(19) SUOMI - FINLAND
(FI)

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

(10) **FI/EP3263106 T3**

(12) **EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS**
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION

(45) Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning - Translation available to the public **03.01.2024**

(97) Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för det europeiska patentet - Date of grant of European patent **25.10.2023**

(51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering - International patent classification
A61K 9/10 (2006 . 01)
A61K 47/02 (2006 . 01)
A61K 31/47 (2006 . 01)
A61P 35/00 (2006 . 01)
A61P 43/00 (2006 . 01)

(96) Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan - European patent application EP16755489.8

(22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date **23.02.2016**

(97) Patenttihakemuksen julkiseksitulopäivä - Patentansökans publiceringsdag - Patent application available to the public **03.01.2018**

(86) Kansainvälinen hakemus - Internationell ansökan - International application **23.02.2016 PCT/JP2016055268**

(30) Etuoikeus - Prioritet - Priority

25.02.2015 US US201562120561 P

(73) Haltija - Innehavare - Holder

1• Eisai R&D Management Co., Ltd. , 4-6-10 Koishikawa Bunkyo-ku , Tokyo 112-8088 , (JP)

(72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1• NAGANE, Kentaro , c/o Eisai Co. Ltd. Kawashima Industrial Complex 1 Kawashimatakehaya-machi , Kakamigahara-shi Gifu 501-6024 , (JP)
2• UEKI, Yosuke , c/o Eisai Co. Ltd. Kawashima Industrial Complex 1 Kawashimatakehaya-machi , Kakamigahara-shi Gifu 501-6024 , (JP)
3• SANO, Shusuke , c/o Eisai Co. Ltd. Kawashima Industrial Complex 1 Kawashimatakehaya-machi , Kakamigahara-shi Gifu 501-6024 , (JP)
4• SAKAGUCHI, Takahisa , c/o Eisai Co. Ltd. Tsukuba Research Laboratories 5-1-3 Tokodai , Tsukuba-shi Ibaraki 300-2635 , (JP)

(74) Asiamies - Ombud - Agent

Papula Oy , P.O.Box 981 , 00101 Helsinki , (FI)

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

MENETELMÄ KINOLIINIJOHDANNAISEN KITKERYYDEN TUKAHDUTTAMISEKSI

METHOD FOR SUPPRESSING BITTERNESS OF QUINOLINE DERIVATIVE

PATENTTIVAATIMUKSET

1. Sellaisen emäksisen aineen käyttö, joka valitaan emäksisestä oksidista, emäksisestä karbonaatista tai emäksisestä hydroksidista, edullisesti kalsiumkarbonaatista tai magnesiumoksidista ja edullisemmin kalsiumkarbonaatista, 4-(3-kloori-4-(syklopropyyliaminokarbonyyli)aminofenoksi)-7-metoksi-6-kinoliinikarboksiamidin tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävän suolan, edullisesti sen mesylaatin, kitkeryyden tukahduttamiseksi, jolloin edullisesti 0,01-50 paino-osaa mainittua emäksistä ainetta sekoitetaan yhtä paino-osaa kohti 4-(3-kloori-4-(syklopropyyliaminokarbonyyli)aminofenoksi)-7-metoksi-6-kinoliinikarboksiamidia tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävää suolaa tai 0,16-80 moolia mainittua emäksistä ainetta sekoitetaan yhtä moolia kohti 4-(3-kloori-4-(syklopropyyliaminokarbonyyli)aminofenoksi)-7-metoksi-6-kinoliinikarboksiamidia tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävää suolaa.

