

(19)



REPUBLIKA SLOVENIJA
Urad RS za intelektualno lastnino

(10) **SI 9800128 B**

(12)

PATENT S SPREMENJENIMI ZAHTEVKI *

* V tem dokumentu so objavljeni spremenjeni zahtevki patenta **9800128 A**.
Zahtevki so bili spremenjeni na podlagi ugotovitevne odločbe, izdane po drugi točki 73. člena Zakona o industrijski lastnini.

(21) Številka prijave: **9800128**

(51) MPK⁶: **A61K 9/36**, A61K 9/62,
A61K 47/38, C07C 217/48

(22) Datum prijave: **29.04.1998**

(46) Datum objave spremenjenih zahtevkov:
30.04.2000

(30) Prednostna pravica:
29.05.1997 US 08/867196

(45) Datum objave patenta (9800128 A):
28.02.1999

(72) Izumitelji: **Anderson Neil Robert, West Lafajette, Indiana 47906, US;**
Harrison Roger Garrick, Zionsville, Indiana 46077, US;
Lynch Daniel Frederick, Indianapolis, Indiana 46236, US;
Oren Peter Lloyd, Fishers, Indiana 46038, US

(73) Nosilec: **ELI LILLY AND COMPANY**
Lilly Corporate Center, Indianapolis, Indiana 46285, US

(74) Zastopnik: **Antonija Flak, dipl.ing.el., Rojčeva 18, 1110 Ljubljana, SI**

(54) **ENTERIČNA ZRNCA FLUOKSETINA**

SI 9800128 B

Patentni zahtevki

1. Enterično zrnce fluoksetina, označeno s tem, da je sestavljeno iz a) jedra, ki vsebuje fluoksetin in enega ali več farmacevtsko sprejemljivih ekscipiensov; b) opsijske ločilne plasti, ki vsebuje nereducirajoči sladkor ter enega ali več farmacevtsko sprejemljivih ekscipiensov; c) enterične plasti, ki vsebuje acetatni sukcinat hidroksipropilmetilceluloze (HPMCAS) in enega ali več farmacevtsko sprejemljivih ekscipiensov; in d) opsijske zaključne plasti.
2. Zrnce po zahtevku 1, označeno s tem, da vsebujejo ločilno plast.
3. Zrnce po zahtevku 2, označeno s tem, da ločilna plast vsebuje farmacevtsko sprejemljivi sladkor.
4. Zrnce po zahtevku 3, označeno s tem, da je sladkor saharoza.
5. Zrnce po kateremkoli od zahtevkov 1 do 4, označeno s tem, da je povprečna velikost delcev fluoksetina okrog 50 μm ali manj.
6. Zrnce po kateremkoli od zahtevkov 1 do 5, označeno s tem, da njegovo jedro predstavlja inertno jedro, na katero je nanešen fluoksetin v sloju, ki ga sestavlja še farmacevtsko sprejemljivi ekscipiens.
7. Zrnce po kateremkoli od zahtevkov 1 do 6, označeno s tem, da je v njem HPMCAS delno nevtralizirana do take stopnje, da je od 0% do okrog 15% sukcinilnih skupin nevtraliziranih.
8. Zrnce po zahtevku 7, označeno s tem, da je v njem HPMCAS nevtralizirana z amoniakom.
9. Pripravek, označen s tem, da je sestavljen iz različnih enteričnih fluoksetinskih zrn po kateremkoli od zahtevkov 1 do 8.
10. Pripravek po zahtevku 9, označen s tem, da vsebuje 20-100 mg fluoksetina (ekvivalent baze).
11. Pripravek po zahtevku 9, označen s tem, da vsebuje okrog 80-90 mg fluoksetina (ekvivalent baze).
12. Pripravek po zahtevku 9, označen s tem, da vsebuje okrog 90 mg fluoksetina (ekvivalent baze).
13. Pripravek po kateremkoli od zahtevkov 9 do 13, označen s tem, da je v njem fluoksetin prisoten v obliki fluoksetin hidroklorida.
14. Pripravek po kateremkoli od zahtevkov 9 do 13, označen s tem, da je v njem še dodatno prisoten pindolol.
15. Pripravek po zahtevku 9, označen s tem, da vsebuje:

