



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2640358 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/08 (2006.01)
A61K 31/195 (2006.01)
A61K 31/198 (2006.01)
A61P 25/16 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2018.06.11
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.01.03
(86)	European Application Nr.	11808359.1
(86)	European Filing Date	2011.11.15
(87)	The European Application's Publication Date	2013.09.25
(30)	Priority	2010.11.15, US, 413637 P 2011.08.16, US, 201161524064 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	Neuroderm Ltd, Weizmann Science Park 3 Golda Meir Street, 74036 Ness Ziona, IL-Israel
(72)	Inventor	YACOBY-ZEEVI, Oron, 204 Hanarkissim Street, 60946 Bitsaron, IL-Israel NEMAS, Mara, 17/4 Ha'atsmaut Street, 70700 Gedera, IL-Israel
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

(54)	Title	CONTINUOUS ADMINISTRATION OF L-DOPA, DOPA DECARBOXYLASE INHIBITORS, CATECHOL-O-METHYL TRANSFERASE INHIBITORS AND COMPOSITIONS FOR SAME
(56)	References Cited:	WO-A1-01/01984, WO-A1-2005/099678, WO-A1-2006/006929, WO-A1-2007/138086, LÓPEZ LOZANO J J ET AL: "[Preparation of a levodopa/carbidopa solution in ascorbic acid (citridopa) and chromatographic and electrochemical assessment of its stability over 24 hours].", April 1995 (1995-04), NEUROLOGÍA (BARCELONA, SPAIN) APR 1995, VOL. 10, NR. 4, PAGE(S) 155 - 158, XP009190633, ISSN: 0213-4853, US-A- 4 409 233, DATABASE BIOSIS [Online] BIOSCIENCES INFORMATION SERVICE, PHILADELPHIA, PA, US; September 2010 (2010-09), YACOBY-ZEEVI O ET AL: "Markedly enhanced levodopa pharmacokinetics from continuous subcutaneous carbidopa administration", XP009157042, Database accession no. PREV201100553319, NAHATA M C ET AL: "Development of two stable oral suspensions of levodopa-carbidopa for children with amblyopia", JOURNAL OF PEDIATRIC OPHTHALMOLOGY AND STRABISMUS, C.B. SLACK, THOROFARE, NJ, US, vol. 37, no. 6, 1 January 2000 (2000-01-01), pages 333-337, XP009190635, ISSN: 0191-3913, KURTH M C:

"Using liquid levodopa in the treatment of Parkinson's disease. A practical guide.", May 1997
(1997-05), DRUGS & AGING MAY 1997, VOL. 10, NR. 5, PAGE(S) 332 - 340, XP009190632,
ISSN: 1170-229X, WO-A1-2010/134074

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

- 5 **1.** Farmasøytisk akseptabel flytende sammensetning omfattende 2,5 til 7 vekt-% levodopa; opptil 2 vekt-% karbidopa; 5 til 18 vekt-% arginin; og 0,25 til 3 vekt-% askorbinsyre eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori sammensetningen har en pH-verdi på 9,1 til 9,8 ved 25 °C, og molforholdet levodopa og karbidopa : arginin er 1 : 1,8 til 1 : 3,5.
- 10 **2.** Den farmasøytisk akseptable flytende sammensetningen ifølge krav 1, hvori sammensetningen har en pH-verdi på 9,2 til 9,8 ved 25 °C.
- 15 **3.** Den farmasøytisk akseptable flytende sammensetningen ifølge krav 1 eller 2, hvori det farmasøytisk akseptable saltet av askorbinsyre er askorbat, Na-askorbat, kalsiumaskorbat, kaliumaskorbat, askorbylpalmitat eller askorbylstearat.
- 20 **4.** Den farmasøytisk akseptable flytende sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, ytterligere omfattende et middel som hemmer dannelse av oksidasjonsprodukter.
- 25 **5.** Den farmasøytisk akseptable flytende sammensetningen ifølge krav 4, hvori midlet er L-cystein, N-acetylcystein (NAC), glutation (GSH), Na₂-EDTA, Na₂-EDTA-Ca, natriumbisulfitt eller kombinasjoner derav.
- 30 **6.** Den farmasøytisk akseptable flytende sammensetningen ifølge krav 1 eller 2, omfattende:
(i) 6 vekt-% levodopa, 1,5 vekt-% karbidopa, 1 vekt-% Na-askorbat og 13,5, 14,2, 14,8 eller 16,0 vekt-% arginin;
(ii) 4,8 vekt-% levodopa, 1,4 vekt-% karbidopa, 1 vekt-% Na-askorbat og 11, 11,6, 12,1 eller 12,7 vekt-% arginin;
(iii) 6 vekt-% levodopa, 1,5 vekt-% karbidopa, 1 vekt-% askorbinsyre eller Na-askorbat og 14,8, 15,8, 16 eller 16,8 vekt-% arginin;
(iv) 5,4 vekt-% levodopa, 1,5 vekt-% karbidopa, 1 vekt-% askorbinsyre eller Na-askorbat og 12,3, 13,5 eller 14,8 vekt-% arginin; eller
35 (v) 7 vekt-% levodopa, 2 vekt-% karbidopa, 1 vekt-% askorbinsyre eller Na-askorbat og 17,8 vekt-% arginin.

7. Den farmasøytisk akseptable flytende sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6, formulert for kontinuerlig subkutan, transdermal, intraduodenal eller intravenøs administrering.

5

8. Den farmasøytisk akseptable flytende sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7, for anvendelse i behandling av en nevrologisk lidelse eller bevegelseslidelse så som Parkinsons sykdom.

10

9. Transdermalt plaster omfattende en farmasøytisk akseptabel flytende sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6.