

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

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

(10)

FI/EP3943070 T3

(12)

**EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION**

(45)

Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning -
Translation available to the public

24.01.2024

(97)

Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för
det europeiska patentet - Date of grant of European patent

22.11.2023

(51)

Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -
International patent classification

A61K 9/10 (2006 . 01)

A61K 47/26 (2006 . 01)

A61K 31/47 (2006 . 01)

A61P 31/06 (2006 . 01)

A61P 31/08 (2006 . 01)

(96)

Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan -
European patent application

EP21178526.6

(22)

Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date

13.07.2018

(97)

Patenttihakemuksen julkiseksitulosopäivä - Patentansökans
publiceringsdag - Patent application available to the public

26.01.2022

(30)

Etu oikeus - Prioritet - Priority

14.07.2017 EP EP17181354

16.04.2018 EP EP18167463

(73)

Haltija - Innehavare - Holder

1• Janssen Pharmaceutica NV, Turnhoutseweg 30, 2340 Beerse, (BE)

(72)

Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1• Andries, Koenraad, Jozef, Lodewijk, Marcel, 2340 Beerse, (BE)

2• BASSTANIE, Esther, Dina, Guido, 2340 Beerse, (BE)

3• BERNINI, Maristella, 2340 Beerse, (BE)

(74)

Asiamies - Ombud - Agent

Novagraaf International SA, Chemin de l'Echo, 3, 1213 Onex, (CH)

(54)

Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

PITKÄVAIKUTTEISIA BEDAKILIINIFORMULAATIOITA

LONG-ACTING FORMULATIONS OF BEDAQUILINE

PITKÄVAIKUTTEISIA BEDAKILIINIFORMULAATIOITA

PATENTTIVAATIMUKSET

1. Lääkekoostumus, joka on tarkoitettu annettavaksi lihaksensisäisenä tai ihonalaisena injektiona ja joka käsittää terapeuttisesti tehokkaan määrän
5 bedakiliinia tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävää suolaa sellaisen mikro- tai nanopartikkelien suspension muodossa, joka käsittää
 - a) bedakiliinia tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävää suolaa mikro- tai nanopartikkelimuodossa, jonka pintaan on adsorboitunut pinnanmuokkausainetta, ja
 - (b) farmaseuttisesti hyväksyttävää vesipitoista kantoainetta, johon vaikuttava
10 bedakiliiniaineosa on suspendoitu.
2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen koostumus, jossa pinnanmuokkausaine on valittu ryhmästä, jonka muodostavat poloksameerit, α -tokoferyylipolyetyleeniglykolisuksinaatit, polyoksietyleenisorbitaanirasvahappoesterit ja negatiivisesti varautuneiden
15 fosfolipidien suolat.
3. Patenttivaatimuksen 1 tai 2 mukainen koostumus, jossa bedakiliini on suolattomassa tai vapaassa muodossaan tai fumaraattisuolan muodossa.
4. Jonkin patenttivaatimuksen 1–3 mukainen koostumus, jossa pinnanmuokkausaine on valittu poloksameeri Pluronic™ F108:sta, E-vitamiini-TGPS:stä, polyoksietyleenisorbitaanirasvahappoesteri Tween™ 80:sta ja munan
20 fosfatidyylylglycerolinatrium-Lipoid™ EPG:stä.
5. Jonkin patenttivaatimuksen 1–4 mukainen koostumus, jossa bedakiliinin tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävän suolan mikro- tai nanopartikkelien keskimääräinen efektiivinen hiukkaskoko on alle noin 50 μm , erityisesti alle noin 200 nm.
- 25 6. Jonkin patenttivaatimuksen 1–4 mukainen koostumus, jossa bedakiliinin tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävän suolan mikro- tai nanopartikkelien keskimääräinen efektiivinen hiukkaskoko on alle noin 130 nm.

7. Patenttivaatimuksen 1 tai 2 mukainen koostumus, joka käsittää koostumuksen kokonaistilavuudesta painon mukaan

(a) 10–70 % (paino/tilavuus) tai 20–60 % (paino/tilavuus) tai 20–50 % (paino/tilavuus) tai 20–40 % (paino/tilavuus) bedakiliinia (tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävää suolaa, mutta jolloin paino/tilavuus lasketaan sen ei-suolamuodon perusteella)

(b) 0,5–20 % tai 2–15 % tai 20 % (paino/tilavuus) tai 5–15 % (paino/tilavuus) kostutusainetta

(c) 0–10 % tai 0–5 % tai 0–2 % tai 0–1 % yhtä tai useampaa puskurointiainetta

(d) 0–20 % tai 2–15 % tai 20 % (paino/tilavuus) tai 5–15 % (paino/tilavuus) isotoonisuuden säätöainetta

(e) 0–2 % (paino/tilavuus) säilöntäaineita ja

(f) injektiovettä 100 %:iin saakka.

8. Jonkin patenttivaatimuksen 1–7 mukainen lääkekoostumus käytettäväksi lääkkeenä.

9. Jonkin patenttivaatimuksen 1–8 mukainen lääkekoostumus käytettäväksi patogeenisen mykobakteeri-infektion hoidossa.

10. Patenttivaatimuksen 9 mukaisesti käytettävä koostumus, jolloin se on *Mycobacterium tuberculosis* tai *Mycobacterium lepra*en pitkäaikainen hoito.

11. Patenttivaatimuksen 9 mukaisesti käytettävä koostumus, jolloin se on tarkoitettu annettavaksi lihaksensisäisenä tai ihonalaisena injektiona; jolloin koostumusta annetaan jaksoittain yhden viikon – kahden vuoden välein.

12. Patenttivaatimuksen 9 mukaisesti käytettävä koostumus, jolloin lääkekoostumusta annetaan vähintään yhden kuukauden – yhden vuoden välein.

13. Patenttivaatimuksen 8 mukaisesti käytettävä koostumus, jolloin lääkekoostumusta annetaan aikavälillä, joka on välillä yhdestä viikosta yhteen

kuukauteen tai yhdestä kuukaudesta kolmeen kuukauteen tai kolmesta kuukaudesta kuuteen kuukauteen tai kuudesta kuukaudesta kahteentoista kuukauteen tai 12 kuukaudesta 24 kuukauteen.

14. Patenttivaatimuksen 9 mukaisesti käytettävä koostumus, jolloin
5 lääkekoostumusta annetaan kerran kahdessa viikossa tai kerran kuukaudessa tai kerran kolmessa kuukaudessa.

15. Menetelmä jonkin patenttivaatimuksen 1–7 mukaisen lääkekoostumuksen valmistamiseksi, joka menetelmä käsittää seuraavat:

- (a) hankitaan bedakiliini tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola
10 mikronisoidussa muodossa
- (b) lisätään mikronisoitu bedakiliini tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola nestemäiseen väliaineeseen esiseoksen/esidispersion muodostamiseksi ja
- (c) käsitellään esiseosta mekaanisilla välineillä jauhatusväliaineen läsnä ollessa, jotta saadaan pienennettyä keskimääräistä efektiivistä hiukkaskokoa.