

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

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

(10) **FI/EP4066821 T3**
(12) **EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS**
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION

- (45) Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning - **13.05.2025**
Translation available to the public
- (97) Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för **05.03.2025**
det europeiska patentet - Date of grant of European patent
- (51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -
International patent classification
A61K 9/20 (2006 . 01)
C07D 401/12 (2006 . 01)
A61K 31/4709 (2006 . 01)
A61P 35/00 (2006 . 01)
A61P 43/00 (2006 . 01)
A61K 9/28 (2006 . 01)
- (96) Eurooppapatentihakemus - Europeisk patentansökan - **EP22169771.7**
European patent application
- (22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date **02.11.2010**
- (97) Patentihakemuksen julkiseksitilopäivä - Patentansökans **05.10.2022**
publiceringsdag - Patent application available to the public
- (30) Etuoikeus - Prioritet - Priority
09.11.2009 US US25940309 P

(73) Haltija - Innehavare - Holder
1• Wyeth LLC , 66 Hudson Boulevard East , New York, NY 10001-2192 , (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor
1• ASHRAF, Muhammad , Elmwood Park, 07407 , (US)
2• GHOSH, Krishnendu , Pearl River, 10965 , (US)
3• GOOLCHARRAN, Chimanlall , Groton, 06340 , (US)
4• MAHMUD, Mainuddin , Oak Ridge, 07438 , (US)
5• NAGI, Arwinder Singh , Moorpark, 93021 , (US)

(74) Asiamies - Ombud - Agent
Zacco Sweden AB , 11485 Stockholm , (SE)

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention
NERATINIBIMALEAATIN TABLETTIFORMULAATIOITA
TABLET FORMULATIONS OF NERATINIB MALEATE

Patenttivaatimukset

1. Tabletti, joka käsittää farmaseuttisesti hyväksyttävän koostumuksen, joka käsittää
- 5 rakeen sisäisinä aineosina
 - (a) 35–70 painoprosenttia neratinibimaleaattia
 - (b) 15–65 painoprosenttia yhtä tai useampaa täyteainetta
 - (c) 0–8 painoprosenttia yhtä tai useampaa hajotusainetta
 - (d) 0,2–8 painoprosenttia yhtä tai useampaa liukuainetta ja
 - (e) 5–15 painoprosenttia yhtä tai useampaa pintaa muokkaavaa ainetta
 - 10 ja rakeen ulkoisina aineosina
 - (f) 1–25 painoprosenttia yhtä tai useampaa täyteainetta
 - (g) 0–8 painoprosenttia yhtä tai useampaa hajotusainetta ja
 - (h) 0,1–3 painoprosenttia yhtä tai useampaa voiteluainetta.
- 15 2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen tabletti, joka käsittää farmaseuttisesti hyväksyttävän koostumuksen, joka käsittää
- rakeen sisäisinä aineosina
- 20 (a) 35–70 painoprosenttia neratinibimaleaattia
 - (b) 15–65 painoprosenttia mannitolia, mikrokiteistä selluloosaa tai kummankin yhdistelmää
 - (c) 0,5–8 painoprosenttia krospovidonia, kroskarmelloosinatriumia tai kummankin yhdistelmää
 - (d) 0,2–8 painoprosenttia kolloidista piidioksidia ja
 - (e) 5–15 painoprosenttia povidonia
- 25 ja rakeen ulkoisina aineosina
- (f) 1–25 painoprosenttia mikrokiteistä selluloosaa
 - (g) 1–8 painoprosenttia krospovidonia ja
 - (h) 0,5–3 painoprosenttia magnesiumstearaattia.
- 30 3. Patenttivaatimuksen 1 tai 2 mukainen tabletti, jossa neratinibimaleaatin määrä on 35–50 painoprosenttia, 41–70 painoprosenttia tai 41–50 painoprosenttia.

