



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2279008 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/00 (2006.01)
A61K 9/19 (2006.01)
A61K 31/337 (2006.01)
A61K 47/64 (2017.01)
A61P 35/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2019.06.24
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.03.06
(86)	European Application Nr.	09733078.1
(86)	European Filing Date	2009.04.20
(87)	The European Application's Publication Date	2011.02.02
(30)	Priority	2008.04.18, US, 124677 P
(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 ; MK ; MT ; NL ; NO ; PL ; PT ; RO ; SE ; SI ; SK ; TR
(73)	Proprietor	Angiochem Inc., 201 President Kennedy Avenue Suite PK-R220, Montréal, QC H2X 3Y7, Canada
(72)	Inventor	DEMEULE, Michel, 343 Preston Drive, Beaconsfield, Québec H9W 1Z2, Canada CHE, Christian, 7385 Avenue Chateaubriand, MontréalQuébec H2R 2L7, Canada REGINA, Anthony, 10610 Avenue Lorimier, MontréalQuébec H2B 2J3, Canada BELIVEAU, Richard, 8cours du Fleuve, MontréalQuébec H3E 1X1, Canada GAGNON, Catherine, 11957 L'Archevêque, MontréalQuébec H1H 3B8, Canada CASTAIGNE, Jean-Paul, 455 Av Lockhart, Mont-RoyalQuébec H3P 1Y6, Canada GABATHULER, Reinhard, 201 Chemin du Golf, 702, Verdun, Quebec, H3E 1Z4, Canada
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54)	Title	PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS OF PACLITAXEL, PACLITAXEL ANALOGS OR PACLITAXEL CONJUGATES AND RELATED METHODS OF PREPARATION AND USE
------	-------	--

(56)	References Cited:	WO-A1-2006/086870 WO-A2-2004/060403 WO-A1-2006/089290 CA-A1- 2 637 893 CA-A1- 2 638 034 WO-A1-2007/009229 WO-A2-02/43765
------	----------------------	--

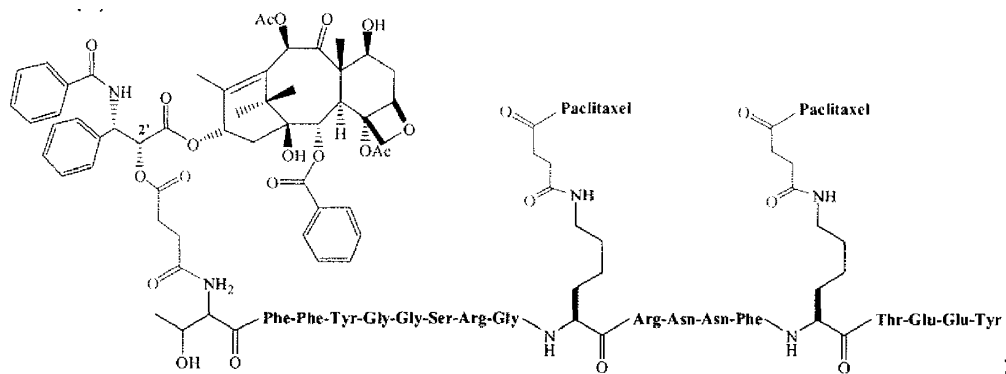
WO-A1-01/30319
WO-A2-2007/020085
WO-A1-2008/144919

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. Lyofilisert sammensetning omfattende:
 (a) ANG1005 hvori ANG1005 har strukturen:

5



(b) et valgfritt tonisitettsmiddel;

(c) et buffermiddel

10

(d) et fyllmiddel

(e) et solubilisierende middel, hvori det solubilisierende middel er en polyoksyetyler av en fettsyre; og
 (f) 0,2 til 10% DMSO.

15

2. Lyofilisert sammensetning ifølge krav 1, hvori nevnte tonisitettsmiddel er natriumklorid;

hvori nevnte buffermiddel er glycin, sitronsyre eller melkesyre;

hvori solubiliseringssmiddelet er Solutol HS 15;

hvori nevnte fyllmiddel er mannitol eller sorbitol;

20

hvori mengden DMSO er mindre enn 5%, mer spesielt mindre enn 1%, enda mer spesielt mellom 0,2% og 1,0%; og/eller hvori sammensetningen i det vesentlige er fri for polyoksyetylert ricinusolje, spesielt hvori sammensetningen er fri for polyoksyetylert ricinusolje.

