



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3215173 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 38/14 (2006.01)
A61K 9/08 (2006.01)
A61K 47/26 (2006.01)
A61P 31/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2020.03.02
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.01.01
(86)	European Application Nr.	15791287.4
(86)	European Filing Date	2015.11.06
(87)	The European Application's Publication Date	2017.09.13
(30)	Priority	2014.11.06, US, 201462076400 P 2015.05.30, US, 201562168749 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	Xellia Pharmaceuticals ApS, Dalslandsgade 11, 2300 København S, Danmark
(72)	Inventor	JASPRICA, Ivona, Sibenska 4, 10000 Zagreb, Kroatia KESER, Sabina, Ulica grada Chicaga 2, Zagreb, Kroatia PINDRIC, Katarina, Zeleni vijenac 15, 10360 Sesvete (zagreb), Kroatia
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54)	Title	GLYCOPEPTIDE COMPOSITIONS
(56)	References Cited:	JP-A- 2008 201 778 WO-A1-2012/159103 WO-A1-2014/194296 WO-A1-2015/138983 Clive M Pearce ET AL: "Ligands which Bind Weakly to Vancomycin: Studies by I3C NMR Spectroscopy", J. CHEM. SOC. PERKIN TRANS, 1 January 1995 (1995-01-01), pages 159-163, XP055234260, Retrieved from the Internet: URL: http://pubs.rsc.org/en/content/article-pdf/1995/P2/P29950000159 [retrieved on 2015-12-07] cited in the application

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. Preparat som omfatter et glykopeptidantibiotikum og en eksipiens valgt fra N-acetyl-D-alanin eller N-acetyl-glycin for anvendelse som et medikament, hvor
5 preparatet er et flytende preparat.
2. Preparat for anvendelse ifølge krav 1, hvor preparatet er et vandig preparat.
3. Preparat for anvendelse ifølge krav 2, med en pH på 3-6 og videre omfattende en
10 aminosyre.
4. Preparat for anvendelse ifølge krav 3, hvor konsentrasjonen av glykopeptidantibiotikumet er ca. 0,1-20% vekt/volum.
- 15 5. Preparat for anvendelse ifølge krav 4, hvor konsentrasjonen av glykopeptidantibiotikumet er ca. 0,1-1% vekt/volum; og aminosyren er valgt fra glycine, alanin, serin, leucin, valin, lysin, arginin eller ornitin; og eksipiensen er N-acetyl-D-alanin.
- 20 6. Preparat for anvendelse ifølge krav 4, hvor konsentrasjonen av glykopeptidantibiotikumet er ca. 0,1-1% vekt/volum; og aminosyren er valgt fra glycine, alanin, serin, leucin, valin, lysin, arginin eller ornitin; og eksipiensen er N-acetyl-D-alanin, hvor glykopeptidantibiotikumet, aminosyren og N-acetyl-D-Alanin er tilstede i et molforhold på fra 1:5:5 til 1:40:40.
- 25 7. Preparat for anvendelse ifølge krav 1, hvor glykopeptidantibiotikumet er Vancouveryomycin, Teicoplanin, Telavancin, Dalbavancin eller Oritavancin.
8. Preparat for anvendelse ifølge krav 4, hvor konsentrasjonen av
30 glykopeptidantibiotikumet er ca. 1-10 vekt/volum; og aminosyren er valgt fra glycine, alanin, serin, leucin, valin, lysin, arginin eller ornitin; og eksipiensen er N-acetyl-D-alanin.
9. Preparat for anvendelse ifølge krav 4, hvor konsentrasjonen av
35 glykopeptidantibiotikumet er ca. 1-10 vekt/volum; og aminosyren er valgt fra glycine, alanin, serin, leucin, valin, lysin, arginin eller ornitin; og eksipiensen er N-acetyl-D-alanin; og hvor glykopeptidantibiotikumet, aminosyren og N-acetyl-D-Alanin er

tilstede i et molforhold på ca. 1:1:1 til 1:10:10.

10. Farmasøytisk preparat omfattende et glykopeptidantibiotikum; og en eksipiens valgt fra N-acetyl-D-alanin eller N-acetyl-glycin, hvor preparatet er i flytende form.

