



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3601277 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 413/14 (2006.01)
A61K 9/14 (2006.01)
A61K 9/20 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2024.02.19
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.10.11
(86)	European Application Nr.	18715593.2
(86)	European Filing Date	2018.03.28
(87)	The European Application's Publication Date	2020.02.05
(30)	Priority	2017.03.30, EP, 17163830
(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	Merck Patent GmbH, Frankfurter Strasse 250, 64293 Darmstadt, Tyskland
(72)	Inventor	GEISSLER, Simon, Homburger Strasse 56, 61352 Bad Homburg, Tyskland JESCHKE, Martina, Auf dem Berg 6, 64846 Gross-Zimmern, Tyskland BONIFORTE, Patrizia, Am Katharinenberg 6a, 64665 Alsbach-Haehnlein, Tyskland WEIGANDT, Markus, Trollblumenweg 22, 68259 Mannheim, Tyskland
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54) Title **PHARMACEUTICAL FORMULATION**

(56) References
Cited: US-A1- 2016 083 401

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. Fast dispersjon av (S)-[2-klor-4-fluor-5-(7-morfolin-4-ylkinazolin-4-yl)fenyl]-(6-metoksy-pyridazin-3-yl)metanol, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, i en polymermatrise omfattende
5 eller bestående av en homopolymer eller kopolymer av polyvinylpyrrolidon.
2. Fast dispersjon ifølge krav 1, hvor polymermatrisen omfatter eller består av en kopolymer av polyvinylpyrrolidon og polyvinylacetat.
- 10 3. Fast dispersjon ifølge krav 1 eller 2, hvor (S)-[2-klor-4-fluor-5-(7-morfolin-4-ylkinazolin-4-yl)fenyl]-(6-metoksy-pyridazin-3-yl)metanol foreligger i sin frie form.
4. Fast dispersjon ifølge ethvert foregående krav, som er en fast løsning.
- 15 5. Fast dispersjon ifølge ethvert foregående krav, hvor konsentrasjonen av (S)-[2-klor-4-fluor-5-(7-morfolin-4-ylkinazolin-4-yl)-fenyl]-(6-metoksy-pyridazin-3-yl)metanol i polymermatrisen er i et område mellom 4 og 50 vektprosent, fortrinnsvis 10 til 30 vektprosent, basert på den totale vekten av den faste dispersjonen.
- 20 6. Farmasøytisk sammensetning omfattende den faste dispersjonen ifølge ethvert foregående krav.
7. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 6, som er en farmasøytisk sammensetning for oral administrering og fortrinnsvis en sammensetning som frigjøres umiddelbart.
- 25 8. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 7, karakterisert ved en oppløsningstid på 15 minutter eller mindre, fortrinnsvis 10 minutter eller mindre.
9. Farmasøytisk sammensetning ifølge ethvert av kravene 6 til 8, hvor den farmasøytiske
30 sammensetningen videre omfatter minst én farmasøytisk akseptabel tilsetning, og er valgt fra en tablett og et granulat.
10. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 9, som er en tablett omfattende:
 - i. 25 til 95 vekt% av den faste dispersjonen ifølge ethvert av kravene 1 til 5;

- ii. 15 til 72,5 vekt% av et fyllstoff;
- iii. 2,5 til 40 vekt% av et sprengmiddel;
- iv. 0 til 5 vekt% av et smøremiddel;
- v. 0 til 20 vekt% av et uorganisk alkalimetallsalt; og

5 vi. totalt 0 til 20 vekt% av én eller flere ytterligere farmasøytisk akseptable tilsetninger, basert på den totale vekten av tablett.

11. Fremgangsmåte for å fremstille den faste dispersjonen ifølge ethvert av kravene 1 til 5, hvor fremgangsmåten omfatter varmsmelteekstrudering eller smeltegranulering.

10

12. Fremgangsmåte ifølge krav 11 for å fremstille den faste dispersjonen ifølge ethvert av kravene 1 til 5, hvor fremgangsmåten omfatter å:

blande og smelte (S)-[2-klor-4-fluor-5-(7-morfolin-4-ylkinazolin-4-yl)fenyl]-(6-metoksy-pyridazin-3-yl)metanol og polymeren til polymermatrisen som skal dannes, og eventuelt minst én

15 farmasøytisk akseptabel tilsetning,

varmsmelteekstrudere eller smeltegranulere blandingen for å danne den faste dispersjonen, eventuelt male den dannede faste dispersjonen.

13. Fremgangsmåte for å fremstille en farmasøytisk sammensetning omfattende dispersjonen ifølge ethvert av kravene 1 til 5, hvor fremgangsmåten omfatter å

20

danne den faste dispersjonen ifølge krav 12;

blande den faste dispersjonen og én eller flere farmasøytisk akseptable tilsetninger;

eventuelt granulere blandingen av den faste dispersjonen og den ene eller de flere

farmasøytisk akseptable tilsetningene,

25

og enten fylle blandingen inn i kapsler eller tablettene blandingen.

14. Farmasøytisk sammensetning ifølge ethvert av kravene 6 til 10 for bruk ved behandling av kreft.

30 15. Farmasøytisk sammensetning for bruk ved behandling av kreft ifølge krav 14, hvor behandlingen videre omfatter radioterapi og/eller kjemoterapi.