

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

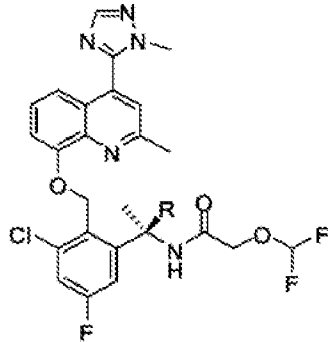
PATENTTI- JA REKISTERIHALLITUS
PATENT- OCH REGISTERSTYRELSEN
FINNISH PATENT AND REGISTRATION OFFICE

(10) **FI/EP4203919 T3**
(12) **EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS**
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION

- (45) Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning - Translation available to the public **03.05.2024**
- (97) Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för det europeiska patentet - Date of grant of European patent **31.01.2024**
- (51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering - International patent classification
A61K 9/107 (2006 . 01)
A61K 9/48 (2006 . 01)
A61K 31/4709 (2006 . 01)
A61P 7/10 (2006 . 01)
- (96) Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan - European patent application EP22760986.4
- (22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date **05.08.2022**
- (97) Patentihakemuksen julkiseksitulospäivä - Patentansökans publiceringsdag - Patent application available to the public **05.07.2023**
- (86) Kansainvälinen hakemus - Internationell ansökan - International application **05.08.2022 PCT/EP2022072049**
- (30) Etuoikeus - Prioritet - Priority
05.08.2021 EP EP21189990
- (73) Haltija - Innehavare - Holder
1 • Pharvaris GmbH, Grafenauweg 8, 6300 Zug, (CH)
- (72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor
1 • GIBSON, Christoph, 6300 Zug, (CH)
- (74) Asiamies - Ombud - Agent
Papula Oy, P.O.Box 981, 00101 Helsinki, (FI)
- (54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention
LIPIDIPOHJAINEN KOOSTUMUS BRADYKINIINI B2-RESEPTORIN ANTAGONISTIEN ORAALISTA ANTOTAPAA VARTEN
LIPID-BASED COMPOSITION FOR ORAL ADMINISTRATION OF BRADYKININ B2-RECEPTOR ANTAGONISTS

PATENTTIVAATIMUKSET

1. Nestemäinen farmaseuttinen koostumus oraalista antotapaa varten, joka koostumus käsittää bradykiniini (BK) B2-reseptorin antagonistin, jonka kemiallinen rakenne on kaavan 1 mukainen, tai sen stereoisomeerin, suolan tai solvaatin:



[Kaava 1]

- 10 jossa R on deuterium tai vety;
 jossa BK B2-reseptorin antagonistin liuotetaan nestemäiseen kantaja-aineeseen, joka käsittää propyleeniglykolimonokaprylaattia, polyoksyylirisiiniöljyä ja propyleeniglykolia.
- 15 2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen nestemäinen farmaseuttinen koostumus, jossa BK B2-reseptorin antagonistin on kaavan 1 mukainen yhdiste tai sen suola tai solvaatti, jossa R on deuterium.
- 20 3. Patenttivaatimuksen 1 tai 2 mukainen nestemäinen farmaseuttinen koostumus, jossa propyleeniglykolimonokaprylaatin määrä nestemäisessä kantaja-aineessa on 40-60 painoprosenttia perustuen nestemäisen kantaja-aineen painoon.
- 25 4. Jonkin edellä olevista patenttivaatimuksista mukainen nestemäinen farmaseuttinen koostumus, jossa polyoksyylirisiiniöljyn määrä nestemäisessä kantaja-aineessa on 30-50 painoprosenttia perustuen nestemäisen kantaja-aineen painoon.

5. Jonkin edellä olevista patenttivaatimuksista mukainen nestemäinen farmaseuttinen koostumus, jossa propyleeniglykolin määrä on 2,5-15 painoprosenttia perustuen nestemäisen kantaja-aineen painoon.

6. Jonkin edellä olevista patenttivaatimuksista mukainen nestemäinen farmaseuttinen koostumus, jossa propyleeniglykolimonokaprylaatti on propyleeniglykolimonokaprylaatti tyyppi II (USP/NF).

