

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

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

(10)

FI/EP3777833 T3

(12)

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

(45)

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

03.01.2024

(97)

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

18.10.2023

(51)

Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -
International patent classification

A61K 9/00 (2006 . 01)

A61K 47/18 (2017 . 01)

A61K 47/20 (2006 . 01)

A61K 47/22 (2006 . 01)

A61K 31/198 (2006 . 01)

A61K 31/133 (2006 . 01)

A61P 25/16 (2006 . 01)

(96)

Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan -
European patent application

EP20198371.5

(22)

Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date

12.03.2015

(97)

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

17.02.2021

(30)

Etuoikeus - Prioritet - Priority

13.03.2014 US US201461952477 P

09.05.2014 US US201461990967 P

(73)

Haltija - Innehavare - Holder

1 • Neuroderm Ltd. , Weizmann Science Park 3 Golda Meir Street , 7403648 Ness Ziona , (IL)

(72)

Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1 • Yacoby-Zeevi, Oron , 204 Hanarkissim Street , 6094600 Bitsaron , (IL)

(74)

Asiamies - Ombud - Agent

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

(54)

Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

DOPA-DEKARBOXYLAASIN ESTÄJÄN KOOSTUMUKSIA

DOPA DECARBOXYLASE INHIBITOR COMPOSITIONS

DOPA-DEKARBOKSYLAASIN ESTÄJÄN KOOSTUMUKSIA

PATENTTIVAATIMUKSET

1. Lääkekoostumus, joka käsittää karbidopaa, vähintään kahta antioksidanttia ja farmaseuttisesti hyväksyttävää kantoainetta, jolloin yksi mainituista antioksidanteista on askorbiinihappo tai sen suola, ja se käsittää lisäksi (i) levodopaa ja (ii) arginiinia, meglumiinia tai niiden yhdistelmää ja valinnaisesti pinta-aktiivista ainetta; jolloin toinen mainituista antioksidanteista on kukin itsenäisesti L-kysteiini tai sen suola, N-asetyylikysteiini (NAC) tai natriumbisulfiitti, jolloin koostumus on formuloitu ihonalaisesti annettavaksi nesteeksi ja jolloin mainitun koostumuksen pH on 9,1–10 ja se käsittää alle 1 µg/ml hydratsiinia GCMS-menetelmällä määritettynä tai alle 5 paino-% 3,4-dihydroksifenyyli-2-metyylipropionihappoa (yksilöity tässä hajottusaineeksi) suhteessa karbidopan alkuperäiseen määrään määritettynä HPLC:llä.
2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen lääkekoostumus, joka käsittää alle 0,5 µg/ml, edullisesti alle 0,1 µg/ml, hydratsiinia tai alle 1 %, edullisesti alle 0,2 %, hajotusainetta suhteessa karbidopan määrään.
3. Patenttivaatimuksen 1 mukainen lääkekoostumus, joka käsittää 0,1–10 paino-% karbidopaa tai 0,5–6 paino-%, edullisesti 0,75–4 paino-%, edullisemmin 0,75–1,4 paino-%, 3, 3,3 paino-% tai 4 paino-%, karbidopa.
4. Patenttivaatimuksen 1 mukainen lääkekoostumus, joka käsittää 0,1–10 paino-% askorbiinihappoa tai sen suolaa tai 0,2–2 %, edullisesti 0,4–1,3 %, edullisemmin 0,5 %, 0,6 %, 0,75 %, 0,85 %, 1,0 % tai 1,2 paino-%, askorbiinihappoa tai sen suolaa.
5. Patenttivaatimuksen 1 mukainen lääkekoostumus, joka käsittää
 - (i) 0,001–5 paino-%, edullisesti 0,01–1 paino-%, edullisemmin 0,1–0,6 paino-%, 0,3 paino-% tai 0,4 paino-% L-kysteiiniä tai sen suolaa ja/tai
 - (ii) 0,001–5 paino-%, edullisesti 0,01–1 paino-%, edullisemmin 0,1 paino-%, 0,2 paino-%, 0,3 paino-% tai 0,4 paino-% NAC:tä ja/tai

(iii) 0,01–2 paino-%, edullisesti 0,075–0,75 paino-%, edullisemmin 0,1 paino-% natriumbisulfiittia.

