLER, Matthew, 501 Harrison Street Apt. 416W, Hoboken, NJ 07030-6480, USA SANGHVI, Ritesh, 40 Fairfield Way Apt. 12, Commack, NY 11725, USA BARI, Mohammad Mafruhul, 14 Virginia Road, Lake Grove, NY 11755, USA GRILL, Andreas, 5 June Street, Hauppauge, NY 11788, USA

(74) Agent or Attorney ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54)	Title	DELAYED RELEASE COMPOSITIONS OF LINACLOTIDE
(56)	References Cited:	WO-A2-2014/131024 WO-A2-2010/019266 US-A1- 2011 059 903 WO-A1-2012/034068 WO-A1-2011/020054 WO-A1-2013/025969 DATABASE WPI Section Ch, Week 201326 Thomson Scientific, London, GB; Class A96, AN 2013-F10566 XP002736499, ASHIHARA K ET AL: "Particulate form pharmaceutical composition useful for treating gastrointestinal disorders, obtained by coating nucleus with layer containing material having damp-proofing function, and drug layer containing linaclotide", -& WO 2013/047795 A ((ASTE) ASTELLAS PHARMA INC) 4 April 2013 (2013-04-04) -& US 2014/242158 A1 (NISHIURA MARE [JP] ET AL) 28 August 2014 (2014-08-28) BLOMAIN ERIK S ET AL: "Translating colorectal cancer prevention through the guanylyl cyclase C signaling axis", EXPERT REVIEW OF CLINICAL PHARMACOLOGY, vol. 6, no. 5, 1 September 2013 (2013-09-01), pages 557-564, XP008175159, ISSN: 1751-2441

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/>

EP 3079669

1

Patentkrav

1. Forsinket frisetningssammensetning omfattende en enterisk belagt tablett, hvori tablettene omfatter:

5

linaklotid;

Ca²⁺;

histidin; og

polyvinylalkohol (PVA).

10

2. Sammensetningen ifølge krav 1, hvori det enteriske belegget omfatter metylakrylat-metakrylsyre-kopolymerer; celluloseacetatsukkinat (CAS); hydroksypropylmetylcelluloseftalat (HPMCP); hydroksypropylmetylcelluloseacetatsukkinat (HPMCAS); polyvinylacetatftalat (PVAP); metylmetakrylat-metakrylsyre-kopolymerer; natriumalginat og

15

stearinsyre; guargummi; eller blandinger derav.

3. Sammensetningen ifølge krav 1 eller 2, hvori det enteriske belegget er valgt fra metylmetakrylat-metakrylsyre-kopolymerer.

20

4. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-3, ytterligere omfattende en beskyttende polymerfilm eller underbelegg.

5. Sammensetningen ifølge krav 4, hvori sammensetningen omfatter ytterligere PVA som et beskyttende lag mellom tablettene og det enteriske belegget.

25

6. Sammensetningen ifølge hvilke som helst av kravene 1-5, hvori sammensetningen frisetter minst 70 % av linaklotidet ved en pH større enn 5 eller 7.

30

7. Sammensetningen ifølge hvilke som helst av kravene 1-5, hvori sammensetningen frisetter minst 80 % av linaklotidet ved en pH større enn 5 eller 7.

EP 3079669

2

8. Sammensetningen ifølge hvilke som helst av kravene 1-7, hvori sammensetningen har en desintegrasjonshastighet på mindre enn 30 sekunder ved en pH større enn 5 eller 7.

5 **9.** Sammensetningen ifølge hvilke som helst av kravene 1-8, hvori sammensetningen frisetter linaklotid i ileum, terminal ileum eller kolon.

10. Sammensetningen ifølge hvilke som helst av kravene 1-9, hvori sammensetningen desintegrerer i ileum eller kolon.

10

11. Sammensetningen ifølge krav 1, hvori sammensetningen omfatter en pH-sensitiv polymer.

15

12. Enkeltdoseringsform omfattende sammensetningen ifølge hvilke som helst av kravene 1-11.

13. Enkeltdoseringsformen ifølge krav 12, hvori linaklotidet er til stede i sammensetningen i en mengde mellom 1 ug og 300 ug.

20

14. Sammensetning ifølge hvilke som helst av kravene 1-11 for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av en gastrointestinal forstyrrelse hos en pasient.

25

15. Sammensetningen for anvendelse ifølge krav 14, hvori den gastrointestinale forstyrrelsen er valgt fra gruppen bestående av: irritabel tarmsyndrom (IBS), forstoppelse, en funksjonell gastrointestinal forstyrrelse, gastroøsofageal reflukssykdom, funksjonell halsbrann, dyspepsi, divertikulitt, visceral smerte, abdominal smerte, gastroparese, kronisk intestinal pseudoobstruksjon, kolon-pseudoobstruksjon, Crohns sykdom, ulcerøs kolitt og inflammatorisk tarmsykdom.

30

16. Sammensetningen for anvendelse ifølge krav 15, hvori den gastrointestinale forstyrrelsen er forstoppelse.

EP 3079669

3

17. Sammensetningen for anvendelse ifølge krav 16, hvori forstoppelsen er kronisk forstoppelse, idiopatisk forstoppelse, kronisk idiopatisk forstoppelse, forstoppelse forårsaket av postoperativ ileus eller forstoppelse forårsaket av opiatbruk.

5

18. Sammensetningen for anvendelse ifølge krav 15, hvori den gastrointestinale forstyrrelsen er irritabel-tarmsyndrom (IBS).

19. Sammensetningen for anvendelse ifølge krav 18, hvori irritabel-tarmsyndromet er forstoppelse-predominant irritabel tarmsyndrom (IBS-c), diaré-predominant irritabel-tarmsyndrom (IBS-d) eller blandede irritabel-tarmsyndromer (IBS-m).

10

20. Sammensetning ifølge hvilke som helst av kravene 1-11 for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling eller lindring av smerte hos en pasient.

15

21. Sammensetningen for anvendelse ifølge krav 20, hvori smerten er valgt fra visceral smerte; divertikulitt smerte; bekkensmerter; magesmerter; eller smerte assosiert med gastrointestinale forstyrrelser, veneriske sykdommer, endometriose, vulvodyni, blæresmertesyndrom eller interstitiell cystitt.

20