



(19) REPUBLIKA HRVATSKA  
DRŽAVNI ZAVOD ZA  
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator  
dokumenta:



HR P20250100 T1

HR P20250100 T1

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

(51) MKP:

**A61P 11/00** (2006.01)  
**A61K 9/20** (2006.01)  
**A61K 45/06** (2006.01)  
**A61K 31/443** (2006.01)  
**A61K 31/47** (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 28.03.2025.

(21) Broj predmeta: P20250100T

(22) Datum podnošenja : 01.11.2013.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 18192504.1  
Datum podnošenja europske prijave patenta: 01.11.2013.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3470063 A1  
Datum objave europske prijave patenta: 17.04.2019.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3470063 B1  
Datum objave europskog patenta: 01.01.2025.

(31) Broj prve prijave: 201261721622 P (32) Datum podnošenja prve prijave: 02.11.2012. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US  
201261728328 P 20.11.2012. US  
201361770668 P 28.02.2013. US  
201361824005 P 16.05.2013. US  
201361840668 P 28.06.2013. US

(62) Broj i datum prvobitne prijave u slučaju podjele patenta: 13792149.0 01.11.2013.

(73) Nositelj patenta: **Vertex Pharmaceuticals Incorporated, 50 Northern Avenue, Boston, MA 02210, US**

(72) Izumitelji: **Marinus Jacobus Verwijs, 4 Carter Drive, Framingham, MA 01701, US**  
**Radhika Karkare, 88 Oxbow Road Framingham, Framingham, MA 01701, US**  
**Michael Douglas Moore, 22 Prospect Street, Unit 1, Charlestown, MA 02129, US**

(74) Zastupnik: **Vukmir i suradnici odvjetničko društvo d.o.o., 10000 Zagreb, HR**

(54) Naziv izuma: **FARMACEUTSKI PRIPRAVCI ZA LIJEČENJE CFTR-POSREDOVANIH BOLESTI**

HR P20250100 T1

## PATENTNI ZAHTJEVI

1. Farmaceutski pripravak, **naznačen time, da** obuhvaća:  
 3-(6-(1-(2,2-difluorbenzo[d][1,3]dioxol-5-il)ciklopropankarboksamido)-3-metilpiridin-2-il)benzojevu  
 5 kiselinu (Spoj 1) Oblik I; i  
 čvrstu disperziju koja sadrži uglavnom amorfnu (N-(5-hidroksi-2,4-ditert-butil-fenil)-4-okso-1H-kinolin-3-  
 karboksamid (Spoj 2) i polimer, pri čemu uglavnom amorfnu Spoj 2 ima manje od 15% kristalnosti;  
 gdje je Spoj 1 Oblik I **naznačen s** najmanje jednim maksimumom koji ima 2θ-vrijednost u rasponu odabranom  
 10 od 15,2 do 15,6, 16,1 do 16,5, i 14,3 do 14,7 stupnjeva u uzorku rendgenske difrakcije na prahu, koji je dobiven  
 uporabom Cu K alfa zračenja, i/ili  
 pri čemu je Spoj 1 Oblik I naznačen time, da je to kristalni oblik koji ima monoklinički kristalni sustav, P2<sub>1</sub>/n  
 prostornu grupu, i sljedeće dimenzije jedinične stanice:

$$\begin{array}{ll} A = 4,9626 \text{ (7) \AA} & V = 2014,0 \text{ \AA}^3 \\ B = 12,299 \text{ (2) \AA} & \beta = 93,938 \text{ (9)^\circ} \\ C = 33,075 \text{ (4) \AA} & Z = 4; \end{array}$$

gdje je Spoj 1 Oblik I prisutan u količini od najmanje 20 masenih % prema masi pripravka;  
 dok je uglavnom amorfnu Spoj 2 prisutan u količini od najmanje 20 masenih % prema masi pripravka; i  
 pri čemu je farmaceutski pripravak u obliku granule ili tablete.

2. Farmaceutski pripravak prema patentnom zahtjevu 1, **naznačen time, da** je Spoj 1 Oblik I prisutan u količini od  
 20 najmanje 30 masenih % prema masi pripravka, i time, da je uglavnom amorfnu Spoj 2 prisutan u količini od najmanje  
 30 masenih % prema masi pripravka.  
 3. Farmaceutski pripravak prema patentnom zahtjevu 1, **naznačen time, da** nadalje obuhvaća punilo, dezintegrator,  
 surfaktant, i vezivno sredstvo, pri čemu pripravak sadrži 30-50 masenih % Spoja 1 Oblika I prema masi pripravka i  
 20-35 masenih % uglavnom amorfnog Spoja 2 prema masi pripravka.  
 25 4. Farmaceutski pripravak prema patentnom zahtjevu 1, **naznačen time, da** farmaceutski pripravak je tableta i ima  
 sljedeću formulaciju:

Komponenta	maseni %
Spoj 1 Oblik I	20-40
Čvrsta disperzija koja sadrži uglavnom amorfnu Spoj 2	30-40
Mikrokristalna celuloza	20-30
Kroskarmeloza natrij	1-10
Polivinilpirolidon	1-5
Natrijev lauril sulfat	0,1-1
Magnezijev stearat	0,5-1,5

;

opcionalno pritom tableta je obložena filmom.

5. Farmaceutski pripravak prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 4, **naznačen time, da** uglavnom amorfnu Spoj  
 30 2 ima manje od 10% kristalnosti, opcionalno gdje uglavnom amorfnu Spoj 2 ima manje od 5% kristalnosti.  
 6. Farmaceutski pripravak prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 5, **naznačen time, da** je za uporabu u postupku  
 za liječenje, smanjivanje ozbiljnosti, ili simptomatsko liječenje cistične fibroze kod pacijenta,  
 pri čemu postupak obuhvaća davanje pacijentu 400 mg Spoja 1 Oblika I i 500 mg uglavnom amorfnog Spoja 2,  
 35 gdje se količina za doziranje postiže putem davanja dvije tablete svakih 12 sati, i  
 gdje svaka tableta sadrži 100 mg Spoja 1 Oblika I i 125 mg uglavnom amorfnog Spoja 2.  
 7. Farmaceutski pripravak prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 5, **naznačen time, da** je za uporabu u postupku  
 za liječenje, smanjivanje ozbiljnosti, ili simptomatsko liječenje cistične fibroze kod pacijenta,  
 pri čemu postupak obuhvaća davanje pacijentu 800 mg Spoja 1 Oblika I i 500 mg uglavnom amorfnog Spoja 2,  
 40 gdje se količina za doziranje postiže putem davanja dvije tablete svakih 12 sati, i  
 gdje svaka tableta sadrži 200 mg Spoja 1 Oblika I i 125 mg uglavnom amorfnog Spoja 2.  
 8. Farmaceutski pripravak za uporabu prema patentnom zahtjevu 6 ili zahtjevu 7, **naznačen time, da** je pacijent  
 homozigot za CFTR mutaciju ΔF508.