6. Patenttivaatimuksen 1 mukainen lääkekoostumus,

joka käsittää 0,1–10 paino-% karbidopaa, 0,1–10 paino-%, askorbiinihappoa tai
5 sen suolaa ja

(i) 0,001–5 paino-% L-kysteiiniä tai sen suolaa

(ii) 0,001–5 paino-% NAC:tä tai

(iii) 0,01–2 paino-% natriumbisulfiittia; tai

joka käsittää 0,5–6 paino-%, edullisesti 0,75–4 paino-%, karbidopaa,
10 0,2–2 paino-%, edullisesti 0,4–1,3 paino-%, askorbiinihappoa tai sen suolaa ja

(i) 0,01–1 paino-%, edullisesti 0,1–0,6 paino-%, L-kysteiiniä tai sen suolaa

(ii) 0,01–1 paino-%, edullisesti 0,1–0,4 paino-%, NAC:tä tai

(iii) 0,075–0,75 paino-% natriumbisulfiittia.

7. Patenttivaatimuksen 1 mukainen lääkekoostumus, joka käsittää

15 joko alle 1 % tai 1 %–20 paino-% levodopaa tai 2 %–16 %, edullisesti 4 %, 6 %, 12 % tai 13,2 paino-%, levodopaa.

8. Patenttivaatimuksen 1 mukainen lääkekoostumus, joka käsittää 0,1–42 paino-%, edullisesti 2–40 paino-%, edullisemmin 12–36 paino-% tai 15,2–32 paino-% arginiinia, meglumiinia tai niiden yhdistelmää.

20 9. Patenttivaatimuksen 1 mukainen lääkekoostumus,

joka käsittää

(i) 0,1–10 paino-% karbidopaa

(ii) 0,1–10 paino-% askorbiinihappoa tai sen suolaa

- (iii) 0,001–5 paino-% L-kysteiiniä tai sen suolaa, 0,001–5 paino-% NAC:tä; tai 0,01–2 paino-% natriumbisulfiittia
- (iv) 1–20 paino-% levodopaa
- (v) 0,1–42 paino-% arginiinia, meglumiinia tai niiden yhdistelmää ja valinnaisesti
- 5 (vi) 0,01–5 paino-% polysorbaatti 80:aa, jolloin koostumus sisältää alle 1 µg/ml, edullisesti alle 0,5 µg/ml, edullisemmin alle 0,1 µg/ml, hydratsiinia, tai joka käsittää
 - (i) 0,5–6 paino-%, edullisesti 0,75–4 paino-%, edullisemmin 0,75 paino-%, 1,4 paino-%, 3 paino-% tai 3,3 paino-% karbidopaa
 - 10 (ii) 0,2–2 paino-%, edullisesti 0,4–1,3 paino-%, edullisemmin 0,5 paino-%, 1,2 paino-% tai 1,3 paino-%, askorbiinihappoa tai sen suolaa
 - (iii) 0,01–1 paino-%, edullisesti 0,1–0,6 paino-%, L-kysteiiniä tai sen suolaa, 0,01–1 paino-%, edullisesti 0,1–0,4 paino-%, NAC:tä; tai 0,075–0,75 paino-% natriumbisulfiittia;
 - 15 (iv) 2 %-16 %, edullisesti 4 %, 6 %, 12 % tai 13,2 paino-%, levodopaa
 - (v) 2–42 paino-%, edullisesti 12–36 paino-% tai 15,2–32 paino-%, arginiinia, meglumiinia tai niiden yhdistelmää ja
 - (vi) 0,1–0,5 paino-%, edullisesti 0,3 paino-%, polysorbaatti 80:aa.
- 10. Patenttivaatimuksen 1 mukainen lääkekoostumus, joka käsittää
- 20 (i) 12 paino-% levodopaa, 3 paino-% karbidopaa, 32 paino-% arginiinia, 1,2 paino-% natriumaskorbaattia ja 0,3 paino-% L-kysteiiniä tai kysteiinihydrokloridia
- (ii) 13,2 paino-% levodopaa, 3,3 paino-% karbidopaa, 36 paino-% arginiinia, 1,3 paino-% natriumaskorbaattia ja 0,3 paino-% L-kysteiiniä tai kysteiinihydrokloridia
- (iii) 13,2 paino-% levodopaa, 3,3 paino-% karbidopaa, 36 paino-% meglumiinia,
- 25 1,3 paino-% natriumaskorbaattia ja 0,3 paino-% L-kysteiiniä tai kysteiinihydrokloridia

