



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3668516 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/519 (2006.01)
A61K 9/19 (2006.01)
A61K 47/12 (2006.01)
C07C 55/06 (2006.01)
C07C 55/10 (2006.01)
C07C 57/145 (2006.01)
C07C 57/15 (2006.01)
C07C 59/225 (2006.01)
C07D 475/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2022.02.21
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.09.22
(86)	European Application Nr.	18752161.2
(86)	European Filing Date	2018.08.15
(87)	The European Application's Publication Date	2020.06.24
(30)	Priority	2017.08.16, EP, 17186518
(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	Merck Patent GmbH, Frankfurter Strasse 250, 64293 Darmstadt, Tyskland
(72)	Inventor	MOSER, Rudolf, Lahnhalde 11, 8200 Schaffhausen, Sveits GROEHN, Viola, Neuwingertstrasse 9, 8447 Dachsen, Sveits AMMANN, Thomas, Seebestrasse 1, 8460 Marthalen, Sveits
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54)	Title	STABLE LYOPHILISATES COMPRISING 5,10-METHYLENE-(6R)-TETRAHYDROFOLIC ACID AND A DICARBOXYLIC ACID
(56)	References Cited:	WO-A2-2007/064968 WO-A2-2004/112761

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/>

[EP3668516]

1

Patentkrav

- 5 **1.** Stabilt lyofilisat omfattende 5,10-metylen-(6R)- tetrahydrofolsyre eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og en dikarboksytsyre eller et salt derav, hvori dikarboksylsyren er suksin-, malein-, eple-, vin-, fumar- eller oksalsyre.
- 2.** Stabilt lyofilisat ifølge krav 1, som har en kjemisk renhet på mer enn 98 % og en stereoisomerisk renhet på mer enn 99 %.
- 10 **3.** Rekonstituert produkt oppnådd ved å løse opp lyofilisatet ifølge krav 1 i vann eller en flytende farmasøytisk akseptabelt vehikkel.
- 4.** Rekonstituert produkt ifølge krav 3, hvori vannet er sterilt vann for injeksjon.
- 15 **5.** Rekonstituert produkt ifølge hvilke som helst av kravene 3 eller 4, ytterligere omfattende en farmasøytisk akseptabel bærer.
- 6.** Rekonstituert produkt ifølge hvilke som helst av kravene 3 til 5, ytterligere omfattende en ytterligere farmasøytisk akseptabel aktiv ingrediens.
- 20 **7.** Rekonstituert produkt ifølge hvilke som helst av kravene 3 til 6, ytterligere omfattende en buffer.
- 8.** Fremgangsmåte for å fremstille et lyofilisat ifølge krav 1, omfattende trinnene
- 25 (i) å løse opp 5,10-metylen-(6R)-tetrahydrofolsyre eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav i vann inneholdende en dikarboksytsyre valgt fra suksin-, malein-, eple-, vin-, fumar- eller oksalsyre eller et salt derav;
- (ii) å fryse vannet; og
- (iii) deretter å fjerne det fryste vannet under vakuum.
- 30 **9.** Fremgangsmåte for å fremstille et lyofilisat ifølge krav 8, hvori NaOH tilsettes i trinn (i).

[EP3668516]

2

10. Rekonstituert produkt ifølge hvilke som helst av kravene 3 til 7 for anvendelse i kreftterapi.