



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3518905 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/20 (2006.01)
A61K 31/496 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.09.27
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.04.28
(86)	European Application Nr.	17794060.8
(86)	European Filing Date	2017.09.29
(87)	The European Application's Publication Date	2019.08.07
(30)	Priority	2016.10.03, IN, 201641033741
(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	Suven Life Sciences Limited, 5th Floor Serene Chambers Road No. 5 Off Avenue 7 Banjara Hills, Hyderabad, Telangana 500034, India
(72)	Inventor	NIROGI, Ramakrishna, Suven Life Sciences LimitedSerene ChambersRoad- 5Avenue 7Banjara Hills, HyderabadTelangana 500034, India MUDIGONDA, Koteswara, Suven Life Sciences LimitedSerene ChambersRoad- 5Avenue 7Banjara Hills, HyderabadTelangana 500034, India DOGIPARTI, Dhanunjay Kumar, Suven Life Sciences LimitedSerene ChambersRoad-5Avenue 7Banjara Hills, HyderabadTelangana 500034, India JASTI, Venkateswarlu, Suven Life Sciences LimitedSerene ChambersRoad- 5Avenue 7Banjara Hills, HyderabadTelangana 500034, India
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54)	Title	PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS OF 5-HT6 ANTAGONIST
(56)	References Cited:	WO-A1-2015/083179 US-B2- 7 875 605

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. Farmasøytisk sammensetning med øyeblikkelig frigjøring på totalt 100 vekt-%
omfatter:

- 5 a) fra 2 % til 60 % 1-[(2-bromfenyl)sulfonyl]-5-metoksy-3-[(4-metyl-1-piperazinyl)metyl]-1H-indol eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav;
- b) fra 36 % til 97 % fortynningsmiddel eller totalt to fortynningsmidler; hvori
fortynningsmidlet er valgt fra gruppen som består av mikrokrystallinsk cellulose,
laktosemonohydrat, dibasisk kalsiumfosfat, laktose, laktosehydrat, laktoseanhydrat, mannitol,
10 stivelse og isomalt;
- c) fra 0,5 % til 2 % smøremiddel; hvori smøremidlet er magnesiumstearat;
- d) fra 0,5 % til 1 % glidemiddel; hvori glidemidlet er kolloidalt silisiumdioksid; e) 0 %
til 10 % bindemiddel; hvori bindemidlet er valgt fra gruppen som består av povidon eller
hydroksypropylmetylcellulose;
- 15 f) 0 % til 5 % desintegreringsmiddel; hvori desintegreringsmidlet er valgt fra
krysspovidon, natriumstivelsesglykolat og krysskarmellosenatrium; og
- g) 0 % til 2 % surgjørende middel; hvori det surgjørende midlet er sitronsyre.
2. Farmasøytisk sammensetning med øyeblikkelig frigjøring ifølge krav 1, hvori
20 sammensetningen omfatter totalt 100 vekt-%:
- (a) fra 2 % til 60 % 1-[(2-bromfenyl)sulfonyl]-5-metoksy-3-[(4-metyl-1-piperazinyl)metyl]-1H-indoldimesylatmonohydrat;
- (b) fra 36 % til 97 % av ett fortynningsmiddel eller totalt to fortynningsmidler; der
fortynningsmidlet er valgt fra gruppen som består av mikrokrystallinsk cellulose,
25 laktosemonohydrat, dibasisk kalsiumfosfat, laktose, laktosehydrat, laktoseanhydrat, mannitol,
stivelse og isomalt;
- (c) fra 0,5 % til 2 % smøremiddel; hvori smøremidlet er magnesiumstearat;
- (d) fra 0,5 % til 1 % glidemiddel; hvori glidemidlet er kolloidalt silisiumdioksid;
- (e) 0 % til 10 % bindemiddel; hvori bindemidlet er valgt fra gruppen som består av
30 povidon eller hydroksypropylmetylcellulose;
- (f) 0 % til 5 % desintegreringsmiddel; hvori desintegreringsmidlet er valgt fra
krysspovidon, natriumstivelsesglykolat og krysskarmellosenatrium og
- (g) 0 % til 2 % surgjørende middel; hvori det surgjørende midlet er sitronsyre.

3. De farmasøytiske sammensetningene med øyeblikkelig frigjøring som angitt i krav 1 eller 2, hvori sammensetningen på totalt 100 vekt-% er valgt fra gruppen som består av:

1) (a) fra 2 % til 3 % 1-[(2-bromfenyl)sulfonyl]-5-metoksy-3-[(4-metyl-1-piperazinyll)metyl]-1H-indoldimesylatmonohydrat, (b) fra 95 % til 97 % fortynningsmiddel, (c) 1 % smøremiddel og (d) 0,5 % glidemiddel;

2) (a) fra 11 % til 38 % 1-[(2-bromfenyl)sulfonyl]-5-metoksy-3-[(4-metyl-1-piperazinyll)metyl]-1H-indoldimesylatmonohydrat, (b) fra 61 % til 87 % av ett fortynningsmiddel eller totalt to fortynningsmidler, (c) 1 % smøremiddel, (d) 0,5 % glidemiddel, (e) 2 % desintegreringsmiddel og (f) 1 % surgjørende middel;

3) (a) fra 24 % til 38 % 1-[(2-bromfenyl)sulfonyl]-5-metoksy-3-[(4-metyl-1-piperazinyll)metyl]-1H-indoldimesylatmonohydrat (b) fra 61 % til 72 % av ett fortynningsmiddel eller totalt to fortynningsmidler, (c) fra 1 % til 1,25 %, (d) 0,5 % glidemiddel og (e) 2 % desintegreringsmiddel;

