



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20171304 T1



HR P20171304 T1

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

(51) MKP:

C07D 401/12 (2006.01)
A61K 31/4709 (2006.01)
A61P 11/00 (2006.01)
A61P 11/06 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 20.10.2017.

(21) Broj predmeta: P20171304T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 30.08.2017.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2007051196
Datum podnošenja međunarodne prijave: 08.02.2007.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 07704449.3
Datum podnošenja europske prijave patenta: 08.02.2007.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2007090859
Datum međunarodne objave: 16.08.2007.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 1981872 A1
Datum objave europske prijave patenta: 22.10.2008.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 1981872 B1
Datum objave europskog patenta: 21.06.2017.

(31) Broj prve prijave: 0602778

(32) Datum podnošenja prve prijave: 10.02.2006.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: GB

(73) Nositelj patenta:

**Glaxo Group Limited, 980 Great West Road, Brentford, TW8 9GS
Middlesex, GB**

(72) Izumitelji:

**Reshma Chudasama, GlaxoSmithKline, Gunnels Wood Road, SG1 2NY
Stevenage Hertfordshire, GB
Andrew Kennedy, GlaxoSmithKline, Gunnels Wood Road, SG1 2NY
Stevenage Hertfordshire, GB
Leanda Jane Kindon, GlaxoSmithKline, Gunnels Wood Road, SG1 2NY
Stevenage Hertfordshire, GB
Franck Patrick Mallet, GlaxoSmithKline, Gunnels Wood Road, SG1 2NY
Stevenage Hertfordshire, GB**

(74) Zastupnik:

Hraste & Partneri odvjetničko društvo, 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma:

**SOL S JANTARNOM KISELINOM 1-[2-(2-KLOR-4-[[[R]-2-HIDROKSI-2-(8-HIDROKSI-2-OKSO-
1,2-DIHIDROKINOLIN-5-IL)ETILAMINOMETIL]]-5-
METOKSIFENILKARBAMOIL)ETIL]PIPERIDIN-4-ILNOG ESTERA BIFENIL-2-ILKARBAMINSKE
KISELINE I NJEZINA UPOTREBA U LIJEČENJU PLUĆNIH POREMEĆAJI**

