



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3556349 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/08 (2006.01)
A61K 31/4192 (2006.01)
A61K 47/69 (2017.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2022.03.14
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.11.24
(86)	European Application Nr.	17880335.9
(86)	European Filing Date	2017.12.14
(87)	The European Application's Publication Date	2019.10.23
(30)	Priority	2016.12.14, KR, 20160170389
(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	SK Biopharmaceuticals Co., Ltd., 221, Pangyoyeok-ro Bundang-gu Seongnam-si, Gyeonggi-do 13494, Sør-Korea
(72)	Inventor	BAEK, Myoung Ki, Seongnam-siGyeonggi-do 13494, Sør-Korea LEE, Ji Hye, Seongnam-siGyeonggi-do 13494, Sør-Korea CHOI, So Young, Seongnam-siGyeonggi-do 13494, Sør-Korea
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54) Title **PARENTERAL LIQUID PREPARATION COMPRISING CARBAMATE COMPOUND**

(56) References Cited:

US-A1- 2006 258 718

WOLFGANG LOSCHER ET AL: "New Injectable Aqueous Carbamazepine Solution Through Complexing with 2-Hydroxypropyl-beta-Cyclodextrin: Tolerability and Pharmacokinetics After Intravenous Injection in Comparison to a Glycofurol-Based Formulation", EPILEPSIA, vol. 36, no. 3, 1 March 1995 (1995-03-01), pages 255-261, XP055428288, NEW YORK, US ISSN: 0013-9580, DOI: 10.1111/j.1528-1157.1995.tb00993.x

GOULD S ET AL: "2-Hydroxypropyl-@b-cyclodextrin (HP-@b-CD): A toxicology review", FOOD AND CHEMICAL TOXICOLOGY, PERGAMON, GB, vol. 43, no. 10, 1 October 2005 (2005-10-01), pages 1451-1459, XP004976497, ISSN: 0278-6915, DOI: 10.1016/J.FCT.2005.03.007

HOLVOET, C. ET AL.: 'Inclusion Complexation of Lorazepam with Different Cyclodextrins Suitable for Parenteral Use' DRUG DEVELOPMENT AND INDUSTRIAL PHARMACY vol. 31, 2005, pages 567 - 575, XP055510488

Duncan P Taylor: "YKP3089 (Epilepsy) - Poster", , 24 May 2013 (2013-05-24), XP055650994, Retrieved from the Internet: URL:http://www.kddf.org/common/file/?idx=1_417&fname=BIO_USA-Poster_10_YKP_3089.pdf [retrieved on 2019-12-09]

RAJEWSKI, R. A. ET AL.: 'Pharmaceutical Applications of Cyclodextrins. 2. In Vivo Drug Delivery' JOURNAL OF PHARMACEUTICAL SCIENCES vol. 85, no. 11, 1996, pages 1142 - 1169, XP000629515

LOSCHER, W. ET AL.: 'New Injectable Aqueous Carbamazepine Solution Through Complexing with 2-Hydroxypropyl-13-Cyclodextrin: Tolerability and Pharmacokinetics After Intravenous Injection in Comparison to a Glycofurol-Based Formulation' EPILEPSIA vol. 36, no. 3, 1995, pages 255 - 261, XP055428288

GOULD, S. ET AL.: '2-Hydroxypropyl-beta-cyclodextrin (HP-beta- CD): a Toxicology Review' FOOD AND CHEMICAL TOXICOLOGY vol. 43, 2005, pages 1451 - 1459, XP004976497

RAJEWSKI R A ET AL: "PHARMACEUTICAL APPLICATIONS OF CYCLODEXTRINS. 2. IN VIVO DRUG DELIVERY", JOURNAL OF PHARMACEUTICAL SCIENCES, AMERICAN PHARMACEUTICAL ASSOCIATION, US, vol. 85, no. 11, 1 November 1996 (1996-11-01), pages 1142-1169, XP000629515, ISSN: 0022-3549, DOI: 10.1021/JS960075U

CHANTAL HOLVOET ET AL: "Inclusion Complexation of Lorazepam with Different Cyclodextrins Suitable for Parenteral Use", DRUG DEVELOPMENT AND INDUSTRIAL PHARMACY, vol. 31, no. 6, 1 January 2005 (2005-01-01), pages 567-575, XP055510488, US ISSN: 0363-9045, DOI: 10.1080/03639040500214738

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/>

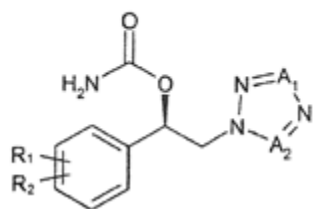
[EP3556349]

1

Patentkrav

- 5 **1.** Parenteral flytende formulering omfattende som aktiv ingrediens en karbamatforbindelse med følgende formel 1 eller an isomer derav eller et farmasøytisk akseptabelt salt, solvat eller hydrat derav; og et syklodekstrinderivat som er 2-hydroksypropyl- β -syklodekstrin eller sulfobutyleter- β -syklodekstrin:

[Formel 1]



hvor,

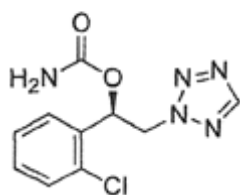
- 10 R₁ og R₂ hver uavhengig er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, halogen, C₁-C₈-alkyl, halo-C₁-C₈-alkyl, C₁-C₈-tioalkoksy og C₁-C₈-alkoksy; og én av A₁ og A₂ er CH, og den andre er N, hvori et vektforhold mellom den aktive ingrediensen og syklodekstrinderivatet er 1:5 til 1:40.

15

- 2.** Den parenterale flytende formuleringen ifølge krav 1, hvori R₁ og R₂ hver uavhengig er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, halogen og C₁-C₈-alkyl.

- 20 **3.** Den parenterale flytende formuleringen ifølge krav 1, hvori karbamatforbindelsen med formel 1 er karbaminsyre (R)-1-(2-klorfenyl)-2-(tetrazol-2-yl)etylester med følgende formel 2:

[Formel 2]



[EP3556349]

2

4. Den parenterale flytende formuleringen ifølge krav 1, som inneholder karbamatforbindelsene med formel 1 i en konsentrasjon på 0,5 mg/ml til 20 mg/ml.

5

5. Den parenterale flytende formuleringen ifølge krav 1, som er for anvendelse som antikonvulsivum.

10

6. Den parenterale flytende formuleringen ifølge krav 1, som er for anvendelse i behandling av angst, depresjon, konvulsjon, epilepsi, migrene, bipolar lidelse, stoffmisbruk, røyking, oppmerksomhetsforstyrrelse med hyperaktivitet (ADHD), fedme, søvnlidelser, nevropatisk smerte, slag, kognitive lidelser, nevrodegenerering og muskelspasmer.

15

7. Injeksjonssammensetning omfattende en parenteral flytende formulering ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4 eller en parenteral flytende formulering for anvendelse ifølge krav 5 eller 6.

20

8. Fremgangsmåte for å fremstille en parenteral flytende formulering ifølge krav 1, omfattende å blande en karbamatforbindelse med formel 1 som definert i krav 1 og syklodekstrinderivat som er 2-hydroksypropyl- β -syklodekstrin eller sulfobutyleter- β -syklodekstrin i et løsemiddel.

25

9. Fremgangsmåten for å fremstille en parenteral flytende formulering ifølge krav 8, hvori karbamatforbindelsen med formel 1 er karbaminsyre (R)-1-(2-klorfenyl)-2-(tetrazol-2-yl)etylester med følgende formel 2:

[Formel 2]

