

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
28. Februar 2002 (28.02.2002)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 02/15903 A3

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: A61K 31/381,
9/00, 47/14

LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW,
MX, MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK,
SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA,
ZW.

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP01/09595

(22) Internationales Anmeldedatum:
21. August 2001 (21.08.2001)

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW),
eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,
TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK,
ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR),
OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW,
ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
100 41 479.6 24. August 2000 (24.08.2000) DE

Erklärungen gemäß Regel 4.17:

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von
US): SCHWARZ PHARMA AG [DE/DE]; Alfred-Nobel-
Strasse 10, 40789 Monheim (DE).

- hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii) für die folgenden Bestimmungsstaaten AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VN, YU, ZA, ZW, ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)
- hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, die Priorität einer früheren Anmeldung zu beanspruchen (Regel 4.17 Ziffer iii) für alle Bestimmungsstaaten
- Erfindererklärung (Regel 4.17 Ziffer iv) nur für US

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): RIMPLER, Stephan [DE/DE]; Wilhelmine-Fliedner-Strasse 4, 40723 Hilden (DE). GRAPATIN, Sabine [DE/DE]; Tönnesbrucher Feld 32, 40764 Langenfeld (DE). KREIN, Cliff [DE/DE]; Neuenhauser Str. 24, 51491 Overath (DE). THELEN, Markus [DE/DE]; Max-Planck-Weg 9, 40789 Monheim (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: SCHACHT, Dietrich; SCHWARZ PHARMA AG, Alfred-Nobel-Strasse 10, 40789 Monheim (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC,

Veröffentlicht:

- mit internationalem Recherchenbericht

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: NOVEL PHARMACEUTICAL COMPOSITION FOR ADMINISTERING N-0923

(54) Bezeichnung: NEUE PHARMAZEUTISCHE ZUSAMMENSETZUNG ZUR VERABREICHUNG VON N-0923

(57) Abstract: The invention relates to a pharmaceutical composition for administering the dopamine agonist N-0923 in depot form. The invention makes available for the first time a depot form of N-0923, which achieves a therapeutically significant plasma level over a period of at least 24 hours after administration to a patient. As a result of poor oral bio-availability and the short plasma half-life, N-0923 was previously administered either by an intravenous drip or by transdermal systems. Preferred embodiments of said invention are oily suspensions, containing the active ingredient N-0923 in a solid phase, in addition to anhydrous pharmaceutical preparations of N-0923.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung betrifft eine pharmazeutische Zusammensetzung zur Verabreichung des Dopamin-Agonisten N-0923 in Depotform. Es wurde erstmalig eine Depotform von N-0923 zur Verfügung gestellt, mit der nach Applikation beim Patienten ein über mindestens 24 Stunden therapeutisch relevanter Plasmaspiegel erreicht wird. Bisher musste N-0923 wegen der schlechten oralen Bioverfügbarkeit und der kurzen Plasma-Halbwertszeit entweder per Dauerinfusion oder durch transdermale Systeme verabreicht werden. Bevorzugte Ausführungsformen sind ölige Suspensionen, in denen der Wirkstoff N-0923 in fester Phase vorliegt sowie wasserfreie pharmazeutische Zubereitungen von N-0923.



WO 02/15903 A3



(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen
Recherchenberichts:

23. Mai 2002

*Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen
Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on
Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe
der PCT-Gazette verwiesen.*

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 01/09595

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
 IPC 7 A61K31/381 A61K9/00 A61K47/14

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 A61K

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

WPI Data, PAJ, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 97 29735 A (MONASH UNIVERSITY, AU) 21 August 1997 (1997-08-21) claims 1,5,10,11,21-31 page 26, line 15 - line 16 ---	1,16-23
A	WO 99 49852 A (LTS) 7 October 1999 (1999-10-07) claims ---	1,16-23
A	WO 99 49844 A (LTS) 7 October 1999 (1999-10-07) claims ---	1,16-23
A	WO 90 13294 A (WHITBY RESEARCH INC., U.S.A.) 15 November 1990 (1990-11-15) claims 1,11-14,23-25 page 12, line 5 -page 14, line 10 --- -/--	1,16-23

Further documents are listed in the continuation of box C.

Patent family members are listed in annex.