7. Jonkin edellä olevista patenttivaatimuksista mukainen nestemäinen farmaseuttinen koostumus, jossa polyoksyylirisiiniöljy on polyoksyyli-40-hydrattu risiiniöljy (USP/NF).

8. Jonkin edellä olevista patenttivaatimuksista mukainen nestemäinen farmaseuttinen koostumus, jossa propyleeniglykolimonokaprylaatin pitoisuus on 50 painoprosenttia, polyoksyylirisiiniöljyn pitoisuus on 40 painoprosenttia ja propyleeniglykolin pitoisuus on 10 painoprosenttia perustuen propyleeniglykolimonokaprylaatin, polyoksyylirisiiniöljyn ja propyleeniglykolin yhteenlaskettuun painoon nestemäisessä kantaja-aineessa.

9. Jonkin edellä olevista patenttivaatimuksista mukainen nestemäinen farmaseuttinen koostumus, jossa BK B2-reseptorin antagonistin pitoisuus on välillä 5 mg - 100 mg per yksi gramma, kuten 5 mg - 65 mg per yksi gramma tai kuten 20 mg - 70 mg per yksi gramma nestemäistä farmaseuttista koostumusta.

10. Jonkin edellä olevista patenttivaatimuksista mukainen nestemäinen farmaseuttinen koostumus, joka koostuu pääosin seuraavista:

(a) perustuen nestemäisen farmaseuttisen koostumuksen kokonaispainoon, 0,5-6,5 painoprosenttia, kuten 5 painoprosenttia, kaavan 1 mukaista yhdistettä tai sen stereoisomeeriä, suolaa tai solvaattia, jossa R on deuterium;

(b) perustuen nestemäisen farmaseuttisen koostumuksen kokonaispainoon, 93,5-99,5 painoprosenttia nestemäistä kantaja-ainetta, jolloin mainittu nestemäinen kantaja-aine koostuu pääosin seuraavista:

(i) 50 osaa (painona) propyleeniglykolimonokaprylaattia, kuten propyleeniglykolimonokaprylaattia tyyppiä II (USP/NF);

(ii) 40 osaa (painona) polyoksyylirisiiniöljyä, kuten 40-hydrattua risiiniöljyä (USP/NF);

(iii) 5-10 osaa (painona) propyleeniglykolia; ja valinnaisesti

(iv) enintään 5 osaa (painona) vettä; ja valinnaisesti

(c) loppuosana on yksi tai useampi muu apuaine, joka on liuotettu tai dispergoitu nestemäiseen kantaja-aineeseen.

11. Kapseli oraalista antotapaa varten, joka kapseli käsittää jonkin edellä olevista patenttivaatimuksista mukaisen nestemäisen farmaseuttisen koostumuksen.

12. Patenttivaatimuksen 11 mukainen kapseli, jossa kapseli on pehmeä kapseli.

13. Patenttivaatimuksen 12 mukainen pehmeä kapseli, joka käsittää kapselin seinämän, joka käsittää liivatetta, vettä ja vähintään yhtä pehennysainetta, joka valitaan propyleeniglykolista, glyserolista, sorbitolista, sorbitaanista, sorbitolipohjaisista pehmitinseoksista tai mistä tahansa näiden yhdistelmistä.

14. Jonkin patenttivaatimuksista 1-10 mukainen nestemäinen farmaseuttinen koostumus tai

jonkin patenttivaatimuksista 11-13 mukainen kapseli
käytettäväksi BK B2-reseptorin modulaation
aiheuttamasta reaktiosta johtuvasta sairaudesta tai
tilasta kärsivän henkilön akuutissa tai kroonisessa
5 hoidossa.

15. Nestemäinen farmaseuttinen koostumus
käytettäväksi patenttivaatimuksen 14 mukaisesti tai
kapseli käytettäväksi patenttivaatimuksen 14
mukaisesti, jossa BK B2-reseptorin modulaation
10 aiheuttamasta reaktiosta johtuva sairaus tai tila on
edeema, kuten perinnöllinen angioedeema.