25

3. Lyofilisert sammensetning ifølge krav 1, som omfatter:

Forbindelse	Prosentandel (ved ikke-vannvekt)
ANG1005	0,1-5%
Tonisitettsmiddel	1-15%
Buffermiddel	1-10%

Forbindelse	Prosentandel (ved ikke-vannvekt)
Fyllmiddel	0-15%
Solutol HS 15	40-75%
DMSO	0,2-10%

4. Lyofilisert sammensetning ifølge krav 3, som omfatter:

Forbindelse	Prosentandel (ved ikke-vannvekt)
ANG1005	1,8-2,3%
Tonisitetsmiddel	9-11%
Buffer	4,5-6%
Fyllmiddel	8-10%
Solutol HS 15	69-75%
DMSO	0,2-2

5

5. Lyofilisert sammensetning ifølge krav 3 eller 4, hvori nevnte tonisitetsmiddel er natriumklorid, nevnte buffermiddel er glycin og nevnte fyllmiddel er mannitol.

6. Lyofilisert sammensetning ifølge krav 1 omfattende

Forbindelse	Prosentandel (ved ikke-vannvekt)
ANG1005	1,8-4,0%
Buffer	0,1-6%
Fyllmiddel	2-10%
Solutol HS 15	80-95 %
DMSO	0,2-1%

10

7. Lyofilisert sammensetning ifølge krav 6, hvori bufferen er melkesyre eller sitronsyre, og nevnte fyllmiddel er mannitol.

8. Lyofilisert sammensetning ifølge krav 5 for anvendelse ved behandling av kreft, hvori fremgangsmåten omfatter administrering til en pasient som trenger det, idet

15

sammensetningen er i en mengde som er tilstrekkelig for å behandle nevnte kreft, spesielt hvori nevnte kreft er en hjernekreft, ovariekreft, lungekreft, leverkreft, miltkreft eller nyrekreft, særlig hvori hjernekreft er valgt fra gruppen bestående av glioblastom, astrocytom, gliom, meduloblastom og oligodendrom, neurogliom, ependymom og meningiom.

9. Forseglet beholder inneholdende den lyofiliserte sammensetning ifølge krav 5.

10. Kit omfattende:

- (a) den forseglede beholderen ifølge krav 5; og
- (b) bruksanvisninger.

11. Fremgangsmåte for fremstilling av en lyofilisert farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, som omfatter:

- (a) solubilisering av nevnte konjugat i et første solubiliseringsmiddel for å danne en blanding;
- (b) tilsetning av et andre solubiliseringsmiddel til blandingen i trinn (a);
- (c) eventuelt tilsetning av vann og et buffermiddel til blandingen;
- (d) lyofilisering av blandingen i trinn (c); hvori nevnte lyofilisering resulterer i en reduksjon på minst 20% av mengden av det første solubiliseringsmiddel, men reduserer ikke vesentlig mengden av det andre solubiliseringsmiddel.

12. Fremgangsmåte ifølge krav 11, hvori nevnte første solubiliseringsmiddel er DMSO;

hvori nevnte andre solubiliseringsmiddel er en polyoksyetylester av en fettsyre, særlig Solutol HS 15;

hvori blandingen i trinn (b) blir filtrert før trinn (c) lyofilisering;

hvori blandingen er plassert i et hetteglass før trinn (c) lyofilisering;

hvori fremgangsmåten videre omfatter trinn (e) for resuspendering av det lyofiliserte produkt.

13. Fremgangsmåte ifølge krav 12, hvori vann og et buffermiddel blir tilsatt i trinn (c), og trinn (d) lyofilisering omfatter:

- (i) frysing av blandingen;
- (ii) tørking av det frosne produkt ved en første temperatur og et trykk som er tilstrekkelig for å fjerne minst en del av vannet; og

(iii) tørking av nevnte produkt ved en andre temperatur og trykk som er tilstrekkelig for å fjerne minst en del av det første løsningsmiddel, spesielt hvori det første løsningsmiddel er DMSO og det andre løsningsmiddel er Solutol HS 15.