



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3206672 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/58 (2006.01)
A61K 9/10 (2006.01)
A61K 31/445 (2006.01)
A61P 23/02 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2018.08.20
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.03.14
(86)	European Application Nr.	16791778.0
(86)	European Filing Date	2016.10.27
(87)	The European Application's Publication Date	2017.08.23
(30)	Priority	2015.10.27, US, 201562247159 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	Eupraxia Pharmaceuticals Inc., 204-2590 Cadboro Bay Road, Victoria, British Columbia V8R 5J2, CA-Canada
(72)	Inventor	HELLIWELL, James A, c/o Eupraxia Pharmaceuticals Inc.2590 Cadboro Bay RoadUnit 204, Victoria, British Columbia V8R 5J2, CA-Canada MALONE, Amanda, c/o Eupraxia Pharmaceuticals Inc.2590 Cadboro Bay RoadUnit 204, Victoria, British Columbia V8R 5J2, CA-Canada CHAPANIAN, Rafi, c/o Eupraxia Pharmaceuticals Inc.2590 Cadboro Bay RoadUnit 204, Victoria, British Columbia V8R 5J2, CA-Canada LIGGINS, Richard, c/o Eupraxia Pharmaceuticals Inc.2590 Cadboro Bay RoadUnit 204, Victoria, British Columbia V8R 5J2, CA-Canada
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

(54)	Title	SUSTAINED RELEASE FORMULATIONS OF LOCAL ANESTHETICS
(56)	References Cited:	WO-A1-2014/153541, RABINOW BARRETT ET AL: "Intra-articular (IA) Ropivacaine Microparticle Suspensions Reduce Pain, Inflammation, Cytokine, and Substance P Levels Significantly More than Oral or IA Celecoxib in a Rat Model of Arthritis", INFLAMMATION, PLENUM PRESS, NEW YORK, NY, US, vol. 38, no. 1, 5 September 2014 (2014-09-05), pages 40-60, XP035438973, ISSN: 0360-3997, DOI: 10.1007/S10753-014-0006-Z [retrieved on 2014-09-05], WO-A1-2004/058223

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:

en flerhet mikropartikler, der hver mikropartikkel inkluderer:

- 5 (1) én eller flere krystaller av et lokalanestesimiddel; og
(2) et polyvinylalkohol(PVA)-overtrekk som fullstendig innkapsler den ene eller de flere krystallene, hvori PVA-overtrekket er minst 85 % hydrolysert og utgjør 1-30 vekt-% av mikropartikkelen, og hvori den ene eller de flere krystallene av lokalanestesimidlet utgjør 70-99 vekt-% av mikropartikkelen, og hver har minst
10 én dimensjon i området 35-500 µm.

2. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1, hvori PVA-overtrekket er minst 99 % hydrolysert.

3. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-2, hvori PVA-overtrekket er tverrbundet.

4. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-3, hvori PVA-overtrekket er termisk herdet og fysisk tverrbundet.

5. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 4, hvori termisk herding finner sted i 2-8 timer ved 100-135 °C.

6. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-3, hvori PVA-overtrekket er kjemisk tverrbundet i nærvær av et tverrbindingsmiddel.

7. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 6, hvori PVA-overtrekket omfatter mindre enn 5 vekt-% tverrbindingsmiddel.

8. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 6 eller krav 7, hvori tverrbindingsmidlet er sitronsyre.

9. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-8, hvori PVA-overtrekket har en molekylvekt på 2-200 kDa eller fortrinnsvis 140-190 kDa.

- 5 **10.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-8, hvori lokalanestesimidlet har en oppløsningsrate som er minst 5 ganger eller 7 ganger eller 10 saktere enn oppløsningsraten til det ikke-overtrukne lokalanestesimidlet i samme oppløsningsmedium.
- 10 **11.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-10, hvori lokalanestesimidlet er et aminoamidlegemiddel.
- 10 **12.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-11, hvori lokalanestesimidlet omfatter mer enn én krystall bundet ved hjelp av et terapeutisk inaktivt middel.
- 15 **13.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-12, hvori lokalanestesimidlet er ropivakain.
- 15 **14.** Farmasøytisk sammensetning ifølge hvilke som helst av kravene 1-13 for anvendelse i postoperativ smertelindring på et sårsted.
- 20 **15.** Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 14, hvori lokalanestesimidlet frisettes vedvarende over 3-5 dager postoperativt.