HR P20171304 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Sol s jantarnom kiselinom 1-[2-(2-klor-4-{{(R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrokinolin-5-il)etilamino}metil}-5-metoksifenilkarbamoi)etil]piperidin-4-ilnog estera bifenil-2-ilkarbaminske kiseline, koja je
 5 Oblik 1 kristalnog oblika čvrstog stanja, **naznačena time** što ima uzorak difrakcije rendgenskih zraka na prahu, s difrakcijskim maksimumima kod vrijednosti 2θ od 5,0, 5,7, 7,1, 10,0, 12,6, 13,8, 14,4, 15,5, 16,1, 16,4, 16,9, 17,8, 18,5, 20,2, 20,5, 21,4, 25,3, 25,8 i 26,3.
2. Kristalni Oblik 1 soli s jantarnom kiselinom u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što sol ima:
 - a. otisak diferencijalne skenirajuće kalorimetrije koji pokazuje talište u rasponu od 170 °C do 180 °C; ili
 - 10 b. infracrveni apsorpcijski spektar sa značajnim apsorpcijskim vrpčama na otprilike 3265, 2832, 1735, 1718, 1679, 1669, 1591, 1540, 1518, 1493, 1439, 1405, 1339, 1302, 1283, 1239, 1202, 1163, 1144, 1107, 1095, 1039, 1009, 973, 921, 885, 868, 838, 773, 751, te 707 cm^{-1} .
3. Kristalni Oblik 1 soli s jantarnom kiselinom u skladu s patentnim zahtjevom 1 ili patentnim zahtjevom 2, **naznačen time** što je u mikroniziranom obliku.
- 15 4. Farmaceutski pripravak, **naznačen time** što sadrži farmaceutski prihvatljivu podlogu uz kristalni Oblik 1 soli s jantarnom kiselinom u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 3.
5. Farmaceutski pripravak u skladu s patentnim zahtjevom 4, **naznačen time** što pripravak dodatno sadrži steroidno protuupalno sredstvo.
6. Farmaceutski pripravak u skladu s patentnim zahtjevom 5, **naznačen time** što je steroidno protuupalno sredstvo S-fluometilni ester 6 α ,9 α -difluor-17 α -[(2-furanilkarbonil)oksi]-11 β -hidroksi-16 α -metil-3-oksoandrosta-1,4-dien-17 β -karbotiojske kiseline, ili njegov solvat.
- 20 7. Farmaceutski pripravak u skladu s patentnim zahtjevom 5, **naznačen time** što je steroidno protuupalno sredstvo flutikazon-propionat.
8. Farmaceutski pripravak u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 4 do 7, **naznačen time** što je pripravak formuliran za primjenu inhaliranjem.
- 25 9. Farmaceutski pripravak u skladu s patentnim zahtjevom 4, **naznačen time** što je u mikroniziranom obliku.
10. Farmaceutski pripravak u skladu s patentnim zahtjevom 8, **naznačen time** što je podloga laktoza, škrob, manitol, dekstroza, polimlječna kiselina, polilaktid-ko-glikolid, ili njihova kombinacija.
11. Kombinacija, **naznačena time** što sadrži:
 - (a) kristalni Oblik 1 soli s jantarnom kiselinom u skladu s patentnim zahtjevom 1 ili patentnim zahtjevom 2; i
 - (b) steroidno protuupalno sredstvo.
- 30 12. Kombinacija u skladu s patentnim zahtjevom 11, **naznačena time** što je steroidno protuupalno sredstvo S-fluometilni ester 6 α ,9 α -difluor-17 α -[(2-furanilkarbonil)oksi]-11 β -hidroksi-16 α -metil-3-oksoandrosta-1,4-dien-17 β -karbotiojske kiseline, ili njegov solvat.
- 35 13. Kombinacija u skladu s patentnim zahtjevom 11, **naznačena time** što je steroidno protuupalno sredstvo flutikazon-propionat.
14. Kristalni Oblik 1 soli s jantarnom kiselinom 1-[2-(2-klor-4-{{(R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrokinolin-5-il)etilamino}metil}-5-metoksifenilkarbamoi)etil]piperidin-4-ilnog estera bifenil-2-ilkarbaminske kiseline u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1-3, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi u terapiji ili kao
 40 medikament.
15. Upotreba kristalnog Oblika 1 soli s jantarnom kiselinom 1-[2-(2-klor-4-{{(R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrokinolin-5-il)etilamino}metil}-5-metoksifenilkarbamoi)etil]piperidin-4-ilnog estera bifenil-2-ilkarbaminske kiseline, u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1-3, **naznačena time** što je kristalni Oblik 1 namijenjen proizvodnji medikamenta za liječenje plućnog poremećaja.
- 45 16. Upotreba u skladu s patentnim zahtjevom 15, **naznačena time** što je plućni poremećaj kronična opstruktivna plućna bolest ili astma.
17. Upotreba:
 - (a) kristalnog Oblika 1 soli s jantarnom kiselinom 1-[2-(2-klor-4-{{(R)-2-hidroksi-2-(8-hidroksi-2-okso-1,2-dihidrokinolin-5-il)etilamino}metil}-5-metoksifenilkarbamoi)etil]piperidin-4-ilnog estera bifenil-2-ilkarbaminske kiseline, u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1-3; i
 - 50 (b) steroidnog protuupalnog sredstva;**naznačena time** što su kristalni Oblik 1 i steroidno protuupalno sredstvo namijenjeni proizvodnji medikamenta za liječenje plućnog poremećaja.
18. Upotreba u skladu s patentnim zahtjevom 17, **naznačena time** što je steroidno protuupalno sredstvo S-fluometilni ester 6 α ,9 α -difluor-17 α -[(2-furanilkarbonil)oksi]-11 β -hidroksi-16 α -metil-3-oksoandrosta-1,4-dien-17 β -karbotiojske kiseline, ili njegov solvat.
19. Upotreba u skladu s patentnim zahtjevom 17, **naznačena time** što je steroidno protuupalno sredstvo flutikazon-propionat.
20. Postupak dobivanja Oblika 1 suksinatne soli u skladu s patentnim zahtjevom 1 ili patentnim zahtjevom 2, **naznačen time** što se navedeni postupak sastoji u koracima:
 60 otapanja suksinatne soli u vodenoj otopini THF-a (10-18%, primjerice 10-16%), na temperaturi u rasponu od 18 do 23 °C, primjerice otprilike 20 °C;

dodavanju prvog volumena nižeg alkohola, primjerice etanola ili izopropanola, osobito izopropanola, te zagrijavanju do 32-40 °C;
izbornom zasijavanju Oblikom 1;
5 dodavanju drugog volumena nižeg alkohola, primjerice tijekom nekoliko sati, po mogućnosti otprilike 12 sati;
hlađenju do temperature u rasponu od 18 do 23 °C, primjerice otprilike 20 °C; i
prikupljanju kristalnog produkta.