° Special categories of cited documents :

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier document but published on or after the international filing date
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- * & * document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

27 February 2002

Date of mailing of the international search report

08/03/2002

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
 NL - 2280 HV Rijswijk
 Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl.
 Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Scarponi, U

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 01/09595

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 89 12445 A (NELSON RESEARCH & DEVELOPMENT CO., U.S.A.) 28 December 1989 (1989-12-28) claims 1,10-14,23-27,36-39 -----	1,16-23
A	EP 0 230 629 A (NELSON RESEARCH & DEVELOPMENT CO., U.S.A.) 5 August 1987 (1987-08-05) cited in the application claims -----	1,16-23
A,P	WO 01 13903 A (BOEHRINGRE INGELHEIM PHARMA KG, DE) 1 March 2001 (2001-03-01) claims 1,11,12,14,22-29 -----	1,16-23

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 01/09595

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date			
WO 9729735	A	21-08-1997	AU 706967 B2	01-07-1999			
			AU 1713497 A	02-09-1997			
			WO 9729735 A1	21-08-1997			
			EP 0901368 A1	17-03-1999			
			JP 2000504697 T	18-04-2000			
			US 6299900 B1	09-10-2001			
WO 9949852	A	07-10-1999	DE 19814084 A1	14-10-1999			
			AT 210973 T	15-01-2002			
			AU 2934199 A	18-10-1999			
			BR 9909313 A	21-11-2000			
			CN 1295470 T	16-05-2001			
			DE 59900581 D1	31-01-2002			
			WO 9949852 A1	07-10-1999			
			EP 1033978 A1	13-09-2000			
			HU 0101519 A2	28-09-2001			
			NO 20004915 A	08-11-2000			
			PL 343255 A1	30-07-2001			
			SK 14462000 A3	09-04-2001			
			TR 200002829 T2	22-01-2001			
			WO 9949844	A	07-10-1999	DE 19814083 A1	14-10-1999
AU 3597499 A	18-10-1999						
WO 9949844 A2	07-10-1999						
EP 1067916 A2	17-01-2001						
NO 20004926 A	22-11-2000						
WO 9013294	A	15-11-1990	AU 5439890 A	29-11-1990			
			EP 0483152 A1	06-05-1992			
			WO 9013294 A1	15-11-1990			
			US 5234945 A	10-08-1993			
WO 8912445	A	28-12-1989	US 4885308 A	05-12-1989			
			AU 628353 B2	17-09-1992			
			AU 3737789 A	12-01-1990			
			CA 1338508 A1	06-08-1996			
			EP 0420871 A1	10-04-1991			
			JP 2780834 B2	30-07-1998			
			JP 3504972 T	31-10-1991			
			KR 145557 B1	17-08-1998			
			WO 8912445 A1	28-12-1989			
			US 4996226 A	26-02-1991			
EP 230629	A	05-08-1987	US 4657925 A	14-04-1987			
			AU 601961 B2	27-09-1990			
			AU 6678286 A	25-06-1987			
			EP 0230629 A2	05-08-1987			
			EP 0389475 A1	03-10-1990			
			JP 62252719 A	04-11-1987			
			WO 8912949 A1	28-12-1989			
			US 4996226 A	26-02-1991			
			US 5268385 A	07-12-1993			
			US 4722933 A	02-02-1988			
			US 4743618 A	10-05-1988			
			US 5256661 A	26-10-1993			
			WO 0113903	A	01-03-2001	DE 19938823 A1	22-02-2001
						AU 6836500 A	19-03-2001

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 01/09595

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 0113903 A		WO 0113903 A2 US 2001053777 A1	01-03-2001 20-12-2001

