



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20161357 T1

HR P20161357 T1

(12) **PRIJEVOD PATENTNIH ZAHTJEVA
EUROPSKOG PATENTA**

(51) MKP:

A61K 9/16 (2006.01)
A61K 9/19 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 02.12.2016.

(21) Broj predmeta: P20161357T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 18.10.2016.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/JP2012065180
Datum podnošenja međunarodne prijave: 07.06.2012.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 12731189.2
Datum podnošenja europske prijave patenta: 07.06.2012.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2012169662
Datum međunarodne objave: 13.12.2012.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2717859 A1
Datum objave europske prijave patenta: 16.04.2014.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2717859 B1
Datum objave europskog patenta: 31.08.2016.

(31) Broj prve prijave: 201161494088 P

(32) Datum podnošenja prve prijave:

07.06.2011.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelj patenta:

**Otsuka Pharmaceutical Co., Ltd., 9, Kanda-Tsukasa-machi 2-chome,
Chiyoda-ku, 101-8535 Tokyo, JP**

(72) Izumitelj:

**Shogo Hiraoka, c/o Otsuka Pharmaceutical Co. Ltd., 1-7-1 Doshomachi,
Chuo-ku, Osaka-shi, 541-0045 Osaka, JP**

(74) Zastupnik:

PRODUCTA d.o.o., 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma:

ZAMRZAVANJEM OSUŠENA FORMULACIJA ARIPIPAZOLA

HR P20161357 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

- 5 1. Zamrzavanjem osušena formulacija aripiprazola naznačena time da se dobiva postupkom koji sadrži korake smrzavanja raspršivanjem suspenzije aripiprazola koja sadrži
(I) aripiprazol,
(II) nosač za aripiprazol, te
(III) vodu za injekciju; i
- 10 sušenje raspršivanjem smrznutih čestica.
2. Zamrzavanjem osušena formulacija prema zahtjevu 1, naznačena time da se sastoji uglavnom od čestica s veličinom čestica uglavnom od 30 μm ili više.
3. Zamrzavanjem osušena formulacija prema zahtjevu 1, naznačena time da sadrži aripiprazol u količini od 50 w/w% ili više.
- 15 4. Zamrzavanjem osušena formulacija prema zahtjevu 1, naznačena time da ima nasipnu gustoću od oko 0.05 do oko 0.5 g/mL.
5. Zamrzavanjem osušena formulacija prema zahtjevu 1 naznačena time da aripiprazol ima srednju veličinu čestica od oko 1 do oko 10 mikrona.
6. Zamrzavanjem osušena formulacija prema zahtjevu 5 naznačena time da aripiprazol ima srednju veličinu čestica od oko 2.5 mikrona.
- 20 7. Zamrzavanjem osušena formulacija prema zahtjevu 1, naznačena time da sadrži barem jednu komponentu koja je odabrana iz skupine koju čine suspenzijska sredstva, sredstva za punjenje, te puferi.
8. Zamrzavanjem osušena formulacija prema zahtjevu 1, naznačena time da sadrži
(II-a) jedno ili više suspenzijskih sredstava,
(II-b) jedno ili više sredstava za punjenje, i
(II-c) jedan ili više pufera.
- 25 9. Zamrzavanjem osušena formulacija prema zahtjevu 1, naznačena time da sadrži
(II-a) karboksimetil celulozu ili njezinu sol,
(II-b) manitol, i
(II-c) natrijev fosfat.
- 30 10. Zamrzavanjem osušena formulacija prema zahtjevu 1, naznačena time da dodatno sadrži (IV) sredstvo za podešavanje pH.
11. Zamrzavanjem osušena formulacija prema zahtjevu 10, naznačena time da sredstvo za podešavanje pH natrijev hidroksid.
- 35 12. Zamrzavanjem osušena formulacija prema zahtjevu 1, naznačena time da sadrži:
(I) aripiprazol,
(II-a) karboksimetil celulozu ili njezinu natrijevu sol,
(II-b) manitol,
(II-c) natrijev fosfat, te proizvoljno
(IV) natrijev hidroksid.
- 40 13. Zamrzavanjem osušena formulacija prema zahtjevu 1, naznačena time da je aripiprazol u obliku monohidrata.
14. Postupak za proizvodnju zamrzavanjem osušene formulacije aripiprazola naznačen time da sadrži korake
(e'-1) zamrzavanje raspršivanjem suspenzije aripiprazola koja ima srednju veličinu čestica u rasponu od oko 1 do oko 10 mikrona da se dobiju čestice zamrznute raspršivanjem; i
(e'-2) sušenje raspršivanjem zamrznutih čestica da se dobiju osušene čestice zamrznute raspršivanjem.
- 45 15. Postupak za proizvodnju zamrzavanjem osušene formulacije aripiprazola prema zahtjevu 14, naznačen time da sadrži korake
(d') smanjivanje srednje veličine čestica aripiprazola u primarnoj suspenziji nastaloj miješanjem aripiprazola, nosača za aripiprazol, te vode u raspon od oko 1 do oko 10 mikrona da se dobije konačna suspenzija;
(e'-1) zamrzavanje raspršivanjem suspenzije aripiprazola koja ima srednju veličinu čestica od oko 1 do oko 10 mikrona da se dobiju čestice zamrznute raspršivanjem; i
(e'-2) sušenje čestica zamrznutih raspršivanjem da se dobiju raspršivanjem zamrznute osušene čestice.
- 50 16. Postupak prema zahtjevu 15, naznačen time da se smanjenje srednje veličine čestica aripiprazola u sterilnoj primarnoj suspenziji provodi postupkom vlažnog mljevenja.
- 55 17. Postupak prema zahtjevu 14, naznačen time da raspršivanje u koraku (e'-1) je ili raspršivanje kod niske temperature radi smrzavanja ili raspršivanje pod sniženim tlakom radi smrzavanja.
18. Postupak prema zahtjevu 14, naznačen time da dodatno sadrži odabir čestica s veličinom čestica od uglavnom 30 μm ili više.
19. Zamrzavanjem osušena formulacija prema zahtjevu 1, naznačena time da iskazuje dobru disperzibilnost i da nakon razrjeđenja s vodom tvori homogenu suspenziju aripiprazola.
- 60 20. Zamrzavanjem osušena formulacija prema zahtjevu 1, naznačena time da sadrži čestice s veličinom čestice manjom od 75 μm u količini od 15 w/w% ili manje.