- (iv) 12 paino-% levodopaa, 3 paino-% karbidopaa, 32 paino-% meglumiinia, 1,2 paino-% natriumaskorbaattia ja 0,3 paino-% NAC:a
- (v) 12 paino-% levodopaa, 3 paino-% karbidopaa, 32 paino-% arginiinia, 1,2 paino-% natriumaskorbaattia ja 0,3 paino-% NAC:a
- 5 (vi) 6 paino-% levodopaa, 1,4 paino-% karbidopaa, 15,5 paino-% arginiinia, 0,5 paino-% askorbiinihappoa, 0,4 paino-% L-kysteiiniä ja 0,3 paino-% polysorbaatti 80:aa
- (vii) 6 paino-% levodopaa, 1,4 paino-% karbidopaa, 15,5 paino-% arginiinia, 0,5 paino-% askorbiinihappoa, 0,5 paino-% NAC:a ja 0,3 paino-% polysorbaatti 80:aa
- 10 (viii) 6 paino-% levodopaa, 0,75 paino-% karbidopaa, 15,2 paino-% arginiinia, 0,5 paino-% askorbiinihappoa, 0,4 paino-% L-kysteiiniä ja 0,3 paino-% polysorbaatti 80:aa tai
- (ix) 6 paino-% levodopaa, 0,75 paino-% karbidopaa, 15,2 paino-% arginiinia, 0,5 paino-% askorbiinihappoa, 0,5 paino-% NAC:a ja 0,3 paino-% polysorbaatti 80:aa.
- 15 11. Jonkin patenttivaatimuksen 1–10 mukainen lääkekoostumus, joka käsittää alle 1 µg/ml, edullisesti alle 0,1 µg/ml, hydratsiinia 1–24 tunnin, 1–30 päivän, 1–12 kuukauden tai 1–3 vuoden kuluttua lämpötila-alueella –20 °C...+25 °C, esim. –20 °C, 2–8 °C tai 25 °C.
12. Jonkin patenttivaatimuksen 1–11 mukainen lääkekoostumus käytettäväksi
- 20 dopamiinin tai dopaminergisten hermosolujen katoamiseen liittyvän sairauden, häiriön tai tilan hoidossa, jolloin mainittu sairaus, häiriö tai tila on edullisesti Parkinsonin tauti.
13. Tarvikesarja, joka käsittää yhden tai kaksi säiliötä tai useampia säiliöitä, joista kukin sisältää jonkin patenttivaatimuksen 1–11 mukaista
- 25 lääkekoostumusta, käytettäväksi sellaisen sairauden, häiriön tai tilan hoidossa, joka liittyy dopamiinin tai dopaminergisten hermosolujen katoamiseen, vähintään 1 päivän, 1 viikon, 1 kuukauden, 2 kuukauden, 6 kuukauden tai yhden vuoden ajan, jolloin mainittu sairaus, häiriö tai tila on edullisesti Parkinsonin tauti.