



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3923914 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

A61K 9/20 (2006.01)

A61K 9/48 (2006.01)

A61K 31/4545 (2006.01)

A61K 31/675 (2006.01)

A61K 47/18 (2006.01)

A61P 31/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2023.06.05
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.04.12
(86)	European Application Nr.	20704307.6
(86)	European Filing Date	2020.02.14
(87)	The European Application's Publication Date	2021.12.22
(30)	Priority	2019.02.14, EP, 19157255
(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	Debiopharm International S.A., Forum "après-demain" Chemin Messidor 5-7, 1002 Lausanne, Sveits
(72)	Inventor	COLIN, Aude Anne-Laure, 267A rue de Rouly Résidence le Belvédère, 74500 Publier, Frankrike DECRETTE, Marie, 199 rue de la confrérie, 74500 Publier, Frankrike CHABAUD, Sebastien, Störklingasse 44, 4125 Riehen, Sveits
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54)	Title	AFABICIN FORMULATION, METHOD FOR MAKING THE SAME
------	-------	---

(56)	References
------	------------

Cited:

WO-A1-2013/190384

MENETREY A ET AL: "Mass Balance, Pharmacokinetics and Metabolism of the Antimicrobial Afabycin Following Intravenous and Oral Administration in Humans", CLINICAL THERAPEUTICS, vol. 39, no. 8, 1 August 2017 (2017-08-01), XP085081791, ISSN: 0149-2918, DOI: 10.1016/J.CLINTHERA.2017.05.200

MARKUS LAKEMEYER ET AL: "Thinking Outside the Box-Novel Antibacterials To Tackle the Resistance Crisis", ANGEWANDTE CHEMIE, INTERNATIONAL EDITION, 11 October 2018 (2018-10-11), XP055516777, DE ISSN: 1433-7851, DOI: 10.1002/anie.201804971

RAUTIO JARKKO ET AL: "Prodrugs - Recent approvals and a glimpse of the pipeline", EUROPEAN JOURNAL OF PHARMACEUTICAL SCIENCES, ELSEVIER, AMSTERDAM, NL, vol. 109, 4 August 2017 (2017-08-04), pages 146-161, XP085229065, ISSN: 0928-0987, DOI: 10.1016/J.EJPS.2017.08.002

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.** Fast farmasøytisk sammensetning i form av en enhetsdose som omfatter Afabicin eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav og ett eller flere farmasøytisk akseptable hjelpestoffer, **karakterisert ved at** sammensetningen inneholder en histidinforbindelse.
- 2.** Fast farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, hvori den omfatter Afabicin eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav i en mengde fra 20 mg til 480 mg.
- 3.** Fast farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1 eller 2, som inneholder histidin.
- 4.** Fast farmasøytisk sammensetning ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 3, som er i form av en tablett, hvor tablettten fortrinnsvis omfatter en indre fase og en ekstern fase, hvori Afabicin eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav fortrinnsvis er inneholdt bare i den indre fasen.
- 5.** Fast farmasøytisk sammensetning ifølge krav 4, som inneholder histidinforbindelsen kun i den indre fasen.
- 6.** Fast farmasøytisk sammensetning ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 5, hvori den inneholder et bindemiddel valgt fra gruppen bestående av povidon, copovidon, poloksamer, polyetylen glykol, magnesiumaluminosilikat, gelatin, akasie, dekstrin, dekstrater, dekstrose, polydekstrose, guar gummi, hydrogenert vegetabilsk olje, flytende glukose, voks, maltose, sukrose, laktose, voks og blandinger derav.
- 7.** Fast farmasøytisk sammensetning ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 6, som inneholder et fortynningsmiddel valgt fra gruppen bestående av mannitol, isomalt, laktose, kalsiumfosfat, kalsiumkarbonat, kalsiumsulfat, sukrose, fruktose, maltose, xylitol, maltitol, laktitol, trehalose aluminiumsilikat, cyclodekstrin, dekstrose, polydekstrose, glukose, dekstrin, dekstrater, magnesiumkarbonat og blandinger derav.
- 8.** Fast farmasøytisk sammensetning ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 7, som inneholder et overflateaktivt middel valgt fra gruppen bestående av natriumlaurylsulfat, poloksamerer, natriumdokusat, natriumdeoksykholat, sorbitanestere, sukroseestere av fettsyre, tyloksapol, lecitin og polysorbat og blandinger derav.
- 9.** Fast farmasøytisk sammensetning ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 8, som inneholder et desintegreringsmiddel valgt fra gruppen bestående av krosopovidon, magnesiumaluminosilikat, kolloidalt silisiumdioksyd, guar gummi og blandinger derav.
- 10.** Fast farmasøytisk sammensetning ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 3 og 6 til 9, som er i form av en kapsel inneholdende Afabicin eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav og ett eller flere farmasøytisk akseptable hjelpestoffer i form av et pulver eller granulat.
- 11.** Fremgangsmåte for fremstilling av den faste sammensetningen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 9, som omfatter følgende trinn i den angitte rekkefølgen:
 - (i) å tørrblande noen eller alle komponentene i sammensetningen;
 - (ii) å granulere den resulterende blanding for å oppnå et granulat;
 - (iii) å blande inn eventuelle gjenværende komponenter av sammensetningen til granulatet;
 - (iv) å komprimere den resulterende blanding for å oppnå en komprimert tablett; og
 - (v) eventuelt å belegge den resulterende komprimerte tablett.

12. Fremgangsmåte ifølge krav 11, hvori granuleringstrinnet utføres ved våtgranulering eller tørrgranulering.

13. Fremgangsmåte ifølge krav 11 eller 12, hvori minst én av følgende betingelser er oppfylt:

- (a) fortynningsmiddel er tilstede og en del av fortynningsmidlet blandes til granulatet i trinn (ii);
- (b) desintegreringsmiddel er tilstede og en del av desintegreringsmidlet blandes til granulatet i trinn (ii);
- (c) glidemiddel er tilstede og en del av eller alt glidemidlet er blandet inn i granulatet i trinn (ii); og/eller
- (d) smøremiddel er tilstede og en del av eller alt smøremidlet er blandet inn i granulatet i trinn (ii).

14. Fast farmasøytisk sammensetning ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 10 for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av bakterielle infeksjoner i et pattedyr.

15. Fast farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 14, hvori pattedyret er et menneske.

16. Fast farmasøytisk sammensetning for bruk i henhold til punkt 14 eller 15, hvori bakterieinfeksjonen er forårsaket av bakteriearten *S. aureus*, slike infeksjoner er for eksempel akutt bakteriell hud- og hudstrukturinfeksjon (ABSSI) eller bakterielle infeksjoner assosiert med diabetisk fotsyndrom.