4. Patenttivaatimuksen 2 tai 3 mukainen tabletti, jossa krosprovidonin määrä rakeen sisäisenä aineosana on noin 3 painoprosenttia.
5. Patenttivaatimuksen 2 tai 3 mukainen tabletti, jossa povidonin määrä rakeen sisäisenä aineosana on noin 5 painoprosenttia.
6. Jonkin patenttivaatimuksen 1–5 mukainen tabletti, jolloin tabletti on päällystetty tabletti.
- 10 7. Jonkin patenttivaatimuksen 1–6 mukainen tabletti 40 mg:n, 80 mg:n tai 240 mg:n suun kautta annettavan annoksen muodossa.
8. Jonkin patenttivaatimuksen 1–7 mukainen tabletti käytettäväksi syövän hoitomenetelmässä.
- 15 9. Menetelmä farmaseuttisesti hyväksyttävän koostumuksen valmistamiseksi, jolloin menetelmä käsittää seuraavat:
- (1) suihkutetaan 5–15 painoprosenttia yhtä tai useampaa pintaa muokkaavaa ainetta granulaatin rakeen sisäisten aineosien päälle, jolloin mainitut rakeen sisäiset
- 20 aineosat käsittävät
- (a) 35–70 painoprosenttia neratinibimaleaattia
 - (b) 15–65 painoprosenttia yhtä tai useampaa täyteainetta
 - (c) 0–8 painoprosenttia yhtä tai useampaa hajotusainetta ja
 - (d) 0,2–8 painoprosenttia yhtä tai useampaa liukuainetta;
- 25 ja
- (2) yhdistetään mainitut päällystetyt rakeen sisäiset aineosat rakeen ulkopuolisiin aineosiin, jotka käsittävät
- (f) 1–25 painoprosenttia yhtä tai useampaa täyteainetta
 - (g) 0–8 painoprosenttia yhtä tai useampaa hajotusainetta ja
 - 30 (h) 0,1–3 painoprosenttia yhtä tai useampaa voiteluainetta.
10. Patenttivaatimuksen 9 mukainen menetelmä, jossa pintaa muokkaava aine on povidoni.

11. Patenttivaatimuksen 9 mukainen menetelmä, jolloin menetelmä lisäksi käsittää yhdistettyjen aineosien prosessoinnin tableteiksi.

5 **12.** Jonkin patenttivaatimuksen 9–11 mukainen menetelmä, jossa menetelmä käsittää leijukerrosrakeistuksen.

13. Jonkin patenttivaatimuksen 9–12 mukainen menetelmä, joka käsittää seuraavat:

10 (1) suihkutetaan 5–15 painoprosenttia povidonia granulaatin rakeen sisäisten aineosien päälle, jolloin mainitut rakeen sisäiset aineosat käsittävät

(a) 35–70 painoprosenttia neratinibimaleaattia

(b) 15–65 painoprosenttia mannitolia, mikrokiteistä selluloosaa tai kummankin yhdistelmää

15 (c) 0,5–8 painoprosenttia krospovidonia, kroskarmelloosinatriumia tai kummankin yhdistelmää

(d) 0,2–8 painoprosenttia kolloidista piidioksidia;

ja

20 (2) yhdistetään mainitut päällystetyt rakeen sisäiset aineosat rakeen ulkopuolisiin aineosiin, jotka käsittävät

(f) 1–25 painoprosenttia mikrokiteistä selluloosaa

(g) 1–8 painoprosenttia krospovidonia ja

(h) 0,5–3 painoprosenttia magnesiumstearaattia.

25 **14.** Jonkin patenttivaatimuksen 9–13 mukainen menetelmä, jossa neratinibimaleaatin määrä on 35–50 painoprosenttia, 41–70 painoprosenttia tai 41–50 painoprosenttia.

30 **15.** Patenttivaatimuksen 13 tai 14 mukainen menetelmä, joka käsittää seuraavat vaiheet:

1. sekoitetaan neratinibimaleaatti, mannitoli, mikrokiteinen selluloosa ja krospovidoni ja piidioksidi

2. liuotetaan povidoni puhdistettuun veteen

3. tehdään vaiheen 1 jauheseos juoksevaksi ja suihkutetaan se vaiheessa 2 valmistetun liuoksen kanssa sopivassa leijukerrosrakeistimessa ja kuivaimessa
4. kuivataan granulaatti
- 5 5. jauhetaan granulaatti
6. lisätään mikrokiteistä selluloosaa ja krospovidonia vaiheen 5 granulaattiin ja sekoitetaan seos
7. lisätään magnesiumstearaatti vaiheen 6 seokseen ja sekoitetaan seos
8. puristetaan vaiheen 7 seos halutun vahvuisiksi tableteiksi
- 10 9. levitetään kalvopäällyste puristetuille tableteille.