



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 4167962 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/08 (2006.01)
A61K 31/7105 (2006.01)
A61P 1/04 (2006.01)
A61K 47/02 (2006.01)
A61K 47/12 (2006.01)
A61K 47/14 (2017.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2023.11.13
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.08.02
(86)	European Application Nr.	22785698.6
(86)	European Filing Date	2022.09.09
(87)	The European Application's Publication Date	2023.04.26
(30)	Priority	2021.09.09, EP, 21275126
(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	Index Pharmaceuticals AB, Berzelius väg 13, 171 65 Solna, Sverige
(72)	Inventor	CORONA, Franziska Müller, 4402 Frenkendorf, Sveits WANNER, Ralf, 79599 Wittlingen, Tyskland DATHE, Britta, 4106 Therwil, Sveits SANDWALL, Pernilla Helena, 167 67 Bromma, Sverige JOHANSSON, Christine Dieterich, 186 50 Vallentuna, Sverige ALHADEFF, Paul, 147 63 Uttran, Sverige
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54)	Title	ENEMA FORMULATION
(56)	References Cited:	WO-A1-2021/037764 ATREYA RAJA ET AL: "Cobitolimod for moderate-to-severe, left-sided ulcerative colitis (CONDUCT): a phase 2b randomised, double-blind, placebo-controlled, dose-ranging induction trial", THE LANCET - GASTROENTEROLOGY & HEPATOLOGY, ELSEVIER, US, vol. 5, no. 12, 30 November 2020 (2020-11-30), pages 1063-1075, XP009533631, ISSN: 2468-1253, DOI: 10.1016/S2468-1253(20)30301-0 cited in the application JANNIN VINCENT ET AL: "Rectal route in the 21st Century to treat children", ADVANCED DRUG DELIVERY REVIEWS, ELSEVIER, AMSTERDAM , NL, vol. 73, 25 May 2014 (2014-05-25), pages 34-49, XP028855089, ISSN: 0169-409X, DOI: 10.1016/J.ADDR.2014.05.012 cited in the application

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/>

4167962

Patentkrav

1. Vandig formulering som egner seg for rektal administrasjon, omfattende (i) et oligonukleotid som omfatter sekvensen 5'-GGAACAGTTCGTCCATGGC-3' (SEQ ID NO:2), (ii) i det minste ett konserveringsmiddel og (iii) en buffer som
5 omfatter sitronsyre og et fosfatsalt.
2. Formulering ifølge krav 1, hvor det i det minste ene konserveringsmiddel omfatter ett eller flere parabener,
fortrinnsvis hvor det i det minste ene konserveringsmiddel velges fra gruppen
10 bestående av Na-metylparaben, Na-propylparaben og blandinger derav.
3. Formulering ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, hvor formuleringen har en pH-verdi i området fra 6,0 til 8,0,
fortrinnsvis hvor formuleringen har en pH-verdi i området fra 6,5 til 8,0.
15
4. Formulering ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, hvor fosfatsaltet er dinatriumhydrogenfosfat.
5. Formulering ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, hvor nevnte
20 oligonukleotid har sekvensen 5'-GGAACAGTTCGTCCATGGC-3' (SEQ ID NO:2), hvor CG-dinukleotidet er umetylert,
fortrinnsvis hvor nevnte oligonukleotid har sekvensen 5'-
G*G*A*ACAGTTCGTCCAT*G*G*C-3' (SEQ ID NO:1), hvor CG-
dinukleotidet er umetylert,
25 mer foretrukket hvor oligonukleotidet er kobitolimod.
6. Formulering ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, hvor oligonukleotidet er til stede i formuleringen i en konsentrasjon på fra 0,5 til 15 mg/mL,
30 fortrinnsvis hvor oligonukleotidet er til stede i formuleringen i en konsentrasjon på fra 2,5 til 12,5 mg/mL.

4167962

7. Forfylt klyster som egner seg for selvadministrering, idet nevnte forfylte klyster omfatter:

- (a) en beholder; og inne i beholderen
- (b) formuleringen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6.

5

8. Forfylt klyster ifølge krav 7, hvor beholderen omfatter en sammentrykkbar flaske, fortrinnsvis hvor den sammentrykkbare flaske er en trekkharmonikaformet flaske.

9. Forfylt klyster ifølge krav 8, hvor flasken er tildannet av polyetylen, fortrinnsvis

10 hvor flasken er tildannet av poetylen med lav tetthet.

10. Forfylt klyster ifølge et hvilket som helst av kravene 7 til 9, hvor beholderen videre omfatter en applikator som egner seg for dispensering av formuleringen, fortrinnsvis hvor applikatoren omfatter en spiss som egner seg for innføring i rektum.

15

11. Forfylt klyster ifølge krav 10, hvor applikatoren er tildannet av polyetylen, fortrinnsvis hvor applikatoren er tildannet av poetylen med lav tetthet.

12. Forfylt klyster ifølge et hvilket som helst av kravene 7 til 11, hvor mengden av formulering inne i beholderen er fra 20 til 60 mL, fortrinnsvis hvor mengden av formulering inne i beholderen er cirka 50 mL.

20

13. Pakke som omfatter ett eller flere forfylte klyster ifølge et hvilket som helst av kravene 7 til 12.

25

14. Formulering ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6 for anvendelse i behandlingen av en inflammatorisk tarmsykdom, fortrinnsvis hvor nevnte inflammatoriske tarmsykdom er ulcerøs kolitt eller Crohns sykdom.

30

15. Formulering for anvendelse ifølge krav 14, hvor formuleringen administreres rektalt under anvendelse av det forfylte klyster ifølge et hvilket som helst av kravene 7 til 12,

4167962

fortrinnsvis hvor formuleringen selvadministreres under anvendelse av det forfylte klyster ifølge et hvilket som helst av kravene 7 til 12.