



(12) Translation of
european patent specification

(11) NO/EP 2651450 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 47/48 (2006.01)
A61K 9/10 (2006.01)
A61K 9/107 (2006.01)
A61K 31/4164 (2006.01)
A61K 31/4192 (2006.01)
A61K 31/4196 (2006.01)
A61K 47/12 (2006.01)
A61P 31/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2016.05.02
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2015.12.16
(86)	European Application Nr.	11849408.7
(86)	European Filing Date	2011.12.16
(87)	The European Application's Publication Date	2013.10.23
(30)	Priority	2010.12.16, US, 423937 P 2011.07.19, US, 201161509154 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	Borje S. Andersson, 2632 Carolina Way, Houston, TX 77005, US-USA Jeffrey Tarrand, 4706 Braesvalley Drive, Houston, TX 77096, US-USA Benigno C. Valdez, 4110 Jetty Terrace Circle, Missouri City, TX 77459, US-USA
(72)	Inventor	ANDERSSON, Borje, S., 2632 Carolina Way, Houston, TX 77005, US-USA TARRAND, Jeffrey, 4706 Braes Valley, Houston, TX 77096, US-USA VALDEZ, Benigno, C., 4110 Jetty Terrace Circle, Missouri City, TX 77459, US-USA
(74)	Agent or Attorney	Zacco Norway AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

(54)	Title	AZOLE PHARMACEUTICAL FORMULATIONS FOR PARENTERAL ADMINISTRATION AND METHODS FOR PREPARING AND USING THE SAME AS TREATMENT OF DISEASES SENSITIVE TO AZOLE COMPOUNDS
------	-------	---

(56)	References Cited:	EP-A1- 0 156 507 US-A1- 2004 063 722 US-A1- 2005 048 126 US-A1- 2007 082 870 US-A1- 2009 253 712 US-A1- 2010 197 621 US-A1- 2010 222 403
------	-------------------	--

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 egnet for parenteral administrering omfattende et farmasøytisk azolmiddel og et første løsemiddel, der det første løsemiddelet
5 omfatter a) en alkoholbestanddel valgt fra benzylalkohol og/eller forsuret etanol, og b) polyetylenglykol (PEG), hvori azolmiddelet er oppløst i det første løsemiddelet, hvori sammensetningen er hovedsakelig fri for ikke-ioniske surfaktanter og omfatter mindre enn 5 % vann.
- 10 2. Sammensetningen ifølge krav 1, hvori det første løsemiddelet omfatter både etanol og benzylalkohol, eller hvori det første løsemiddelet omfatter forsuret etanol.
- 15 3. Sammensetningen ifølge krav 1 eller 2, hvori den forsurede etanolen er ytterligere definert som en kombinasjon av etanol og en syre, og det første løsemiddelet har en pH fra ca. 1 til ca. 5, foretrukket fra ca. 3 til 4, og hvori syren foretrukket er HCl, sitronsyre, eddiksyre eller glutaminsyre.
- 20 4. Sammensetningen ifølge krav 1, hvori forholdet mellom PEG og alkohol er fra 27 til 2, foretrukket fra 12 til 8.
- 25 5. Sammensetningen ifølge krav 1, hvori PEG-en er valgt fra gruppen bestående av PEG-100, PEG-200, PEG-300, PEG-400 og PEG-800, hvori polyetylenglykolen foretrukket er PEG-400.
- 30 6. Sammensetningen ifølge krav 1, hvori det første løsemiddelet omfatter fra 10 % til 90 % (vekt/volum) PEG, foretrukket fra 30 % til 90 % (vekt/volum) PEG, mer foretrukket fra 40 % til 80 % (vekt/volum) PEG.
- 35 7. Sammensetningen ifølge krav 1, hvori alkoholbestanddelen er fra 1 % til 99 % av det første løsemiddelet, foretrukket fra 5 % til 60 % av det første løsemiddelet, mer foretrukket fra 10 % til 40 % av det første løsemiddelet.
8. Sammensetningen ifølge krav 1, hvori det farmasøytiske azolmiddelet er et imidazol, triazol eller tiazol, foretrukket mikonazol, ketokonazol, klotrimazol, ekonazol, omokonazol, bifonazol, butokonazol, fentikonazol, isokonazol, oksikonazol, sertakonazol, sulkonazol, tiokonazol, flukonazol, itrakonazol,

isavukonazol, ravukonazol, posakonazol, vorikonazol, terkonazol eller abafungin, spesielt foretrukket itrakonazol eller poskonazol.

5 9. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1, hvori sammensetningen omfatter mellom 3 mg/ml til 25 mg/ml av det farmasøytiske azolmiddelet.

10 10. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til og med 9, hvori det første løsemiddelet er fortynnet med et infusjonsfluid valgt fra gruppen bestående av vanlig saltlake, dekstrose i vann og et lipidbasert infusjonsemulsjonsfluid, hvori infusjonsfluidet spesielt foretrukket er dekstrose i vann.

15 11. Sammensetningen ifølge krav 10, hvori sammensetningen omfatter mellom 1 mg/ml og 5 mg/ml av azolbestanddelen etter fortynning i infusjonsfluidet.

12. Sammensetningen ifølge krav 10, hvori sammensetningen er stabil i minst 12 timer ved romtemperatur.

20 13. Sammensetningen ifølge krav 1, ytterligere definert som omfattende mindre enn 3 % vann, foretrukket mindre enn 1 % vann, mer foretrukket som hovedsakelig fri for vann.

25 14. Fremgangsmåte for å fremstille sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til og med 13, omfattende å blande en a) alkoholbestanddel valgt fra benzylalkohol og/eller forsuret etanol med b) polyetylenglykol, (PEG), for å danne et første løsemiddel og å oppløse azolmiddelet i det første løsemiddelet, foretrukket ytterligere omfattende å fortynne det første løsemiddelet med et infusjonsfluid valgt fra gruppen bestående av vanlig saltlake, dekstrose i vann og et lipidbasert infusjonsemulsjonsfluid.

30 15. Sammensetning i samsvar med et hvilket som helst av kravene 1 til og med 13, eller en sammensetning fremstilt i samsvar med krav 14, for anvendelse i behandling av en sopp-, gjær- eller muggsykdom hos en pasient, hvori pasienten foretrukket er et menneske, hvori sykdommen foretrukket er en Candida-, Aspergillus- eller Mucoralesinfeksjon, og hvori sammensetningen foretrukket er egnet for intravaskulær, intratekal, subkutan, intramuskulær eller topisk administrering.

35