



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3821910 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

A61K 47/26 (2006.01)

A61K 33/26 (2006.01)

A61K 47/50 (2017.01)

A61P 7/06 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2025.04.28
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2024.12.25
(86)	European Application Nr.	20200455.2
(86)	European Filing Date	2009.03.25
(87)	The European Application's Publication Date	2021.05.19
(84)	Designated Contracting States:	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 ; SE ; SI ; SK ; TR
	Designated Extension States:	AL ; BA ; RS
(62)	Divided application	EP3156075, 2009.03.25
(73)	Proprietor	Pharmacosmos Holding A/s, Rørvangsvej 30 Postboks 40, 4300 Holbæk, Danmark
(72)	Inventor	ANDREASEN, Hans, Labæk 13, 4300 Holbæk, Danmark
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54)	Title	AN OLIGOSACCHARIDE AND A PROCESS FOR PREPARATION THEREOF
(56)	References Cited:	WO-A1-2006/084782 WO-A1-99/48533 WO-A1-00/30657 US-A1- 2003 083 310

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 jernoligosakkaridforbindelse som omfatter et hydrogenert oligosakkarid i stabil assosiasjon med jern(III)oksyhydroksid, hvor nevnte hydrogenerte oligosakkarid er en blanding av hydrogenert dekstranoligosakkarider som har den følgende molekylvektfordelingen:
- (i) en vektmidlere molekylvekt (M_w) mellom 500 og 3,000 Dalton;
 - (ii) en tallmidlere molekylvekt (M_n) over 500 Dalton;
 - (iii) 90 vekt% av nevnte hydrogenert dekstranoligosakkarider har molekylvekter mindre enn 3,500 Dalton;
 - (iv) M_w -en av 10 vekt%-fraksjonen av de hydrogenerte dekstranoligosakkaridene som har de høyeste molekylvektene er under 4,500 Dalton; og
 - (v) et dimersakkarid innhold på 2,9 vekt% eller mindre, basert på den totale vekten av det hydrogenerte oligosakkaridet.
2. En forbindelse i henhold til krav 1, hvor innholdet av dimersakkarid i det hydrogenerte oligosakkaridet er 2,5 vekt% eller mindre, basert på den totale vekten av det hydrogenerte oligosakkaridet, fortrinnsvis hvor innholdet av dimersakkarid i det hydrogenerte oligosakkaridet er 2,3 vekt% eller mindre, basert på den totale vekten av det hydrogenerte oligosakkaridet.
3. En forbindelse i henhold til krav 1 eller krav 2, hvor innholdet av monomersakkarid i nevnte hydrogenerte oligosakkarid er 0,5 vekt% eller mindre, basert på den totale vekten av det hydrogenerte oligosakkaridet.
4. En forbindelse i henhold til hvilket som helst av krav 1 til 3, hvor den tilsynelatende molekylvekten (M_p) av nevnte forbindelse er 120,000 til 180,000 Dalton, fortrinnsvis 130,000 til 180,000 Dalton.
5. En forbindelse i henhold til et hvilket som helst av de foregående kravene, hvor 90 vekt% av de hydrogenerte dekstranoligosakkaridene har en molekylvekt mindre enn 2,700 Dalton og at den vektmidlere molekylvekten (M_w) av 10 vekt%-fraksjonen av de hydrogenerte dekstranoligosakkaridene som har den høyeste molekylvekten er under 3,200 Dalton.

- 6.** En forbindelse i henhold til et hvilket som helst av de foregående kravene, hvor mengden av jern (Fe) i jernoligosakkaridforbindelsen er 10-50 vekt%.
- 5 **7.** En forbindelse i henhold til krav 1, hvor blandingen av hydrogenerte dekstranoligosakkarider har den følgende molekylvektfordeling:
- (i) 90 vekt% av nevnte hydrogenerte dekstranoligosakkarider har molekylvekter på mindre enn 2,700 Dalton,
 - (ii) Mw-en av 10 vekt%-fraksjonen av de hydrogenerte dekstranoligosakkaridene som har de høyeste molekylvektene er under 3,200 Dalton,
 - 10 (iii) et dimersakkaridinnhold på 2,3 vekt% eller mindre, basert på den totale vekten av det hydrogenerte oligosakkaridet,
 - (iv) et monomersakkaridinnhold på 0,5 vekt% eller mindre, basert på den totale vekten av det hydrogenerte oligosakkaridet,
- 15 og hvor den tilsynelatende molekylvekten (M_p) av jernoligosakkaridforbindelsen er 130,000 til 180,000 Dalton.
- 8.** En forbindelse i henhold til et hvilket som helst av de foregående kravene, hvor den vektmidlere molekylvekten (M_w) av det hydrogenerte oligosakkaridet er
- 20 tilnærmet 1,000 Dalton.
- 9.** En forbindelse i henhold til et hvilket som helst av de foregående kravene, hvor den tilsynelatende molekylvekten (M_p) av nevnte forbindelse er 130,000 til 160,000 Dalton.
- 25 **10.** En forbindelse i henhold til et hvilket som helst av de foregående kravene, som videre omfatter saltet av en organisk hydrokssyre, fortrinnsvis valgt fra citrater.
- 30 **11.** En sammensetning som omfatter en farmakologisk effektiv mengde av en forbindelse i henhold til hvilket som helst foregående krav, og minst en farmasøytisk akseptabel bærer.

12. En forbindelse i henhold til et hvilket som helst av krav 1 til 10 eller en sammensetning i henhold til krav 11 for anvendelse i profylaksen eller behandlingen av jernmangelanemi i et humant individ.

5 **13.** En fremgangsmåte for å fremstille en jernoligosakkaridforbindelse i henhold til et hvilket som helst av krav 1 til 10, som omfatter trinnene med:

- (a) å hydrolysere et dekstranpolysakkarid for å redusere dets molekylvekt,
- (b) å hydrogenere det resulterende oligosakkarid for å omdanne funksjonelle aldehydgrupper til alkoholgrupper,
- 10 (c) å fraksjonere det hydrogenerte oligosakkaridet i henhold til molekylvekt, slik at den rensede fraksjonen har en vektmidlere molekylvekt lik med eller mindre enn 3,000 Dalton,
- (d) å kombinere det resulterende fraksjonerte hydrogenerte oligosakkaridet som en vandig løsning med minst ett vannløselig jern(III)salt,
- 15 (e) å tilsette base til den resulterende vandige løsningen for å danne jern(III)hydroksid, og
- (f) å varme opp den resulterende basiske løsningen for å transformere jern(III)hydroksidet til jern(III)oksyhydroksid i assosiasjon med nevnte oligosakkarid;
- 20

karakterisert ved at trinn (c) omfatter en prosedyre for rensing ved én eller flere membranprosesser som har en grenseverdi mellom 340 and 800 Dalton, hvilken prosedyre blir fortsatt inntil innholdet av dimersakkarid i den rensede fraksjonen av oligosakkarid har blitt redusert til 2,9 vekt% eller mindre, basert på den totale vekten av det hydrogenerte oligosakkaridet.

25