4) (a) fra 37 % til 51 % 1-[(2-bromfenyl)sulfonyl]-5-metoksy-3-[(4-metyl-1-piperazinyll)metyl]-1H-indoldimesylatmonohydrat, (b) fra 45 % til 60 % fortynningsmiddel, (c) 1 % smøremiddel, (d) 0,5 % glidemiddel, (e) 2 % desintegreringsmiddel og (f) 1 % surgjørende middel;

5) (a) fra 36 % til 60 % 1-[(2-bromfenyl)sulfonyl]-5-metoksy-3-[(4-metyl-1-piperazinyll)metyl]-1H-indoldimesylatmonohydrat, (b) fra 36 % til 62 % fortynningsmiddel, (c) fra 0,5 % til 1 % smøremiddel, (d) 0,5 % glidemiddel og (e) 2 % desintegreringsmiddel; og

6) (a) fra 11 % til 38 % 1-[(2-bromfenyl)sulfonyl]-5-metoksy-3-[(4-metyl-1-piperazinyll)metyl]-1H-indoldimesylatmonohydrat; (b) fra 61 % til 72 % fortynningsmiddel; (c) fra 2 % til 5 % bindemiddel; (d) 1 % smøremiddel; (e) 0,5 % glidemiddel og (f) fra 2 % til 4 % desintegreringsmiddel.

4. Den farmasøytiske sammensetningen med øyeblikkelig frigjøring ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvori doseringen av 1-[(2-bromfenyl)sulfonyl]-5-metoksy-3-[(4-metyl-1-piperazinyll)metyl]-1H-indol eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav er fra 5 mg til 200 mg.

5. Den farmasøytiske sammensetningen med øyeblikkelig frigjøring ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, hvori sammensetningen er i form av tablett eller kapsel.

6. Den farmasøytiske sammensetningen med øyeblikkelig frigjøring ifølge et hvilket som

helst av kravene 1 til 3, hvori sammensetningen har:

- i) mindre enn 0,5 % av klorurenhet;
- ii) mindre enn 0,5 % av ukjent urenhet;
- iii) mindre enn 1 % av total urenhet.

5

7. Den farmasøytiske sammensetningen med øyeblikkelig frigjøring ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvori renheten av 1-[(2-bromfenyl)sulfonyl]-5-metoksy-3-[(4-metyl-1-piperaziny)l)metyl]-1H-indoldimesylatmonohydrat er 99,3 %.

10 8. Den farmasøytiske sammensetningen med øyeblikkelig frigjøring ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvori sammensetningen har:

- i) 99,3 % renhet av 1-[(2-bromfenyl)sulfonyl]-5-metoksy-3-[(4-metyl-1-piperaziny)l)metyl]-1H-indoldimesylatmonohydrat;
- ii) mindre enn 0,5 % av klorurenhet;
- 15 iii) mindre enn 0,5 % av ukjent urenhet;
- iv) mindre enn 1 % av total urenhet.

9. Den farmasøytiske sammensetningen med øyeblikkelig frigjøring ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvori 1-[(2-bromfenyl)sulfonyl]-5-metoksy-3-[(4-metyl-1-

20 piperaziny)l)metyl]-1H-indoldimesylatmonohydratet frigjøres fra 85 % til 100 % i løpet av 30 minutter når det testes med den roterende skovlen ved 100 rpm med 900 ml oppløsningsmedium, 01N saltsyre eller vann ved 37 °C.

10. Den farmasøytiske sammensetningen med øyeblikkelig frigjøring ifølge krav 5, hvori
25 sammensetningen på totalt 100 vekt-% omfatter:

(a) fra 2 % til 60 % 1-[(2-bromfenyl)sulfonyl]-5-metoksy-3-[(4-metyl-1-piperaziny)l)metyl]-1H-indoldimesylatmonohydrat;

(b) fra 36 % til 97 % av ett fortynningsmiddel eller totalt to fortynningsmidler; der fortynningsmidlet er valgt fra gruppen som består av mikrokrySTALLINSK cellulose,

30 laktosemonohydrat, dibasisk kalsiumfosfat, laktose, laktosehydrat, laktoseanhydrat, mannitol, stivelse og isomalt;

(c) fra 0,5 % til 2 % smøremiddel; hvori smøremidlet er magnesiumstearat;

(d) fra 0,5 % til 1 % glidemiddel; hvori glidemidlet er kolloidalt silisiumdioksid;

(e) 0 % til 10 % bindemiddel; hvori bindemidlet er valgt fra gruppen som består av

povidon eller hydroksypropylmetylcellulose;

(f) 0 % til 5 % desintegreringsmiddel; hvori desintegreringsmidlet er valgt fra krysspovidon, natriumstivelsesglykolat og krysskarmellosenatrium; og

(g) 0 % til 2 % surgjørende middel; hvori det surgjørende midlet er sitronsyre.

5

11. Den farmasøytiske sammensetningen med øyeblikkelig frigjøring ifølge krav 10, hvori sammensetningen på totalt 100 vekt-% omfatter:

(a) fra 2 % til 60 % 1-[(2-bromfenyl)sulfonyl]-5-metoksy-3-[(4-metyl-1-piperazinyl)metyl]-1H-indoldimesylatmonohydrat;

10 (b) fra 36 til 97 vekt-% mikrokrystallinsk cellulose;

(c) fra 0,5 % til 2 % magnesiumstearat;

(d) fra 0,5 % til 1 % kolloidalt silisiumdioksid;

(e) 0 % til 5 % povidon;

(f) 0 % til 4 % krysspovidon; og

15 (g) 0 % til 2 % sitronsyre.

12. Den farmasøytiske sammensetningen med øyeblikkelig frigjøring ifølge krav 10 eller 11, hvori den totale vekten av sammensetningen med øyeblikkelig frigjøring er fra 100 mg til 600 mg.