



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2838506 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61P 3/10 (2006.01)
A61K 9/00 (2006.01)
A61K 38/28 (2006.01)
A61K 47/02 (2006.01)
A61K 47/12 (2006.01)
A61K 47/18 (2017.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.04.19
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.01.06
(86)	European Application Nr.	13721441.7
(86)	European Filing Date	2013.04.16
(87)	The European Application's Publication Date	2015.02.25
(30)	Priority	2012.04.16, US, 201261624844 P 2012.09.21, US, 201261704066 P 2013.03.14, US, 201313826806
(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	Eli Lilly and Company, Lilly Corporate Center, Indianapolis, IN 46285, USA
(72)	Inventor	POHL, Roderike, 9 Coburn Road East, Sherman, CT 06784, USA HAUSER, Robert, 8730 Endless Ocean Way, Columbia, MD 21045, USA LI, Ming, 2979 Hickory Street, Yorktown Heights, NY 10598, USA WILSON, Bryan R., 12 Carriage Hill Road, Brewster, NY 10509, USA
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54)	Title	MAGNESIUM COMPOSITIONS FOR MODULATING THE PHARMACOKINETICS AND PHARMACODYNAMICS OF INSULIN, AND INJECTION SITE PAIN
(56)	References Cited:	WO-A1-2012/006283 US-A1- 2010 151 435 EP-B1- 1 044 016 US-A- 4 196 196 US-A1- 2009 280 532 YOUNG HEE SHIN, SOO JOO CHOI, HUI YEON JEONG, AND MYUNG HEE KIM: "Evaluation of dose effects of magnesium sulfate on rocuronium injection pain and hemodynamic changes by laryngoscopy and endotracheal intubation", KOREAN J ANESTHESIOLOGY, vol. 60, no. 5, 31 May 2011 (2011-05-31), pages 329-333, XP002701106, DOI: 10.4097/kjae.2011.60.5.329

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/>

EP2838506

1

Patentkrav

- 5 **1.** Injiserbar insulinformulering omfattende en effektiv mengde av et oppløsnings-
/stabiliseringsmiddel valgt fra eddiksyre, askorbinsyre, sitronsyre, glutaminsyre,
asparaginsyre, ravsyre, fumarsyre, maleinsyre, adipinsyre og salter derav; en
effektiv mengde av en sinkchelator; og én eller flere magnesiumforbindelser, hvori
insulinkonsentrasjonen er 100, 200, 400 eller 500 U/mL, hvori den ene eller de
flere magnesiumforbindelsene omfatter et uorganisk magnesiumsalt, og hvori
konsentrasjonen av den ene eller de flere magnesiumforbindelsene er 0,1 til
10 mg/ml.
- 2.** Formuleringen ifølge krav 1, hvori insulinet er humant rekombinant insulin.
- 15 **3.** Formuleringen ifølge krav 1, hvori insulinet er en insulinanalog valgt fra insulin
lispro, insulin glargin, insulin aspart, insulin glulisin og insulin detemir.
- 20 **4.** Formuleringen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvori de uorganiske
magnesiumsaltene er valgt fra gruppen bestående av magnesiumhydroksid
($\text{Mg}(\text{OH})_2$), magnesiumsulfat (MgSO_4), magnesiumhalogenider, slik som
magnesiumklorid (MgCl_2), magnesiumbromid (MgBr_2) og magnesiumjodid (MgI_2);
magnesiumpyrofosfat, magnesiumsulfatheptahydrat, magnesiumoksid (MgO_2) og
kombinasjoner derav.
- 25 **5.** Formuleringen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, hvori
konsentrasjonen av den ene eller de flere magnesiumforbindelsene er fra 0,1 til
5 mg/ml.
- 30 **6.** Formuleringen ifølge krav 5, hvori konsentrasjonen av den ene eller de flere
magnesiumforbindelsene er fra 0,1 til 2 mg/ml.
- 7.** Formuleringen ifølge krav 6, hvori konsentrasjonen av den ene eller de flere
magnesiumforbindelsene er fra 0,2 til 2 mg/ml.

EP2838506

2

- 8.** Formuleringen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7, hvori oppløsnings-/stabiliseringsmidlet danner sitronioner og pH-en er omtrent 7.
- 5 **9.** Formuleringen ifølge krav 1, hvori oppløsnings-/stabiliseringsmiddelet er sitronsyre eller natriumcitrat.
- 10.** Formuleringen ifølge krav 9, hvor sitronsyren eller natriumcitratet er i området fra $7 \times 10^{-3}\text{M}$ til $2 \times 10^{-2}\text{M}$.
- 10 **11.** Formuleringen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 10, ytterligere omfattende m-kresol.
- 12.** Formuleringen ifølge krav 11, ytterligere omfattende glyserin.
- 15 **13.** Formuleringen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 12, hvori chelatoren er valgt fra etylendiamintetraeddiksyre (EDTA), EGTA, algininsyre, alfalipoinsyre, dimerkaptoravsyre (DMSA) og CDTA (1,2-diaminosykloheksantetraeddiksyre) og trinatriumcitrat (TSC).
- 20 **14.** Formuleringen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av et diabetisk individ, omfattende å injisere en effektiv mengde av formuleringen til individet.