



(12) Translation of new
European patent specification
After opposition procedure

(11) NO/EP 2868318 B2

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

A61K 31/496 (2006.01)

A61K 9/00 (2006.01)

A61K 9/10 (2006.01)

A61K 47/02 (2006.01)

A61K 47/08 (2006.01)

A61K 47/10 (2017.01)

A61K 47/18 (2017.01)

A61K 47/22 (2006.01)

A61K 47/26 (2006.01)

A61K 47/32 (2006.01)

A61K 47/34 (2017.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2019.07.22
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.03.06
(45)	Decision of the opposition in EPO	2022.01.26
	Decision of the opposition in NIPO	2022.04.04
(86)	European Application Nr.	13781458.8
(86)	European Filing Date	2013.04.23
(87)	The European Application's Publication Date	2015.05.06
(30)	Priority	2012.04.23, US, 201261636932 P 2013.03.15, US, 201361791896 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
	Designated Extension States:	BA ; ME
(73)	Proprietor	OTSUKA PHARMACEUTICAL CO., LTD., 9, Kanda-Tsukasamachi 2-chome, Chiyoda-kuTokyo101-8535, Japan
(72)	Inventor	SATO, Tetsuya, c/o OTSUKA PHARMACEUTICAL CO., LTD.1-7-1, DoshomachiChuo-ku, Osaka-shiOsaka 541-0045, Japan MINOWA, Takuya, c/o OTSUKA PHARMACEUTICAL CO., LTD.1-7-1, DoshomachiChuo-ku, Osaka-shiOsaka 541-0045, Japan HOSHIKA, Yusuke, c/o OTSUKA PHARMACEUTICAL CO., LTD.1-7-1, DoshomachiChuo-ku, Osaka-shiOsaka 541-0045, Japan TOYOFUKU, Hidekazu, c/o OTSUKA PHARMACEUTICAL CO., LTD.1-7-1, DoshomachiChuo-ku, Osaka-shiOsaka 541-0045, Japan
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54) Title **INJECTABLE FORMULATION**

(56) References

Cited:

WO-A1-02/15878
WO-A1-2013/162046
JP-A- H1 129 463
EP-A1- 1 312 356
WO-A1-2012/026562
WO-A1-2013/162048
JP-A- 2006 316 052
JP-A- 2010 507 566

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/>

[EP2868318]

1

Patentkrav

- 5 1. Preparat som kan injiseres omfattende 7-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-yl-piperazin-1-yl)butoksy]-1H-kinolin-2-on eller et salt derav, partikkelbinder, og vann til injeksjon, partikkelbindene omfatter (i) natriumklorid og (ii) minst ett medlem valgt fra gruppen bestående av polyoksyetylen-sorbitan-fettsyreestere og polyetylenglykoler.
- 10 2. Preparat som kan injiseres ifølge krav 1, hvor partikkelbindene omfatter natriumklorid og en polyetylenglykol.
3. Preparat som kan injiseres ifølge krav 2, hvor polyetylen-glykolen er makrogol 400 eller makrogol 4000.
- 15 4. Preparat som kan injiseres ifølge krav 2 eller 3, videre omfattende en polyoksyetylen-sorbitan-fettsyreester.
- 20 5. Preparat som kan injiseres ifølge krav 4, hvor polyoksyetylen-sorbitan-fettsyreesteren er polyoksyetylen(20)-sorbitanoleat.
- 25 6. Preparat som kan injiseres ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5, hvor sekundære partikler dannes ved aggregering av partikler (primære partikler) av 7-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-yl-piperazin-1-yl)butoksy]-1H-kinolin-2-on eller et salt derav, de sekundære partiklene har en gjennomsnittlig partikkeldiameter (en middel sekundær partikkeldiameter) på 4 til 17 µm.
- 30 7. Preparat som kan injiseres ifølge krav 6, hvor de primære partiklene av 7-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-yl-piperazin-1-yl)butoksy]-1H-kinolin-2-on eller et salt derav har en gjennomsnittlig primær-partikkeldiameter på 2 til 5 µm.
8. Preparat som kan injiseres ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7, som har en pH på 5 til 8.

[EP2868318]

2

9. Preparat som kan injiseres ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8, hvor preparatet frigjør en aktiv ingrediens på en slik måte at dens terapeutisk effektive blodkonsentrasjon opprettholdes i minst en uke.

5 10. Preparat som kan injiseres ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 9, hvor 7-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-yl-piperazin-1-yl)butoksy]-1H-kinolin-2-on eller et salt derav er et dihydrat av 7-[4-(4-benzo[b]tiofen-4-yl-piperazin-1-yl)butoksy]-1H-kinolin-2-on.

10 11. Preparat som kan injiseres ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 10, som er til behandling eller forebygging av tilbakefall av schizofreni, bipolar forstyrrelse eller depresjon.

15 12. Preparat som kan injiseres ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 11, hvor preparatet administreres intramuskulært eller subkutan.

13. En ferdigfylt sprøyte som er ferdigfylt med preparatet som kan injiseres ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 12.