



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3160471 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

A61K 31/46 (2006.01)

A61K 31/245 (2006.01)

A61K 9/00 (2006.01)

A61K 47/02 (2006.01)

A61K 9/08 (2006.01)

A61P 27/02 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2022.09.19
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2022.06.01
(86)	European Application Nr.	15811865.3
(86)	European Filing Date	2015.06.23
(87)	The European Application's Publication Date	2017.05.03
(30)	Priority	2014.06.24, US, 201462016502 P 2014.12.23, US, 201462096433 P 2015.04.23, US, 201562151926 P 2015.05.29, US, 201514726139
(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	Sydnexis, Inc., 445 Marine View Ave. Suite 295, Del Mar, CA 92014, USA
(72)	Inventor	OSTROW, Gregory, I., 14051 Caminito Vistana, San Diego, CA 92130, USA WIDDER, Kenneth, J., P.O. Box 676250, Rancho Santa Fe, CA 92067, USA BAKER, David, S., 7205 Aviara Drive, Carlsbad, CA 92011, USA
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54)	Title	OPHTHALMIC COMPOSITIONS COMPRISING A MUSCARINIC ANTAGONIST AND DEUTERATED WATER
------	-------	--

(56)	References Cited:	WO-A2-2010/083129	US-A-5 716 952
		WO-A2-2011/137449	WO-A1-97/16192
		WO-A2-2008/008330	WO-A2-2011/019940
		US-A1-2012 015 035	CN-A-101 468 214
		US-A1-2012 028 910	WO-A2-2012/111029

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. Oftalmisk sammensetning, omfattende fra 0,001 vekt% til 0,05 vekt% av en muskarinantagonist og deuterert vann, ved en pD på fra 4,2 til 7,9, hvor
5 muskarinantagonisten er atropin eller atropinsulfat.
2. Oftalmisk sammensetning ifølge krav 1, hvor den oftalmiske sammensetningen har en pD på én av: mindre enn 7,3, mindre enn 7,2, mindre enn 7,1, mindre enn 7, mindre enn 6,8, mindre enn 6,5, mindre enn 6,4, mindre
10 enn 6,3, mindre enn 6,2, mindre enn 6,1, mindre enn 6, mindre enn 5,9, mindre enn 5,8, mindre enn 5,2 eller mindre enn 4,8 etter en forlenget tidsperiode under lagringsbetingelser.
3. Oftalmisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1-2, hvor
15 den oftalmiske sammensetningen omfatter én av: minst 80%, minst 85%, minst 90%, minst 93%, minst 95%, minst 97%, minst 98% eller minst 99% av muskarinantagonisten basert på startkonsentrasjon etter en forlenget tidsperiode under lagringsbetingelser.
- 20 4. Oftalmisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1-3, hvor den oftalmiske sammensetningen videre har en potens på én av: minst 80%, minst 85%, minst 90%, minst 93%, minst 95%, minst 97%, minst 98% eller minst 99% etter en forlenget tidsperiode under lagringsbetingelser.
- 25 5. Oftalmisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1-4, hvor forlengede tidsperioden er én av: 1 uke, 2 uker, 3 uker, 1 måned, 2 måneder, 3 måneder, 4 måneder, 5 måneder, 6 måneder, 8 måneder, 10 måneder, 12 måneder, 18 måneder, 24 måneder, 36 måneder, 4 år eller 5 år.
- 30 6. Oftalmisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1-5, hvor lagringsbetingelsene har en lagringstemperatur på fra 2°C til 10°C eller fra 16°C til 26°C.
- 35 7. Oftalmisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1-6, hvor muskarinantagonisten forefinnes i sammensetningen i en konsentrasjon på én av: fra 0,001 vekt% til 0,03 vekt%, fra 0,001 vekt% til 0,025 vekt%, fra 0,001

vekt% til 0,02 vekt%, fra 0,001 vekt% til 0,01 vekt%, fra 0,001 vekt% til 0,008 vekt% eller fra 0,001 vekt% til 0,005 vekt%.

- 5 8. Oftalmisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1-7, hvor den oftalmiske sammensetningen videre omfatter: et osmolaritetsregulerende middel, fortrinnsvis natriumklorid; et konserveringsmiddel, fortrinnsvis valgt fra benzalkoniumklorid, cetrimon, natriumperborat, stabilisert oksyklorkompleks, SofZia, polykvaternium-1, klorbutanol, edetat-dinatrium, polyheksametylen-
10 biguanid eller kombinasjoner derav; et buffermiddel, fortrinnsvis valgt fra borater, borat-polyol-komplekser, fosfatbufringsmidler, sitratbufringsmidler, acetatbufringsmidler, karbonatbufringsmidler, organiske bufringsmidler, aminosyrebufringsmidler eller kombinasjoner derav; et tonisitetsregulerende middel; eller en kombinasjon derav.
- 15 9. Oftalmisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1-8, hvor den oftalmiske sammensetningen er i det vesentlige fri for prokain og benactyzin, eller farmasøytisk akseptable salter derav.
- 20 10. Oftalmisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1-9, hvor den oftalmiske sammensetningen videre omfatter et pD-regulerende middel valgt fra deuterert saltsyre (DCl), deuterert natriumhydroksid (NaOD), deuterert eddiksyre (CD₃COOD) og deuterert sitronsyre (C₆D₈O₇).
- 25 11. Oftalmisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1-9, hvor den oftalmiske sammensetningen videre omfatter et pH-regulerende middel valgt fra HCl, NaOH, CH₃COOH og C₆H₈O₇.
- 30 12. Oftalmisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1-11, hvor den oftalmiske sammensetningen omfatter én av: mindre enn 5% H₂O, mindre enn 4% H₂O, mindre enn 3% H₂O, mindre enn 2% H₂O, mindre enn 1% H₂O, mindre enn 0,5% H₂O, mindre enn 0,1% H₂O eller 0% H₂O.
- 35 13. Oftalmisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1-12, hvor den oftalmiske sammensetningen ikke er formulert som en injiserbar formulering.

14. Oftalmisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1-13, hvor den oftalmiske sammensetningen er formulert som en oftalmisk løsning for behandling av en oftalmisk lidelse valgt fra pre-myopi, myopi eller progresjon av myopi.

5

15. Oftalmisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1-14, for bruk i en fremgangsmåte for å stanse utvikling av myopi eller forebygge utvikling av myopi, omfattende å administrere, til et øye til et individ med behov for dette, en virksom mengde av den oftalmiske sammensetningen.

10

16. Oftalmisk sammensetning for bruk ifølge krav 15, hvor den oftalmiske sammensetningen blir lagret ved mellom 2°C og 10°C før første bruk.

17. Oftalmisk sammensetning for bruk ifølge krav 15, hvor den oftalmiske sammensetningen blir lagret ved mellom 16°C og 26°C etter første bruk.

15

18. Oftalmisk sammensetning for bruk ifølge krav 15, hvor bruken er i en fremgangsmåte for å redusere en hastighet av forsterkning av myopi.