



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3172209 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 487/04 (2006.01)
A61J 3/06 (2006.01)
A61J 3/10 (2006.01)
A61K 31/4985 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.05.03
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.12.02
(86)	European Application Nr.	15744702.0
(86)	European Filing Date	2015.07.22
(87)	The European Application's Publication Date	2017.05.31
(30)	Priority	2014.07.25, US, 201462028865 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	Novartis AG, Lichtstrasse 35, 4056 Basel, Sveits
(72)	Inventor	GONCALVES, Elisabete, c/o Novartis Pharma AGPostfach, CH-4002 Basel, Sveits TAUCHMANN, Christin, c/o Novartis Pharma AGPostfach, CH-4002 Basel, Sveits YEN, Chau-fong, c/o Novartis Pharma AGPostfach, CH-4002 Basel, Sveits VIPAGUNTA, Sudha, c/o Novartis Pharmaceuticals CorporationOne Health Plaza, East Hanover, New Jersey 07936, USA ZONG, Zhixin, c/o Novartis Pharmaceuticals CorporationOne Health Plaza, East Hanover, New Jersey 07936, USA
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54)	Title	TABLET FORMULATION OF 2-FLUORO-N-METHYL-4-[7-(QUINOLIN-6-YLMETHYL)IMIDAZO[1,2-B][1,2,4]TRIAZIN-2-YL]BENZAMIDE
(56)	References Cited:	WO-A2-2009/143211 WO-A1-2008/064157

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/>

3172209

1

Patentkrav

1. Tablett omfattende 10–30, i vekt, 10–30 % av 2-fluor-N-metyl-4-[7-(kinolin-6-ylmetyl)imidazo[1,2-b][1,2,4]triazin-2-yl]benzamiddihydrokloridsalt, 50–70 % av ett eller flere fyllstoffer, 3–20 % av ett eller flere desintegreringsmidler, 0,2–2 % av ett eller flere smøremidler, og 0,2–2 % av ett eller flere glidemidler.
5
2. Tabletten ifølge krav 1, som omfatter mannitol, mikrokrystallinsk cellulose, polyvinylpolypyrrolidon, polyvinylpyrrolidon, kolloidalt silisiumdioksid og magnesiumstearat.
10
3. Tabletten ifølge krav 1 eller 2, omfattende en mengde av 2-fluor-N-metyl-4-[7-(kinolin-6-ylmetyl)imidazo[1,2-b][1,2,4]triazin-2-yl]benzamiddihydrokloridsalt, hvori mengden tilsvarende 50 mg av den frie baseformen.
15
4. Tabletten ifølge krav 1 eller 2, omfattende en mengde av 2-fluor-N-metyl-4-[7-(kinolin-6-ylmetyl)imidazo[1,2-b][1,2,4]triazin-2-yl]benzamiddihydrokloridsalt, hvori mengden tilsvarende 100 mg av den frie baseformen.
20
5. Tabletten ifølge et hvilket som helst av kravene 1–4, hvori tabletten omfatter:
(a) en intragranulær fase; og
(b) en ekstragranulær fase.
6. Tabletten ifølge krav 5, hvori den intragranulære fasen omfatter 2-fluor-N-metyl-4-[7-(kinolin-6-ylmetyl)imidazo[1,2-b][1,2,4]triazin-2-yl]benzamiddihydrokloridsalt, mannitol, mikrokrystallinsk cellulose, polyvinylpolypyrrolidon og polyvinylpyrrolidon.
25
7. Tabletten ifølge et hvilket som helst av krav 5 eller 6, hvori den intragranulære fasen omfatter, i vekt av tabletten, 10–30 % av 2-fluor-N-metyl-4-[7-(kinolin-6-ylmetyl)imidazo[1,2-b][1,2,4]triazin-2-yl]benzamiddihydrokloridsalt; 10–30 % av mannitol, 10–30 % av mikrokrystallinsk cellulose, og 0,1–10 % hver av polyvinylpolypyrrolidon og polyvinylpyrrolidon.
30

3172209

2

8. Tabletten ifølge et hvilket som helst av kravene 5–7, hvori den intragranulære fasen omfatter, i vekt av tabletten, ca. 24 % av 2-fluor-N-metyl-4-[7-(kinolin-6-ylmetyl)imidazo[1,2-b][1,2,4]triazin-2-yl]benzamiddihydrokloridsalt; ca. 20 % av mannitol, ca. 20 % av mikrokrySTALLinsk cellulose, ca. 5 % av polyvinylpolypyrrolidon og ca. 4 % av polyvinylpyrrolidon.

9. Tabletten ifølge et hvilket som helst av kravene 5–8, hvori den ekstragranulære fasen omfatter mikrokrySTALLinsk cellulose, kolloidalt silisiumdioksid, polyvinylpolypyrrolidon og magnesiumstearat.

10. Tabletten ifølge et hvilket som helst av kravene 5–9, hvori den ekstragranulære fasen omfatter, i vekt av tabletten, 10–30 % av mikrokrySTALLinsk cellulose og 0,1–10 % hver av kolloidalt silisiumdioksid, polyvinylpolypyrrolidon og magnesiumstearat.

11. Tabletten ifølge et hvilket som helst av kravene 5–10, hvori den ekstragranulære fasen omfatter, i vekt av tabletten, ca. 21 % av mikrokrySTALLinsk cellulose, ca. 0,5 % av kolloidalt silisiumdioksid, 5 % av polyvinylpolypyrrolidon; og ca. 0,75 % av magnesiumstearat.

12. Tabletten ifølge et hvilket som helst av kravene 1–11 for anvendelse i behandling av kreft.

13. Tabletten ifølge krav 1, hvori tabletten omfatter:

(a) en intragranulær fase omfattende, i vekt:

10–30 % av 2-fluor-N-metyl-4-[7-(kinolin-6-ylmetyl)imidazo[1,2-b][1,2,4]triazin-2-yl]benzamiddihydroklorisyresalt,
 10–30 % av mannitol,
 10–30 % av mikrokrySTALLinsk cellulose,
 0–1 % av natriumdodecylsulfat,
 1–10 % av polyvinylpolypyrrolidon, og
 1–10 % av polyvinylpolypyrrolidon; og

(b) en ekstragranulær fase omfattende, i vekt:

10–30 % av mikrokrySTALLinsk cellulose,

3172209

3

0,1–1 % av kolloidalt silisiumdioksid,
 1–10 % av polyvinylpolypyrrolidon, og
 0,1–1 % av magnesiumstearat;

hvor prosentandelene gitt for de respektive bestanddelene er relativt den totale
 5 vekten av tabletten.

14. Tabletten ifølge krav 1, hvor tabletten omfatter:

(a) en intragranulær fase omfattende, i vekt, ca.:

23,54 % av 2-fluor-N-metyl-4-[7-(kinolin-6-ylmetyl)imidazo[1,2-
 10 b][1,2,4]triazin-2-yl]benzamiddihydroklorsyresalt,
 20 % av mannitol,
 20,26 % av mikrokrySTALLinsk cellulose,
 0–2 % av natriumdodecylsulfat,
 5 % av polyvinylpolypyrrolidon, og
 15 4 % av polyvinylpolypyrrolidon; og

(b) en ekstragranulær fase omfattende, i vekt, ca.:

20,75 % av mikrokrySTALLinsk cellulose,
 0,5 % av kolloidalt silisiumdioksid,
 5 % av polyvinylpolypyrrolidon, og
 20 0,75 % av magnesiumstearat;

hvor prosentandelene gitt for de respektive bestanddelene er relativt den totale
 vekten av tabletten.