



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20171652 T1



HR P20171652 T1

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

(51) MKP:

A61K 41/00 (2006.01)

A61K 51/04 (2006.01)

A61P 35/00 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 15.12.2017.

(21) Broj predmeta: P20171652T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 30.10.2017.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2013074490
Datum podnošenja međunarodne prijave: 22.11.2013.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 13801495.6
Datum podnošenja europske prijave patenta: 22.11.2013.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2014079977
Datum međunarodne objave: 30.05.2014.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2922571 A1
Datum objave europske prijave patenta: 30.09.2015.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2922571 B1
Datum objave europskog patenta: 06.09.2017.

(31) Broj prve prijave: 201221125

(32) Datum podnošenja prve prijave: 23.11.2012.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: GB

(73) Nositelj patenta:

MorEx Development Partners LLP, 63 St. James's Street, London SW1A 1LY, GB

(72) Izumitelji:

Chris Beattie, 1 The Courtyard, Moor Park House Way, Farnham Surrey GU10 1FE, GB
James Rennie, Yockley Garden House, Yockley Close, Camberley, Surrey GU15 1QQ, GB
Anne Wadsworth, 6 Priest Avenue, Workingham, Berkshire RG40 2LX, GB

(74) Zastupnik:

Odvjetnica Danija Budimir, 10000 Zagreb, HR

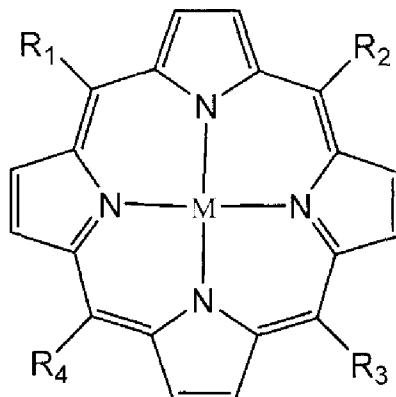
(54) Naziv izuma:

FARMACEUTSKE FORMULACIJE S METALOPORFIRINIMA KOJI SADRŽE KARBORAN

HR P20171652 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

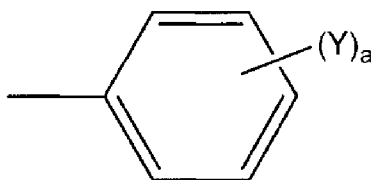
1. Farmaceutski pripravak koji sadrži:
spoj formule (1):



(1)

pri čemu:

R^1 , R^2 , R^3 , i R^4 su odabrani iz skupine koja privlači elektrone, $-\text{NO}_2$, $-\text{NH}_2$, halogena, i supstituenta predstavljenog slijedećom formulom



(2);

gdje Y može biti na orto, meta ili para položaju na fenilnim prstenovima, a odabrani je između vodika, hidrokarbila, nearomatskog karbociklila, nearomatskog heterociklila, aril, alkilaril, arilakil; ili ugljikovodične, nearomatske karbociklil, nearomatske heterociklil, aril, alkilaril, ili arilalkil skupine supstituirane s 1 do 4 hirofilne skupine odabrane iz hidroksi, alkoksi, $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^5$, $-\text{SOR}^6$, $-\text{SO}_2\text{R}^6$, nitro, amido, ureido, karbamato, $-\text{SR}^7$, $-\text{NR}^8\text{R}^9$, ili poli-alkilenoksid; ili supstituent predstavljen formulom (3)

$-\text{X}(\text{CR}^{10}\text{R}^{11})_r-\text{Z}$ (3);

ukoliko je najmanje jedan od R^1 , R^2 , R^3 , i R^4 supstituent predstavljen formulom (2) gdje Y predstavlja formula (3); gdje:

X je odabran između kisika i sumpora;

R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , i R^{11} su odabrani iz vodika i C_1 do C_4 hidrokarbila;

Z je karbaboranski skup koji sadrži barem dva ugljikova atoma i barem tri atoma borona, ili barem jedan atom ugljika i barem pet atoma borona, unutar strukture kaveza;

r je 0 ili cijeli broj od 1 do 20;

predstavlja cijeli broj od 1 do 4; i

pod uvjetom da najmanje jedan od R^1 , R^2 , R^3 , i R^4 je skupina koja privlači elektron, $-\text{NO}_2$, $-\text{NH}_2$, ili halogen; i

M se bira između dva vodikova iona, jednog monovalentnog iona metala, dva monovalentna iona metala, dvovalentnog iona metala, trovalentnog iona metala, tetravalentnog iona metala, pentavalentnog iona metala, i heksavalentnog iona metala, pri čemu porfirin metalni kompleks, izveden iz jednog monovalentnog iona metala uravnotežen je nabojem protutijela a kompleks porfirin metala izveden iz trovalentnog, tetravalentnog, pentavalentnog, ili heksavalentnog iona metala je uravnotežen s odgovarajućim brojem protu aniona, dianiona, ili trianiona;

pomoćno sredstvo sadrži:

55-90% (v/v) dimetilacetamida kao otapala; i

10-45% (v/v) kootapala koji sadrži jedan ili više farmaceutski prihvatljivih glikola ili neionske tenzidne komponente.

