



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3630061 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61P 25/08 (2006.01)
A61K 9/00 (2006.01)
A61K 9/08 (2006.01)
A61K 31/5513 (2006.01)
A61K 47/14 (2017.01)
A61K 47/16 (2006.01)
A61K 47/20 (2006.01)
A61K 47/22 (2006.01)
A61P 25/14 (2006.01)
A61P 25/22 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2024.07.01
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2024.04.03
(86)	European Application Nr.	18733442.0
(86)	European Filing Date	2018.05.31
(87)	The European Application's Publication Date	2020.04.08
(30)	Priority	2017.06.02, US, 201762514474 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	Xeris Pharmaceuticals, Inc., 1375 West Fulton Street, Suite 1300, Chicago, IL 60607, USA
(72)	Inventor	PRESTRELSKI, Steven J., c/o Xeris Pharmaceuticals, Inc. 180 N. LaSalle Street Suite 1600, Chicago Illinois 60601, USA SANDOVAL, Michael A., c/o Xeris Pharmaceuticals, Inc. 180 N. LaSalle Street Suite 1600, Chicago Illinois 60601, USA SLOAT, Brian R., c/o Xeris Pharmaceuticals, Inc. 180 N. LaSalle Street Suite 1600, Chicago Illinois 60601, USA
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54)	Title	PRECIPITATION RESISTANT SMALL MOLECULE DRUG FORMULATIONS
(56)	References Cited:	EP-A1- 2 030 610 WO-A1-2005/021046 WO-A1-2014/004895 WO-A2-2006/122217 US-B1- 6 365 637 WO-A2-2009/027697 US-A- 5 397 771 US-A1- 2014 296 191 WO-A2-2007/059019

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. En stabil utfellingsresistent formulering for parenteral injeksjon som omfatter:

- a) et biokompatibelt ikke-vandig aprotisk polart løsningsmiddel, hvori det aprotiske polare løsningsmiddel er dimetylsulfoksid (DMSO), dimetylformamid (DMF), etyl acetat, n-metylpyrrolidon (NMP), dimetylacetamid (DMA), propylen karbonat, eller blandinger derav; og
- b) et benzodiazepin, eller et salt derav, oppløselig i det ikke-vandige løsningsmidlet, og
- c) 1 % til 30 % vekt/vekt av et overflateaktivt middel, hvor det overflateaktive middelet minsker utfelling av benzodiazepinet når det injiseres i en person, hvor det overflateaktive middelet er natriumdeoksykolat, polysorbat 80, polysorbat 20, dodekyl maltosid, natriumdodekylsulfat eller natriumtetradekylsulfat.

2. Formuleringen ifølge krav 1, hvori det overflateaktive middelet er tilstede i et molforhold av overflateaktivt middel: benzodiazepin på 0,5:1 til 4:1 eller 1:1 til 2:1.

3. Formuleringen ifølge krav 1, hvori formuleringen utgjør mindre enn 10 % i vekt fuktighetsinnhold.

4. Formuleringen ifølge krav 1, hvori volumet av formuleringen skal injiseres parenteralt er 3 ml eller mindre.

5. Formuleringen ifølge ett av kravene 1 til 4, hvori: formuleringen inkluderer fra 0,5 mg/ml til 750 mg/ml benzodiazepin.

6. Formuleringen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, hvor volumet av formuleringen som skal injiseres parenteralt er: fra 1 µl til 10 µl.

7. Formuleringen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, hvor volumet av formuleringen som skal injiseres parenteralt er: fra 10 µl til 100 µl.

8. Formuleringen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, hvor volumet av formuleringen som skal injiseres parenteralt er: fra 100 µl til 1 ml.

9. Formuleringen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8, hvor benzodiazepinet er diazepam; eller hvori formuleringen omfatter 25 mg/ml til 300 mg/ml av et benzodiazepin.

10. Formuleringen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 9, hvor det aprotiske polare løsningsmidlet er DMSO, NMP, eller en blanding av disse.

11. Formuleringen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 10 til bruk som et medikament.

12. En formulering ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 10 til bruk i en fremgangsmåte for behandling eller forebygging av angst, muskelspasmer eller slagtilfeller, fremgangsmåten omfatter parenteralt å administrere til en forsøksperson som trenger det, en formulering ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 10.

13. Formuleringen til bruk ifølge krav 12, hvor fremgangsmåten omfatter administrere formuleringen i et injiserbart volum i et utstyr for dispensering av formuleringen; valgfritt
hvor enheten er en sprøyte, en penninjeksjonsanordning, en auto-injektorenhet, en ekstern eller implanterbar pumpe, eller en perfusjonspose.

14. Formuleringen til bruk ifølge krav 12 eller krav 13, hvori:
formuleringen omfatter 25 mg/ml til 300 mg/ml benzodiazepin; eller
hvor benzodiazepinet er diazepam; eller
hvor volumet av formuleringen som skal injiseres parenteralt er fra 1 µl til 10 µl; eller
hvor volumet av formuleringen som skal injiseres parenteralt er fra 10 µl til 100 µl;
eller
hvor volumet av formuleringen som skal injiseres parenteralt er fra 100 µl til 1 ml; eller
hvor oppløsningen ikke fortynnes før administrering.

15. En anordning for dispensering av en formulering, hvor enheten omfatter en formulering ifølge krav 1; valgfritt hvor enheten er en sprøyte, en penninjeksjonsanordning, en auto-injektorenhet, en ekstern eller implanterbar pumpe eller en perfusjonspose.