Jedra

saharoza - "starch nonpareils", 30-35 mesh 100-150 mg

Fluoksetinska plast

fluoksetin hidroklorid 100,5-100,8 mg

saharoza 20-30 mg

hidroksipropilmetilceluloza 10-15 mg

Ločilna plast

hidroksipropilmetilceluloza 4-12 mg

saharoza 15-35 mg

TALK, 500 mesh 25-60 mg

Enterična plast

HPMCAS-LF 60-90 mg

trietil citrat 10-20 mg

talk, 500 mesh 15-25 mg

Zaključna plast

bela barvna mešanica (HPMC + titanov dioksid) 35-55 mg

HPMC 5-15 mg

talk v sledovih

16. Kapsule iz želatine, označene s tem, da vsebujejo pripravek po kateremkoli od zahtevkov 9 do 15.
17. Pripravke po kateremkoli od zahtevkov 9 do 15, označene s tem, da z njimi zdravimo paciente, ki trpijo zaradi depresije, obsesivno-kompulzivne motnje, bulimije, bolečine, obsesivno-kompulzivnih osebnostnih motenj, motenj zaradi post travmatičnega stresa, hipertenzije, ateroskleroze, anksioznosti, anorexie nervose, panične reakcije, socialne fobije, jecljanja, motenj spanja, kronične utrujenosti, Alzheimerjeve bolezni, odvisnosti od alkohola, motenj apetita, izgube teže, agorafobije, izboljšanja spomina, amnezije, prenehanja kajenja, simptomov zaradi sindroma odvzeta nikotina, motenj razpoloženja in/ali apetita, ki so vezane na predmenstrualni sindrom, depresivno razpoloženje in/ali požrešnost na ogljikove hidrate, povezana s pred-menstrualnim sindromom, motenj razpoloženja, motenj apetita ali motenj, ki prispevajo k recidivom, ki so povezane z odvzetjem nikotina, motenj cirkardialnega ritma, mejnih osebnostnih motenj, hipohondrije, predmenstrualnega sindroma (PMS), disforične motnje v pozni lutealni fazi, predmenstrualne disforične motnje, trihotilomanije, simptomov, ki so posledica diskontinuitete jemanja drugih antidepresivov,

agresivne/prekinjene eksplozivne motnje, kompulzivnega igranja na srečo, kompulzivnega zapravljanja, kompulzivne spolnosti, motenj zaradi uporabe psihoaktivnih snovi, spolnih motenj, shizofrenije, prezgodnje ejakulacije ali psihiatričnih simptomov, ki izvirajo iz stresa, skrbi, jeze, občutljivosti na zavračanje in pomanjkanja duševne ali telesne energije.

18. Postopek za pripravo enteričnega zrnca fluoksetina, označen s tem, da vključuje: a) izdelavo jedra, ki vsebuje fluoksetin in enega ali več farmacevtsko sprejemljivih ekscipiensov; b) nanašanje na jedro ločilne plasti, ki vsebuje nereducirajoči sladkor in enega ali več farmacevtsko sprejemljivih ekscipiensov (opcija); c) nanašanje enterične plasti, ki vsebuje HPMCAS in enega ali več farmacevtsko sprejemljivih ekscipiensov, pri čemer je v tej plasti HPMCAS uporabljena v obliki vodne raztopine ali suspenzije, nanašanje pa poteka v napravi s tekočim ležiščem; in d) opsijsko, nanašanje zaključne plasti.
19. Postopek po zahtevku 18, označen s tem, da je v njem uporabljena HPMCAS popolnoma ali delno nevtralizirana.
20. Postopek po zahtevku 18, označen s tem, da je v njem uporabljena HPMCAS nevtralizirana do take stopnje, da je v njej od okrog 25% do okrog 100% skupin sukcinilne kisline nevtraliziranih.
21. Postopek po zahtevku 18 ali 20, označen s tem, da je v njem uporabljena HPMCAS nevtralizirana z amoniakom ali amonijevim hidroksidom.
22. Postopek po kateremkoli zahtevku 18 do 21, označen s tem, da so pri njem jedra pripravljena z nanašanjem fluoksetina in enega ali več farmacevtsko sprejemljivih ekscipiensov na inertno jedro.
23. Postopek po kateremkoli zahtevku 18 do 22, označen s tem, da se pri njem uporablja ločilna plast.
24. Postopek po zahtevku 23, označen s tem, da je pri njem uporabljena ločilna plast sestavljena iz farmacevtsko sprejemljivega sladkorja.
25. Postopek po zahtevku 24, označen s tem, da je sladkor saharoza.

ZA:

ELI LILLY AND COMPANY, US

