



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3263106 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/10 (2006.01)
A61K 31/47 (2006.01)
A61K 47/02 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)
A61P 43/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2024.01.15
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.10.25
(86)	European Application Nr.	16755489.8
(86)	European Filing Date	2016.02.23
(87)	The European Application's Publication Date	2018.01.03
(30)	Priority	2015.02.25, US, 201562120561 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	Eisai R&D Management Co., Ltd., 4-6-10 Koishikawa Bunkyo-ku, Tokyo 112-8088, Japan
(72)	Inventor	NAGANE, Kentaro, c/o Eisai Co. Ltd. Kawashima Industrial Complex 1 Kawashimatakehaya-machi, Kakamigahara-shi Gifu 501-6024, Japan UEKI, Yosuke, c/o Eisai Co. Ltd. Kawashima Industrial Complex 1 Kawashimatakehaya-machi, Kakamigahara-shi Gifu 501-6024, Japan SANO, Shusuke, c/o Eisai Co. Ltd. Kawashima Industrial Complex 1 Kawashimatakehaya-machi, Kakamigahara-shi Gifu 501-6024, Japan SAKAGUCHI, Takahisa, c/o Eisai Co. Ltd. Tsukuba Research Laboratories 5-1-3 Tokodai, Tsukuba-shi Ibaraki 300-2635, Japan
(74)	Agent or Attorney	RWS, Europa House, Chiltern Park, Chiltern Hill, SL99FG CHALFONT ST PETER, Storbritannia

(54) Title **METHOD FOR SUPPRESSING BITTERNESS OF QUINOLINE DERIVATIVE**

(56) References Cited:

WO-A1-2006/030826
WO-A1-2008/053602
WO-A1-2011/021597
JP-A- H05 194 259
US-A1- 2012 077 842
US-A1- 2013 237 565
TAKANORI TANAKA ET AL.: 'Tandospirone Citrate Jo 10mg 'Amel' no Seibutsugakuteki Dotosei Shiken' SHIN'YAKU TO RINSHO vol. 57, no. 6, June 2008, pages 936 - 951, XP009505465

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. Anvendelse av et basisk stoff valgt fra et basisk oksid, et basisk karbonat eller et basisk hydroksid, fortrinnsvis kalsiumkarbonat eller magnesiumoksid, og mer foretrukket kalsiumkarbonat, for å undertrykke bitterheten av 4-(3-klor-4-(syklopropylaminokarbonyl)aminofenoksy)-7-metoksy-6-kinolinkarboksyamid, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, fortrinnsvis et mesylat derav, hvori fortrinnsvis 0,01 til 50 vektdeler av det basiske stoffet blandes per 1 vektdel av 4-(3-klor-4-(syklopropylaminokarbonyl)aminofenoksy)-7-metoksy-6-kinolinkarboksyamid eller det farmasøytisk akseptable saltet derav eller 0,16 til 80 mol av det basiske stoffet blandes per 1 mol av 4-(3-klor-4-(syklopropylaminokarbonyl)aminofenoksy)-7-metoksy-6-kinolinkarboksyamid eller det farmasøytisk akseptable saltet derav.
5
10
2. Anvendelse ifølge krav 1 for å undertrykke bitterhet av 4-(3-klor-4-(syklopropylaminokarbonyl)aminofenoksy)-7-metoksy-6-kinolinkarboksyamid, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav i en farmasøytisk sammensetning, omfattende 4-(3-klor-4-(syklopropylaminokarbonyl)aminofenoksy)-7-metoksy-6-kinolinkarboksyamid eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, fortrinnsvis et mesylat derav, og 0,01 til 50 vektdeler av det basiske stoffet per 1 vektdel av 4-(3-klor-4-(syklopropylaminokarbonyl)aminofenoksy)-7-metoksy-6-kinolinkarboksyamid eller det farmasøytisk akseptable saltet derav, fortrinnsvis 0,16 til 80 mol av det basiske stoffet per 1 mol av 4-(3-klor-4-(syklopropylaminokarbonyl)aminofenoksy)-7-metoksy-6-kinolinkarboksyamid eller det farmasøytisk akseptable saltet derav.
15
20
3. Anvendelse ifølge krav 2, hvori den farmasøytiske sammensetningen er i en doseringsform av en oralt desintegrerende tablett, et tyggbart preparat, en brusetablett, en dispergerbar tablett, en løselig tablett, en sirup, et preparat for en sirup, en pastill, eller et oralt flytende preparat og fortrinnsvis er et preparat som kan suspenderes i et vandig løsningsmiddel ved en administrering for å fremstille en suspensjon.
25
30
4. Anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–3, hvori det basiske stoffet er kalsiumkarbonat eller magnesiumoksid.
5. Anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–3, hvori det basiske stoffet er kalsiumkarbonat.
35
6. Suspensjon omfattende 4-(3-klor-4-(syklopropylaminokarbonyl)aminofenoksy)-7-metoksy-6-kinolinkarboksyamid eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og et basisk

stoff for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av kreft, fremgangsmåten omfattende:

- 1) å suspendere en farmasøytisk sammensetning omfattende 1 til 24 mg av 4-(3-klor-4-(syklopropylaminokarbonyl)aminofenoksy)-7-metoksy-6-kinolinkarboksyamid eller det 5 farmasøytisk akseptable saltet derav, fortrinnsvis et mesylat derav, og det basiske stoffet, som velges fra et basisk oksid, et basisk karbonat eller et basisk hydroksid, fortrinnsvis kalsiumkarbonat eller magnesiumoksid, og mer foretrukket kalsiumkarbonat, i et vandig løsningsmiddel i en beholder;
- 2) å administrere en suspensjon oppnådd i 1) til en pasient fra beholderen;
- 10 3) å skylle beholderen med et vandig løsningsmiddel; og
- 4) å administrere en skylleløsning oppnådd i 3) til pasienten.

7. Suspensjonen for anvendelse ifølge krav 6, hvori 1) omfatter: i) å helle det vandige løsningsmidlet i beholderen, ii) å tillate beholderen å stå; og iii) å riste beholderen.

15

8. Suspensjonen for anvendelse ifølge krav 6 eller 7, hvori den farmasøytiske sammensetningen suspenderes i 1 til 10 ml av det vandige løsningsmidlet i 1).

9. Suspensjonen for anvendelse ifølge krav 8, hvori den farmasøytiske 20 sammensetningen suspenderes i ca. 3 ml av det vandige løsningsmidlet i 1).

10. Suspensjonen for anvendelse ifølge krav 6, hvori beholderen skylles med 1 til 10 ml av det vandige løsningsmidlet i 3).

25 11. Suspensjonen for anvendelse ifølge krav 10, hvori beholderen skylles med ca. 2 ml av det vandige løsningsmidlet i 3).

12. Suspensjonen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 6–11, hvori det basiske stoffet er kalsiumkarbonat eller magnesiumoksid.

30

13. Suspensjonen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 6–11, hvori det basiske stoffet er kalsiumkarbonat.