



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2874599 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/00 (2006.01)
A61K 9/08 (2006.01)
A61K 31/137 (2006.01)
A61K 31/167 (2006.01)
A61K 31/352 (2006.01)
A61K 31/4045 (2006.01)
A61K 31/4196 (2006.01)
A61K 31/496 (2006.01)
A61K 31/55 (2006.01)
A61K 31/675 (2006.01)
A61K 31/7036 (2006.01)
A61K 47/10 (2017.01)
A61K 47/14 (2017.01)
A61K 47/20 (2006.01)
A61K 47/22 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2019.10.07
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.05.01
(86)	European Application Nr.	13736714.0
(86)	European Filing Date	2013.06.27
(87)	The European Application's Publication Date	2015.05.27
(30)	Priority	2012.06.27, US, 201261665021 P 2013.03.14, US, 201313829937
(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	Xeris Pharmaceuticals, Inc., 180 N. LaSalle Street, Suite 1600, Chicago, IL 60601, USA
(72)	Inventor	PRESTRELSKI, Steven, J., c/o Xeris Pharmaceuticals Inc.3208 Red River,Suite 300, Austin, TX 78705, USA SCOTT, Nancy, c/o Xeris Pharmaceuticals Inc.3208 Red River,Suite 300, Austin, TX 78705, USA
(74)	Agent or Attorney	OSLO PATENTKONTOR AS, Hoffsvæien 1A, 0275 OSLO, Norge

(54)	Title	STABLE FORMULATIONS FOR PARENTERAL INJECTION COMPRISING BENZODIAZEPINES
------	-------	--

(56) References

Cited: EP-A1- 0 916 347
WO-A1-03/051398
EP-A1- 1 502 589
WO-A2-2011/154725

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/>

Krav

1. Stabil flytende formulering for parenteral injeksjon omfattende:
 - (a) et biokompatibelt ikke-vandig aprotisk løsningsmiddel, hvor den
5 flytende formuleringen omfatter det aprotiske løsningsmidlet, og hvor det aprotiske løsningsmidlet er dimetylsulfoksid (DMSO), dimetylformamid (DMF), etylacetat, n-metylpyrrolidon (NMP), dimetylacetamid (DMA), propylenkarbonat eller blandinger derav; og
 - (b) et små-molekylært-legemiddel eller et salt derav, løselig i det ikke-
10 vandige løsningsmiddel, hvor det små-molekylære-legemidlet er en benzodiazepin, og hvor benzodiazepinen er til stede i den flytende formuleringen i en mengde opp til dens løselighetsgrense i formuleringen,
- 15 hvor den flytende formuleringen omfatter mindre enn 10 vekt % restvann, og hvor volumet av den flytende formuleringen som skal injiseres parenteralt, er 3 ml eller mindre.
2. Stabil flytende formulering ifølge krav 1, videre innbefattet i en anordning
20 for dispensering av den flytende formulering.
3. Stabil flytende formulering ifølge krav 2, hvor anordningen er en sprøyte, en en penn-injeksjonsanordning, en automatisk-injeksjonsanordning, en ekstern eller implanterbar pumpe eller en perfusjonspose.
25
4. Stabil flytende formulering ifølge krav 1, hvor det aprotiske løsningsmidlet er DMSO, NMP eller en blanding derav.
5. Stabil flytende formulering ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvor
30 det det små-molekylære-legemidlet er diazepam.
6. Stabil flytende formulering ifølge krav 5, hvor den flytende formuleringen omfatter 50 mg/ml til 300 mg/ml diazepam.
- 35 7. Stabil flytende formulering ifølge krav 6, hvor løsningsmidlet er DMSO, NMP eller en blanding derav.

8. Stabil flytende formulering ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvor den flytende formuleringen omfatter mindre enn 5 vekt % restvann.
9. Stabil flytende formulering ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvor
5 den flytende formuleringen omfatter fra 0,5 mg/ml til 750 mg/ml av det små-
molekylære-legemidlet.
10. Stabil flytende formulering ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvor
10 volumet av den flytende formuleringen som skal injiseres parenteralt, er fra 0,1 µl
til 1 µl.
11. Stabil flytende formulering ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvor
volumet av den flytende formuleringen som skal injiseres parenteralt, er fra 1 µl til
10 µl.
15
12. Stabil flytende formulering ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvor
volumet av den flytende formuleringen som skal injiseres parenteralt, er fra 10 µl
til 1 ml.
- 20 13. Stabil flytende formulering ifølge et hvilket som helst av de foregående krav
for anvendelse i en fremgangsmåte for administrasjon av formuleringen til et
individ som trenger det, omfattende parenteral injisering av den flytende
formuleringen til individet.
- 25 14. Stabil flytende formulering for anvendelse ifølge krav 3, hvor den flytende
formuleringen ikke fortynnes før administrering.
15. Stabil flytende formulering ifølge et hvilket som helst av de foregående krav
1 til 12 for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling eller forebygging av en
30 tilstand omfattende parenteral administrasjon til et individ som trenger det av
formuleringen i en mengde som er effektiv til å behandle eller forhindre tilstanden.