



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3544584 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/08 (2006.01)
A61K 9/00 (2006.01)
A61K 9/19 (2006.01)
A61K 31/198 (2006.01)
A61K 47/18 (2017.01)
A61K 47/26 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45) Translation Published 2020.12.14

(80) Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent 2020.09.16

(86) European Application Nr. 17800854.6

(86) European Filing Date 2017.11.20

(87) The European Application's Publication Date 2019.10.02

(30) Priority 2016.11.22, EP, 16199942

(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 RECORDATI INDUSTRIA CHIMICA E FARMACEUTICA S.P.A., Via Matteo Civitali, 1, 20148 Milano (MI), Italia

(72) Inventor BERLATI, Fabio, Via Aldo Moro 9, 20017 Rho, Italia
MENEGON, Sergio, c/o RECORDATI INDUSTRIA CHIMICAE FARMACEUTICA S.P.A.Via Matteo Civitali 1, 20148 Milano, Italia
FARINA, Pierluigi, c/o RECORDATI INDUSTRIA CHIMICAE FARMACEUTICA S.P.A.Via Matteo Civitali 1, 20148 Milano, Italia
PROVVEDINI, Diego, c/o RECORDATI INDUSTRIA CHIMICAE FARMACEUTICA S.P.A.Via Matteo Civitali 1, 20148 Milano, Italia
BARCHIELLI, Marco, c/o RECORDATI INDUSTRIA CHIMICAE FARMACEUTICA S.P.A.Via Matteo Civitali 1, 20148 Milano, Italia
MATTEI, Alberto, c/o RECORDATI INDUSTRIA CHIMICAE FARMACEUTICA S.P.A.Via Matteo Civitali 1, 20148 Milano, Italia

(74) Agent or Attorney ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54) Title **PHARMACEUTICAL PARENTERAL FORMULATION CONTAINING CARGLUMIC ACID**

(56) References

Cited:

GB-A- 1 112 347

Jae-Ho Lee ET AL: "N-Carbamoyl- l-Glutamate Plus l-Arginine Can Protect Ammonia Intoxication in Rats with Reduced Functional Liver Mass", Biochemical and Biophysical Research Communications, 1 January 1998 (1998-01-01), pages 391-394, XP055366362,

UNITED STATES DOI: 10.1006/bbrc.1998.8984 Retrieved from the Internet:
URL:<http://www.sciencedirect.com/science/article/pii/S0006291X98989847/pdf?md5=4180af08dafbdefbacfd92cfb002e136&pid=1-s2.0-S0006291X98989847-main.pdf>

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/>

[EP3544584]

1

Patentkrav

- 5 **1.** Farmasøytisk formulering inneholdende kargluminsyre eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav og et buffermiddel med en pK_a fra 5,5 til 9,0 ved 25 °C, foretrukket en pK_a fra 7,5 og 8,5 ved 25 °C, mer foretrukket en pK_a på ca. 8,07, **karakterisert ved at** buffermiddelet er trometamol.
- 10 **2.** Farmasøytisk formulering ifølge krav 1, **karakterisert ved at** molforholdet kargluminsyre:trometamol er fra 1:1 og 1:2,5, foretrukket ca. 1:2.
- 15 **3.** Farmasøytisk formulering ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, ytterligere inneholdende minst ett fyllmiddel.
- 20 **4.** Farmasøytisk formulering ifølge krav 3, **karakterisert ved at** fyllmiddelet er mannitol.
- 25 **5.** Farmasøytisk formulering ifølge krav 3 eller 4, **karakterisert ved at** vektforholdet kargluminsyre:fyllmiddel eller vektforholdet kargluminsyre:mannitol er fra 25:32 og 25:50, foretrukket ca. 25:40.
- 30 **6.** Farmasøytisk formulering ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene inneholdende kargluminsyre, trometamol og mannitol, **karakterisert ved at** molforholdet kargluminsyre:trometamol er fra 1:1 og 1:2,5, foretrukket ca. 1:2, og vektforholdet kargluminsyre:mannitol er fra 25:32 og 25:50, foretrukket ca. 25:40.
- 7.** Farmasøytisk formulering ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, **karakterisert ved at** den er et pulver.
- 8.** Farmasøytisk formulering ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6, **karakterisert ved at** den er en vannoppløsning.

[EP3544584]

2

9. Farmasøytisk formulering ifølge krav 8, **karakterisert ved** den har en kargluminsyrekonsentrasjon som er høyere enn 2 % vekt/volum, foretrukket høyere enn eller lik 2,5 % vekt/volum.

5 **10.** Farmasøytisk formulering ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene **karakterisert ved** at den ytterligere inneholder én eller flere fysiologisk akseptable eksipienter.

10 **11.** Fremgangsmåte for fremstilling av en farmasøytisk formulering ifølge krav 7 som omfatter å utsette en oppløsning ifølge krav 8 for frysetørking.

15 **12.** Farmasøytisk formulering ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene for anvendelse som medikament, foretrukket for anvendelse i behandling av hyperammonemi.

13. Farmasøytisk formulering for anvendelse ifølge krav 12, **karakterisert ved at** den inneholder fra 400 til 600 mg kargluminsyre, foretrukket ca. 500 mg og ved at den administreres til en voksen pasient.

20 **14.** Farmasøytisk formulering for anvendelse ifølge krav 12, **karakterisert ved** den inneholder fra 25 til 200 mg kargluminsyre, foretrukket 50 mg, og ved at den administreres til pasienter som tilhører den pediatrike populasjonen.

25 **15.** Farmasøytisk formulering for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 12 til 14, **karakterisert ved at** den administreres parenteralt, foretrukket ved injeksjon.