



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2685979 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/496 (2006.01)
A61K 9/00 (2006.01)
A61K 31/551 (2006.01)
A61P 25/00 (2006.01)
A61P 25/18 (2006.01)
A61P 25/24 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2017.01.09
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2016.08.24
(86)	European Application Nr.	12712189.5
(86)	European Filing Date	2012.03.19
(87)	The European Application's Publication Date	2014.01.22
(30)	Priority	2011.03.18, US, 201161454008 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	Alkermes Pharma Ireland Limited, Connaught House 1 Burlington Road, Dublin 4, IE-Ireland
(72)	Inventor	HICKEY, Magali, B., 852 Winter Street, Waltham, MA 02451, US-USA PERRY, Jason, M., 852 Winter Street, Waltham, MA 02451, US-USA DEAVER, Daniel, R., 852 Winter Street, Waltham, MA 02451, US-USA REMENAR, Julius, F., 852 Winter Street, Waltham, MA 02451, US-USA VANDIVER, Jennifer, 852 Winter Street, Waltham, MA 02451, US-USA
(74)	Agent or Attorney	Plougmann Vingtoft, Postboks 1003 Sentrum, 0104 OSLO, Norge

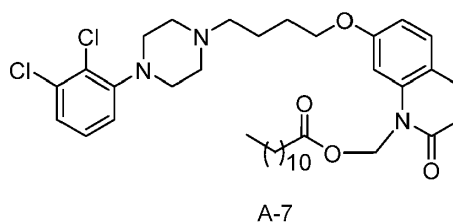
(54)	Title	INJECTABLE PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS COMPRISING A WATER-INSOLUBLE ANTI-PSYCHOTIC, SORBITAN LAURATE AND POLYSORBATE 20
(56)	References Cited:	WO-A1-2010/151711 GB-A- 2 017 701 US-A1- 2005 032 811 US-A1- 2009 163 519 SHINTANI S ET AL: "A new method to determine the irritation of drugs after intramuscular injection in rabbits", TOXICOLOGY AND APPLIED PHARMACOLOGY, ACADEMIC PRESS, US, vol. 11, no. 2, 1 September 1967 (1967-09-01), pages 293-295,IN1,29, XP024883173, ISSN: 0041-008X, DOI: 10.1016/0041-008X(67)90072-5 [retrieved on 1967-09-01]

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 farmasøytisk sammensetning som omfatter:

(a) forbindelse A-7



(b) sorbitanlaurat;
(c) polysorbat 20; og
(d) en vandig bærer;

hvor sammensetningen danner en vandig, flokkulert, injiserbar suspensjon.

2. Sammensetningen ifølge krav 1, hvor sammensetningen omfatter komponenter (b) og (c) i et forhold som resulterer i fnokker som omfatter komponent (a), hvor fnokkene bunnfeller til mer enn en forhåndsbestemt sedimentskikthøyde, slik at komponentene (a), (b) og (c) kan re-suspenderes for injeksjon.

3. Sammensetningen ifølge krav 2, hvor skikthøyden består av minst en 20 til 80 % økning i sedimenthøyden sammenlignet med en ikke-flokkulert sammensetning etter 24 timer av uforstyrret hvile.

4. Sammensetningen ifølge krav 2, hvor komponentene (a), (b) og (c) kan re-suspenderes for injeksjon innen 1-60 sekunder med risting for hånd.

5. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, hvor forholdet av komponents (b) til (c) er slik at sammensetningen kan injiseres ved anvendelse av en 20 til 25 gauge nål.

6. Sammensetningen ifølge krav 2, hvor (a), (b) og (c) danner fnokker som har de følgende størrelser: Dv[10]: 2-10µm, Dv[50]: 10-30µm, og Dv[90]: mindre enn 65 µmM.

7. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, hvor forholdet av komponentene (b) til (c) er omtrent 5 til 2, etter vekt.

8. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, som omfatter omtrent 0,2 - 1 vekt% av sorbitanlaurat.

9. Sammensetningen ifølge krav 1, som omfatter omtrent 0,05 - 0,8 vekt% av polysorbat 20.

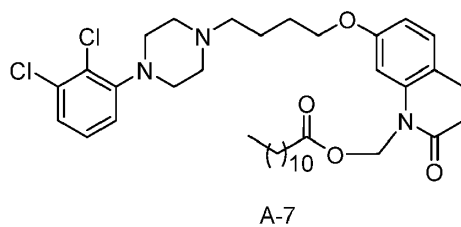
10. Sammensetningen ifølge krav 1, som omfatter omtrent 0,1 - 0,3 vekt% av polysorbat 20.

11. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, som omfatter omtrent 15 - 35 vekt% av forbindelse A-7.

12. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, som omfatter omtrent 20 - 30 vekt% av forbindelse A-7.

13. En injiserbar farmasøytisk sammensetning som omfatter:

(a) forbindelse A-7:



hvor komponent (a) er i et vektforhold på omtrent 15 - 35 %;

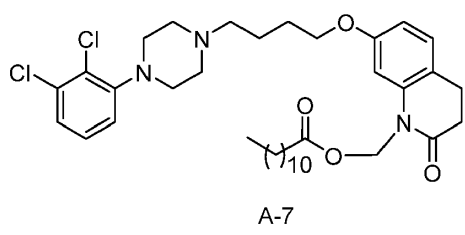
(b) sorbitanlaurat i et vektforhold på omtrent 0,2 - 1 %

(c) polysorbat 20 i et vektforhold på omtrent 0,05 - 0,8 %; og

(d) en vandig bærer.

14. En injiserbar sammensetning som omfatter:

(a) forbindelse A-7:



- (b) sorbitanlaurat;
 (c) polysorbat 20; og
 (d) en vandig bærer.

15. Sammensetningen ifølge krav 14, hvor sammensetningen er formulert for modulering av vevsreaksjon assosiert med avleveringen av et vann-uløselig antipsykotisk middel.

16. Sammensetningen ifølge krav 15, hvor moduleringen av vevsreaksjonen er en reduksjon av irritasjonen på injeksjonsstedet.

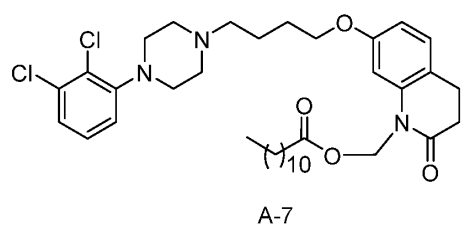
17. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 16, for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av forstyrrelser i sentralnervesystemet.

18. Sammensetningen for anvendelse ifølge krav 17, hvor forstyrrelsen er en psykotisk tilstand.

19. Sammensetningen for anvendelse ifølge krav 18, hvor den psykotiske tilstanden er schizofreni eller schizofreniforme sykdommer.

20. En farmasøytisk sammensetning som omfatter:

- (a) 24 - 30 vekt% forbindelse A-7:



- (b) 0,2 - 1 vekt% sorbitanlaurat;
 (c) 0,1 – 0,3 vekt% polysorbat 20; og
 (d) en vandig bærer.

21. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1, 13, 14 eller 20, hvor den vandige bæreren er en buffer.

5 **22.** Sammensetningen ifølge krav 21, hvor bufferen er en fosfat-, citrat-, tartrat- eller acetatbuffer.

23. Sammensetningen ifølge krav 21 eller 22, hvor den vandige bæreren er fosfat-bufret saltløsning.