2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen käyttö 4-(3-kloori4-(syklopropyyliaminokarbonyyli)aminofenoksi)-7-metoksi-6-kinoliinikarboksiamidin tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävän suolan kitkeryyden tukahduttamiseksi farmaseuttisessa koostumuksessa, joka käsittää 4-(3-kloori-4-(syklopropyyliaminokarbonyyli)aminofenoksi)-7-metoksi-6-kinoliinikarboksiamidia tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävää suolaa, edullisesti sen mesylaattia, ja 0,01-50 paino-osaa mainittua emäksistä ainetta yhtä paino-osaa kohti 4-(3-kloori-4-(syklopropyyliaminokarbonyyli)aminofenoksi)-7-metoksi-6-kinoliinikarboksiamidia tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävää suolaa, edullisesti 0,16-80 moolia mainittua emäksistä ainetta yhtä moolia kohti 4-(3-kloori-4-(syklopropyyliaminokarbonyyli)aminofenoksi)-7-metoksi-6-kinoliinikarboksiamidia tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävää suolaa.

3. Patenttivaatimuksen 2 mukainen käyttö, jolloin farmaseuttinen koostumus on sellaisessa annosmuodossa, joka on suussa hajoava tabletti, pureskeltava valmiste, poretabletti, dispergoituva tabletti, liukoinen tabletti, siirappi, valmiste siirappia varten, pastilli tai oraalinen nestemäinen valmiste ja se on edullisesti valmiste, joka voidaan saattaa suspensioksi vesipitoiseen liuottimeen tätä koostumusta annettaessa suspension muodostamiseksi.

4. Jonkin patenttivaatimuksista 1–3 mukainen käyttö, jolloin emäksinen aine on kalsiumkarbonaatti tai magnesiumoksidi.

5. Jonkin patenttivaatimuksista 1–3 mukainen käyttö, jolloin emäksinen aine on kalsiumkarbonaatti.

6. Suspensio, joka käsittää 4-(3-kloori-4-(syklopropyyliaminokarbonyyli)aminofenoksi)-7-metoksi-6-kinoliinikarboksiamidia tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävää suolaa sekä emäksistä ainetta, käytettäväksi menetelmässä syövän hoitamiseksi, jolloin menetelmä käsittää seuraavat:

1) suspendoidaan farmaseuttinen koostumus, joka käsittää 1–24 mg 4-(3-kloori-4-(syklopropyyliaminokarbonyyli)aminofenoksi)-7-metoksi-6-kinoliinikarboksiamidia tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävää suolaa, edullisesti sen mesylaattia, ja mainittua emäksistä ainetta, joka valitaan emäksisestä oksidista, emäksisestä karbonaatista tai emäksisestä hydroksidista, edullisesti kalsiumkarbonaatista tai magnesiumoksidista ja edullisemmin kalsiumkarbonaatista, astiassa olevaan vesipitoiseen liuottimeen;

2) annetaan kohdassa 1) saatua suspensiota potilaalle astiasta;

3) huuhdellaan astia vesipitoisella liuottimella; ja

4) annetaan kohdassa 3) saatu huuhteluliuos potilaalle.

7. Suspensio käytettäväksi patenttivaatimuksen 6 mukaisesti, jolloin kohta 1) käsittää seuraavat: i) kaadetaan vesipitoinen liuotin astiaan, ii) annetaan astian seistä; ja iii) ravistetaan astiaa.

8. Suspensio käytettäväksi patenttivaatimuksen 6 tai 7 mukaisesti, jolloin farmaseuttinen koostumus suspendoidaan 1–10 ml:aan vesipitoista liuotinta kohdassa 1).

9. Suspensio käytettäväksi patenttivaatimuksen 8 mukaisesti, jolloin farmaseuttinen koostumus suspendoidaan noin 3 ml:aan vesipitoista liuotinta kohdassa 1).

10. Suspensio käytettäväksi patenttivaatimuksen 6 mukaisesti, jolloin astia huuhdellaan 1–10 ml:lla mainittua vesipitoista liuotinta kohdassa 3).

11. Suspensio käytettäväksi patenttivaatimuksen 10 mukaisesti, jolloin astia huuhdellaan noin 2 ml:lla mainittua vesipitoista liuotinta kohdassa 3).

12. Suspensio käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksista 6–11 mukaisesti, jolloin emäksinen aine on kalsiumkarbonaatti tai magnesiumoksidi.

13. Suspensio käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksista 6–11 mukaisesti, jolloin emäksinen aine on kalsiumkarbonaatti.