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES IPK 7 A61K31/381 A61K9/00 A61K47/14		
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK		
B. RECHERCHIERTE GEBIETE Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole) IPK 7 A61K		
Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen		
Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe) WPI Data, PAJ, CHEM ABS Data		
C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	WO 97 29735 A (MONASH UNIVERSITY,AU) 21. August 1997 (1997-08-21) Ansprüche 1,5,10,11,21-31 Seite 26, Zeile 15 - Zeile 16 ---	1,16-23
A	WO 99 49852 A (LTS) 7. Oktober 1999 (1999-10-07) Ansprüche ---	1,16-23
A	WO 99 49844 A (LTS) 7. Oktober 1999 (1999-10-07) Ansprüche ---	1,16-23
A	WO 90 13294 A (WHITBY RESEARCH INC.,U.S.A.) 15. November 1990 (1990-11-15) Ansprüche 1,11-14,23-25 Seite 12, Zeile 5 -Seite 14, Zeile 10 --- -/--	1,16-23
<input checked="" type="checkbox"/> Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen		
<input checked="" type="checkbox"/> Siehe Anhang Patentfamilie		
<ul style="list-style-type: none"> * Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen : *A* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist *E* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist *L* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt) *O* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht *P* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist *T* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist *X* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden *Y* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist *Z* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist 		
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche 27. Februar 2002		Absendedatum des internationalen Recherchenberichts 08/03/2002
Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016		Bevollmächtigter Bediensteter Scarponi, U

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie°	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	WO 89 12445 A (NELSON RESEARCH & DEVELOPMENT CO., U.S.A.) 28. Dezember 1989 (1989-12-28) Ansprüche 1,10-14,23-27,36-39 ----	1,16-23
A	EP 0 230 629 A (NELSON RESEARCH & DEVELOPMENT CO., U.S.A.) 5. August 1987 (1987-08-05) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche -----	1,16-23
A,P	WO 01 13903 A (BOEHRINGRE INGELHEIM PHARMA KG,DE) 1. März 2001 (2001-03-01) Ansprüche 1,11,12,14,22-29 -----	1,16-23

INTERNATIONAL RESEARCH REPORT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 01/09595

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 9729735	A	21-08-1997	AU 706967 B2	01-07-1999
			AU 1713497 A	02-09-1997
			WO 9729735 A1	21-08-1997
			EP 0901368 A1	17-03-1999
			JP 2000504697 T	18-04-2000
			US 6299900 B1	09-10-2001
WO 9949852	A	07-10-1999	DE 19814084 A1	14-10-1999
			AT 210973 T	15-01-2002
			AU 2934199 A	18-10-1999
			BR 9909313 A	21-11-2000
			CN 1295470 T	16-05-2001
			DE 59900581 D1	31-01-2002
			WO 9949852 A1	07-10-1999
			EP 1033978 A1	13-09-2000
			HU 0101519 A2	28-09-2001
			NO 20004915 A	08-11-2000
			PL 343255 A1	30-07-2001
			SK 14462000 A3	09-04-2001
			TR 200002829 T2	22-01-2001
			WO 9949844	A
AU 3597499 A	18-10-1999			
WO 9949844 A2	07-10-1999			
EP 1067916 A2	17-01-2001			
NO 20004926 A	22-11-2000			
WO 9013294	A	15-11-1990	AU 5439890 A	29-11-1990
			EP 0483152 A1	06-05-1992
			WO 9013294 A1	15-11-1990
			US 5234945 A	10-08-1993
WO 8912445	A	28-12-1989	US 4885308 A	05-12-1989
			AU 628353 B2	17-09-1992
			AU 3737789 A	12-01-1990
			CA 1338508 A1	06-08-1996
			EP 0420871 A1	10-04-1991
			JP 2780834 B2	30-07-1998
			JP 3504972 T	31-10-1991
			KR 145557 B1	17-08-1998
			WO 8912445 A1	28-12-1989
			US 4996226 A	26-02-1991
EP 230629	A	05-08-1987	US 4657925 A	14-04-1987
			AU 601961 B2	27-09-1990
			AU 6678286 A	25-06-1987
			EP 0230629 A2	05-08-1987
			EP 0389475 A1	03-10-1990
			JP 62252719 A	04-11-1987
			WO 8912949 A1	28-12-1989
			US 4996226 A	26-02-1991
			US 5268385 A	07-12-1993
			US 4722933 A	02-02-1988
			US 4743618 A	10-05-1988
			US 5256661 A	26-10-1993
			WO 0113903	A
AU 6836500 A	19-03-2001			

INTERNATIONAL RESEARCH REPORT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 01/09595

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 0113903 A		WO 0113903 A2	01-03-2001
		US 2001053777 A1	20-12-2001
