



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2231189 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 38/13 (2006.01)
A61K 9/14 (2006.01)
A61K 9/51 (2006.01)
A61K 31/337 (2006.01)
A61K 47/20 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)
A61P 37/06 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2018.02.12
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2017.09.06
(86)	European Application Nr.	08861526.5
(86)	European Filing Date	2008.12.18
(87)	The European Application's Publication Date	2010.09.29
(30)	Priority	2007.12.19, WO, PCT/SE07/001127
(84)	Designated Contracting States:	AT ; BE ; BG ; CH ; CY ; CZ ; DE ; DK ; EE ; ES ; FI ; FR ; GB ; GR ; HR ; HU ; IE ; IS ; IT ; LI ; LT ; LU ; LV ; MC ; MT ; NL ; NO ; PL ; PT ; RO ; SE ; SI ; SK ; TR
(73)	Proprietor	Ardenia Investments Ltd., First Floor 45 Welbeck Street, London, Greater London W1G 8DZ, GB-Storbritannia
(72)	Inventor	ALEKSOV, Julian, Karins Allé 6, S-181 44 Lidingö, SE-Sverige LOKOT, Igor, Ferlinsgatan 59 nb, S-754 28 Uppsala, SE-Sverige
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Postboks 449 Sentrum, 0104 OSLO, Norge

(54)	Title	DRUG DELIVERY SYSTEM FOR ADMINISTRATION OF POORLY WATER SOLUBLE PHARMACEUTICALLY ACTIVE SUBSTANCES
(56)	References Cited:	WO-A1-01/17546, WO-A1-02/092600, WO-A2-2006/106519, WO-A2-2007/001356, HASSAN, SAADIA ET AL.: 'Cytotoxic activity of a new paclitaxel formulation, Pacliex, in vitro and in vivo' CANCER CHEMOTHER PHARMACOL vol. 55, 2005, pages 47 - 54, XP003023508, US-A1-2005 191 359, US-A1- 2007 082 838, US-B1- 6 197 809, US-A1- 2004 048 923

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. Medikamentavgivelsessystem for administrering av minst en farmasøytisk aktiv substans *per se* som har en oppløselighet i vann som er mindre enn 100 µg/ml ved 5 15-38 °C, idet substansen er i partikkelform hvor minst 90% av partiklene har en Z-gjennomsnittlig diameter på mindre enn 50 nm som målt ved dynamisk lysspredning ved bruk av rød laser med en bølgelengde på 633 nm, k a r a k t e r i s e r t v e d a t
- substanspartiklene er ikke-krystallinske eller består av krystaller med en 10 partikkelstørrelse på 10 nm eller mindre;
 - substanspartiklene er innkapslet i nanopartikler dannet av et natriumsalt av metylesteren av N-all-trans-retinoylcysteinsyre, et natriumsalt av metylesteren av N-13-cis-retinoylcysteinsyre eller en kombinasjon derav; og
 - vektforholdet mellom natriumsaltet av metylesteren av N-all-trans- 15 retinoylcysteinsyre, natriumsaltet av metylesteren av N-13-cis-retinoylcysteinsyre eller en kombinasjon derav og nevnte substans er i området fra 0,5:1 til 20:1.
2. Medikamentavgivelsessystem ifølge krav 1, k a r a k t e r i s e r t v e d a t vektforholdet mellom natriumsaltet av metylesteren av 20 N-all-trans-retinoylcysteinsyre, natriumsaltet av metylesteren av N-13-cis-retinoylcysteinsyre eller en kombinasjon derav og nevnte substans er i området fra 1:1 til 10:1.
3. Medikamentavgivelsessystem ifølge et hvilket som helst av de foregående 25 krav, k a r a k t e r i s e r t v e d a t nevnte substans er en cytotoxisk eller en cytostatisk forbindelse.
4. Medikamentavgivelsessystem ifølge krav 3, 30 k a r a k t e r i s e r t v e d a t den cytostatiske forbindelse er et taxan.
5. Medikamentavgivelsessystem ifølge krav 4, k a r a k t e r i s e r t v e d a t nevnte taxan er valgt blant paklitaxel og docetaxel.
- 35 6. Medikamentavgivelsessystem ifølge et hvilket som helst av kravene 3-5 for bruk ved behandling av kreft.

7. Medikamentavgivelsessystem ifølge et hvilket som helst av kravene 1-2, karakterisert ved at nevnte substans er et immunosuppressivt middel.

5 8. Medikamentavgivelsessystem ifølge krav 7, karakterisert ved at nevnte immunosuppressive middel er valgt blant ciklosporin, sirolimus og takrolimus.

10 9. Medikamentavgivelsessystem ifølge et hvilket som helst av kravene 7-8 for bruk i post-allogen organtransplantasjon.

10. Farmasøytisk sammensetning omfattende en farmasøytisk akseptabel bærer og medikamentavgivelsessystemet ifølge et hvilket som helst av kravene 1-5, 7 og 8.

15 11. Anvendelse av et natriumsalt av metylesteren av N-all-trans-retinoylcysteinsyre, et natriumsalt av metylesteren av N-13-cis-retinoylcysteinsyre eller en kombinasjon derav ved fremstillingen av et medikamentavgivelsessystem ifølge et hvilket som helst av kravene 1-5, 7 og 8.

20 12. Anvendelse av et medikamentavgivelsessystem ifølge et hvilket som helst av kravene 3-5 for fremstilling av et medikament for behandling av kreft.

25 13. Anvendelse av et medikamentavgivelsessystem ifølge et hvilket som helst av kravene 7-8 for fremstilling av et medikament for bruk ved post-allogen organtransplantasjon.