5

11. Farmasøytisk preparat ifølge krav 10, hvor det farmasøytiske preparatet er fremstilt for parenteral administrering.

10

12. Farmasøytisk preparat ifølge krav 10 eller 11, hvor preparatet er et vandig preparat.

13. Farmasøytisk preparat ifølge hvilket som helst av kravene 10 til 12, videre omfattende en aminosyre.

15

14. Farmasøytisk preparat ifølge krav 13, hvor aminosyren er valgt fra glycin, alanin, serin, leucin, valin, lysin, arginin eller ornitin.

15. Farmasøytisk preparat ifølge krav 13, hvor aminosyren er valgt fra D-alanin, D-serin, D-leucin, D-valin, L-lysin, D-lysin, L-ornitin, D-ornitin eller L-arginin.

20

16. Farmasøytisk preparat ifølge et hvilket som helst av kravene 12-15 med en pH på ca. 3-6.

17. Farmasøytisk preparat ifølge krav 13, hvor molforholdet mellom aminosyren og glykopeptidantibiotikumet er ca. 0,5:1 til 40:1

25

18. Farmasøytisk preparat ifølge krav 10, hvor glykopeptidantibiotikumet er Vancouveromycin, Teicoplanin, Telavancin, Dalbavancin eller Oritavancin.

30

19. Farmasøytisk preparat ifølge et hvilket som helst av kravene 13-16, videre omfattende organisk løsningsmiddel valgt fra etanol eller polyetylenglykol, hvor konsentrasjonen av det organiske løsningsmidlet er 50% V/V eller mindre.

35

20. Farmasøytisk preparat ifølge krav 12, hvor den farmasøytiske oppløsningen er stabil i minst 4 uker ved 25 grader Celsius, som vist ved å bestemme mengden av glykopeptidantibiotikumet som er igjen i den farmasøytiske løsningen etter minst 4 uker ved 25 grader Celsius, og hvor mengden av glykopeptidantibiotikumet som er

igjen i den farmasøytiske løsningen er på mellom 85% og 100%.

21. Farmasøytisk preparat ifølge krav 10, hvor konsentrasjonen av glykopeptidantibiotikumet er ca. 0,1-20% vekt/volum.

5

22. Farmasøytisk preparat ifølge krav 10, omfattende 0,5-15% vekt/volum glykopeptidantibiotikum og N-acetyl-D-alanin i molforholdet 1:1-1: 40 og en aminosyre.

10

23. Farmasøytisk preparat ifølge krav 12, omfattende 0,5-15% vekt/volum glykopeptidantibiotikum og N-acetyl-D-alanin i molforholdet ca. 1:1-1: 40 med en pH på 3-6 ytterligere omfattende en aminosyre.

15

24. Farmasøytisk preparat ifølge krav 12, omfattende 0,5-15% vekt/volum glykopeptidantibiotikum og N-acetyl-D-alanin i molforholdet ca. 1:1-1:40 med en pH på 3-6, videre omfattende en aminosyre valgt fra serin, leucin, valin, lysin, arginin og ornitin.

20

25. Anvendelse av en eksipiens valgt fra N-acetyl-D-alanin eller N-acetyl-glycin for stabilisering av en farmasøytisk løsning omfattende et glykopeptidantibiotikum.

25

26. Fremgangsmåte for fremstilling av en stabil vandig farmasøytisk løsning omfattende trinnene å blande et glykopeptidantibiotikum og en eksipiens valgt fra N-acetyl-D-alanin eller N-acetyl-glycin.

27. Fremgangsmåte ifølge krav 26, hvor konsentrasjonen av glykopeptidantibiotikumet er ca. 0,1-20% vekt/volum.

28. Fremgangsmåte ifølge krav 26, videre omfattende tilsetning av en aminosyre.

30

29. Fremgangsmåte ifølge krav 28, hvor aminosyren er valgt fra glycin, alanin, serin, leucin, valin, lysin, arginin eller ornitin.

35

30. Fremgangsmåte ifølge krav 29, videre omfattende å justere pH i løsningen til mellom pH 3-6.