

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

PATENTTI- JA REKISTERIHALLITUS
PATENT- OCH REGISTERSTYRELSEN
FINNISH PATENT AND REGISTRATION OFFICE

(10)

FI/EP3777842 T3

(12)

**EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION**

(45)

Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning -
Translation available to the public

11.02.2025

(97)

Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för
det europeiska patentet - Date of grant of European patent

11.12.2024

(51)

Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -
International patent classification
A61K 9/20 (2006 . 01)
A61K 31/4045 (2006 . 01)
A61P 25/20 (2006 . 01)

(96)

Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan -
European patent application

EP20195788.3

(22)

Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date

29.11.2016

(97)

Patenttihakemuksen julkiseksitulosopäivä - Patentansökans
publiceringsdag - Patent application available to the public

17.02.2021

(30)

Etuoikeus - Prioritet - Priority

31.10.2016 US US201662415014 P

(73)

Haltija - Innehavare - Holder

1• Neurim Pharmaceuticals Ltd., 27 HaBarzel Street, 6971039 Tel Aviv, (IL)

(72)

Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1• LAUDON, Moshe, c/o Neurim Pharmaceuticals Ltd. 27 HaBarzel Street, 6971039 Tel Aviv, (IL)

2• ZISAPEL, Nava, c/o Neurim Pharmaceuticals Ltd. 27 HaBarzel Street, 6971039 Tel Aviv, (IL)

(74)

Asiamies - Ombud - Agent

Berggren Oy, P.O. Box 16 Eteläinen Rautatiekatu 10 A, 00101 Helsinki, (FI)

(54)

Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

Melatoniniin minitabletteja ja menetelmä niiden valmistamiseksi

MELATONIN MINI-TABLETS AND METHOD OF MANUFACTURING THE SAME

Patenttivaatimukset

1. Melatoniinin minidepottabletti, joka käsittää:

- 1 mg:n, 2 mg, 3 mg, 4 mg, tai 5 mg melatoniinia; ja
farmaseuttisesti hyväksyttäviä kantaja-aineita, jotka sisältävät kalsiumvetyfos-
5 faattidihydraattia, ammoniometakrylaattikopolymeeriä ja laktoosimonohydraattia,
jolloin melatoniinin, ammoniometakrylaattikopolymeerin, kalsiumvetyfosfaattidihyd-
raatin ja laktoosimonohydraatin painoon perustuva suhde on 1 : 1,1–5,9 : 0,8–8,3 :
1,8–8,8; ja jossa minitabletilla on halkaisija, joka on pienempi tai yhtä kuin 4 mm.

- 10 2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen melatoniinin minidepottabletti, jossa ammo-
niometakrylaattikopolymeeri on tyyppin A ammoniometakrylaattikopolymeeri tai tyy-
pin B ammoniometakrylaattikopolymeeri.

3. Minkä tahansa patenttivaatimuksen 1–2 mukainen melatoniinin minidepottabletti,
jossa minitabletti lisäksi käsittää nopeasti liukenevan sokerin tai alkoholin, joka ei
15 ole laktoosi.

4. Minkä tahansa patenttivaatimuksen 1–3 mukainen melatoniinin minidepottabletti,
jossa minitabletti on päällystetty farmaseuttisesti hyväksyttävällä päällysteellä.

5. Patenttivaatimuksen 4 mukainen melatoniinin minidepottabletti, jossa farmaseut-
tisesti hyväksyttävä päällyste valitaan sokeripäällysteestä, kalvopäällysteestä, pu-
20 ristuspäällysteestä ja enteropäällysteestä.

6. Minkä tahansa patenttivaatimuksen 1–5 mukainen melatoniinin minidepottabletti,
jossa minitabletilla on vapautusprofiili, jossa vähemmän kuin 50 % melatoniinista
vapautuu 1 tunnissa, ja noin yli 70 % melatoniinista vapautuu 6 tunnissa.

7. Minkä tahansa patenttivaatimuksen 1–6 mukainen melatoniinin minidepottabletti,
25 jossa minitabletti on formuloitu siten, että se tuottaa vereen minimipitoisuuden, joka
on noin 60 – noin 200 pikogrammaa, edullisesti 100 – noin 200 pikogrammaa me-
latoniinia millilitraa kohden vähintään neljän tunnin ajaksi ihmispotilaan nautittua
melatoniinin minidepottabletin suun kautta.

8. Menetelmä melatoniinin minidepottabletin valmistamiseksi, jolloin menetelmä kä-
30 sittää:

melatoniinin ja farmaseuttisesti hyväksyttävien kantaja-aineiden yhdistämisen
seoksen valmistamiseksi; ja

seoksen puristamisen minitabletiksi, jonka halkaisija on pienempi tai yhtä kuin 4 mm,

jossa farmaseuttisesti hyväksyttävät kantaja-aineet käsittävät kalsiumvetyfosfaattidihydraatin, ammoniometakrylaattikopolymeerin ja laktoosimonohydraatin, ja

- 5 jossa melatoniinin, ammoniometakrylaattikopolymeerin, kalsiumvetyfosfaattidihydraatin ja laktoosimonohydraatin painoon perustuva suhde on 1 : 1,1–5,9 : 0,8–8,3 : 1,8–8,8; jolloin minitabletti käsittää 1 mg:n, 2 mg, 3 mg, 4 mg tai 5 mg melatoniinia.

9. Patenttivaatimuksen 8 mukainen menetelmä, joka lisäksi käsittää vaiheen, jossa
10 tabletit päällystetään farmaseuttisesti hyväksyttävällä päällysteellä.

10. Patenttivaatimuksen 9 mukainen menetelmä, jossa farmaseuttisesti hyväksyttävä päällyste valitaan sokeripäällysteestä, kalvopäällysteestä, puristus-
päällysteestä ja enteropäällysteestä.

11. Minkä tahansa patenttivaatimuksen 8–10 mukainen menetelmä, jossa minitab-
15 letti lisäksi käsittää nopeasti liukenevan sokerin tai alkoholin, joka ei ole laktoosi.

12. Minkä tahansa patenttivaatimuksen 8–11 mukainen menetelmä, jossa ammoniometakrylaattikopolymeeri on tyyppin A ammoniometakrylaattikopolymeeri tai tyyppin B ammoniometakrylaattikopolymeeri.

13. Minkä tahansa patenttivaatimuksen 1–7 mukainen melatoniinin minidepottabletti
20 käytettäväksi menetelmässä unen indusoimiseksi sen tarpeessa olevassa ihmiskohteessa, jolloin menetelmä käsittää melatoniinin minidepottabletin antamisen suun kautta ihmiskohteeseen.

14. Melatoniinin minidepottabletti käytettäväksi patenttivaatimuksen 13 mukaisesti, jossa ihmiskohde on lapsipotilas; vanhuspotilas; vammaisen potilas; potilas, jolla on
25 autismikirjon häiriö; potilas, jolla on neurogeneettinen sairaus; tai potilas, jolla on diagnosoitu dysfagia.

15. Melatoniinin minidepottabletti käytettäväksi patenttivaatimuksen 13 tai patenttivaatimuksen 14 mukaisesti, jossa ihmiskohteella on autismikirjon häiriö.