- Farmaceutski pripravak sukladno patentnom zahtjevu 1 pri čemu spoj formule (1) je bakar mezo-5, 15- bis[3-[(1,2-dikarba-klozo-dodekaboranil)-metoksi]-fenil]-mezo-10,20-dinitroporfirin.
- Farmaceutski pripravak sukladno patentnom zahtjevu 1 ili patentnim zahtjevom 2 pri čemu pomoćno sredstvo (b) sadrži 55-85% (v/v) otapala (i) i 15-45% (v/v) kootapala (ii).
- Farmaceutski pripravak sukladno patentnom zahtjevu 3 pri čemu pomoćno sredstvo (b) sadrži 68-82% (v/v) otapala (i) i 18-42% (v/v) kootapala (ii).
- Farmaceutski pripravaku skladu s bilo kojim od prethodnih patentnih zahtjeva

pri čemu se neionski surfaktant odabire od:

polioksietilen sorbitan monoestra, preporučljivo polioksietilen sorbitan monolaurata ili polioksietilen sorbitan monooleata;

polioksietilen estar hidroksilisane masne kiseline, preporučljivo polioksietilen 15-hidroksistearat; poloksamera; i polietoksiliranog ricinusovog ulja.

6. Farmaceutski pripravak sukladno bilo kojem od prethodnih patentnih zahtjeva pri čemu kootapalo (ii) sadrži:

(ii-a) polioksietilen 15-hidroksistearat; ili

(ii-b) mješavinu polioksietilen 15-hidroksistearata i polietilen glikola; ili

(ii-c) polisorbata 20; ili

(ii-d) polietilen glikol; ili

(ii-e) mješavinu polisorbata 20 i polietilen glikola; ili (ii-f) mješavinu polisorbata 20 i polipropilen glikola; ili

(ii-g) tetraglikol; ili

(ii-h) mješavinu polisorbata 20 i tetraglikola; ili

(ii-i) mješavinu polioksietilen 15-hidroksistearata i tetraglikola.

7. Farmaceutski pripravak sukladno patentnom zahtjevu 6 pri čemu pomoćno sredstvo (b) sadrži 68-82% (v/v) otapala (i) dimetilacetamid i 18-32% (v/v) kootapala (ii) pri čemu to kootapalo (ii) sadrži polioksietilen 15-hidroksistearat i opcijski polietilen glikol.

8. Farmaceutski pripravak sukladno patentnom zahtjevu 7 pri tome polietilen glikol, kada je prisutan čini od 1-15% (v/v) pomoćnog sredstva (b), preporučljivo od 8-12% (v/v) pomoćnog sredstva (b).

9. Farmaceutski pripravak sukladno patentnom zahtjevu 8 pri tome pomoćno sredstvo (b) sadrži 68-72% (v/v) otapala (i) dimetilacetamid i 28-32% (v/v) kootapala (ii) pri tome kootapalo (ii) sadrži polioksietilen 15-hidroksistearat ili odnos 2:1 (v/v) mješavine polioksietilen 15-hidroksistearata i polietilen glikola.

10. Farmaceutski pripravak sukladno bilo kojem od prethodnih patentnih zahtjeva pri tome je spoj formule (1) prisutan u količini koja odgovara od 25 mg do 100 mg po mililitru pomoćnog sredstva (b).

11. Farmaceutski pripravak sukladno patentnom zahtjevu 10 pri čemu je spoj formule (1) prisutan u količini koja odgovara od 40 mg do 80 mg po mililitru pomoćnog sredstva (b), poželjno približno 50 mg po mililitru pomoćnog sredstva (b).

12. Farmaceutski pripravak sukladno bilo kojem od prethodnih patentnih zahtjeva što je otopina spoja formule (1) u pomoćnom sredstvu (b).

13. Farmaceutski pripravak sukladno bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 11 koji sadrži prvu posudu koja sadrži spoj formule (1) u obliku praha i jednu ili više posuda koje sadrže otapalo (i) i kootapalo (ii).

14. Farmaceutski pripravak sukladno patentnom zahtjevu 13 pri čemu postoje još dvije posude, od kojih jedna sadrži otapalo (i) i druga sadrži mješavinu otapala (i) i kootapala (ii).

15. Otopina za injekciju ili infuziju koja sadrži spoj formule (1), pomoćno sredstvo koje sadrži otapalo (i) i kootapalo (ii) kako je definirano u bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 14 i izotonični vodeni razrjeđivač.

16. Spoj sukladno bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 14, naznačen time, da služi za senzibilizaciju tumora radi liječenja zračenjem.