

(19)



SUOMI - FINLAND  
(FI)

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

(10)

**FI/EP3445338 T3**

(12)

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

(45)

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

**29.01.2025**

(97)

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

**27.11.2024**

(51)

Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -  
International patent classification

**A61K 9/20** ( 2006 . 01 )

**A61K 31/519** ( 2006 . 01 )

**A61P 9/00** ( 2006 . 01 )

**A61P 7/02** ( 2006 . 01 )

**A61P 9/10** ( 2006 . 01 )

**B65D 75/36** ( 2006 . 01 )

**A61J 1/03** ( 2023 . 01 )

**B65D 75/32** ( 2006 . 01 )

(96)

Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan -  
European patent application

**EP17720055.7**

(22)

Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date

**20.04.2017**

(97)

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

**27.02.2019**

(86)

Kansainvälinen hakemus - Internationell  
ansökan - International application

**20.04.2017 PCT/EP2017059443**

(30)

Etuoikeus - Prioritet - Priority

21.04.2016 US US201662325584 P

(73)

Haltija - Innehavare - Holder

**1• Astrazeneca AB , 151 85 Södertälje , (SE)**

(72)

Keksijä - Uppfinnare - Inventor

**1• AL HUSBAN, Farhan Abdel Karim Mohammad , AstraZeneca Redesmere F42B Silk Road Business Park Charter Way , Macclesfield  
Cheshire SK10 2NA , (GB)**

**2• GLAD, Lars Håkan Christer , AstraZeneca , SE-431 83 Mölndal , (SE)**

**3• HALLSTEIN, Jenny Malin Christina , Västra Eklanda Höjd 23 , SE-431 59 Mölndal , (SE)**

**4• MOIR, Andrea Jane , AstraZeneca Redesmere UG18 Silk Road Business Park , Macclesfield Cheshire SK10 2NA , (GB)**

**5• THOMPSON, Michael Peter , 7 Calderbrook Court Meadowbrook Way , Cheadle Hulme Cheshire SK8 5NX , (GB)**

(74)

Asiamies - Ombud - Agent

**Leitzinger Oy , c/o Spaces Mannerheiminaukio 1A , 00100 Helsinki , (FI)**

(54)

Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

**SUUSSA HAJOAVAT TABLETIT**

**ORALLY DISINTEGRATING TABLETS**

## Patenttivaatimukset

### 1. Tabletti, joka sisältää:

- 5 (1*S*,2*S*,3*R*,5*S*)-3-[7-{{[(1*R*,2*S*)-2-(3,4-difluorifenyyli)syklopropyyli]amino}-5-(propyyli-  
tio)-3*H*[1,2,3]-triatsolo[4,5-*d*]pyrimidin-3-yyli]-5-(2-hydroksietoksi)syklo-  
pentaani-1,2-diolia 10-18 % prosenttia tabletin painosta;  
hydroksipropyyliselluloosaa 0,9-2 % tabletin painosta;  
kolloidista vedetöntä piidioksidia 0,5-1 % tabletin painosta;  
mannitolia 47-67 % tabletin painosta;  
10 ksylitolia 2,5-4 % tabletin painosta;  
vedetöntä kaksimäksistä kalsiumfosfaattia 2-3,5 % tabletin painosta;  
mikrokiteistä selluloosaa 9-15 % tabletin painosta;  
krospovidonia 5-9 % tabletin painosta; ja  
natriumstearyylifumaraattia 1-2 % tabletin painosta;  
15 jolloin tabletilla on kovuus, joka on 50-150 N ja hajoamisaika, joka on alle 60 sekun-  
tia USA:n farmakopean monografiassa 701 esitettyä menetelmää käyttäen mitat-  
tuna.

### 2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen tabletti, jossa tabletti sisältää noin 60 mg

- 20 (1*S*,2*S*,3*R*,5*S*)-3-[7-{{[(1*R*,2*S*)-2-(3,4-difluorifenyyli)syklopropyyli]amino}-5-(propyyli-  
tio)-3*H*[1,2,3]-triatsolo[4,5-*d*]pyrimidin-3-yyli]-5-(2-hydroksietoksi)syklopentaani-  
1,2-diolia.

### 3. Patenttivaatimuksen 1 mukainen tabletti, jossa tabletti sisältää noin 90 mg

- 25 (1*S*,2*S*,3*R*,5*S*)-3-[7-{{[(1*R*,2*S*)-2-(3,4-difluorifenyyli)syklopropyyli]amino}-5-(propyyli-  
tio)-3*H*[1,2,3]-triatsolo[4,5-*d*]pyrimidin-3-yyli]-5-(2-hydroksietoksi)syklopentaani-  
1,2-diolia.

### 4. Jonkin edeltävistä patenttivaatimuksista mukainen tabletti, jossa tabletilla on ko-

- 30 vuus, joka on 55–90 N.

### 5. Jonkin edeltävistä patenttivaatimuksista mukainen tabletti, jossa (1*S*,2*S*,3*R*,5*S*)-3- [7-{{[(1*R*,2*S*)-2-(3,4-difluorifenyyli)syklopropyyli]amino}-5-(propyyli- tio)-3*H*[1,2,3]-

triatsolo[4,5-*d*]pyrimidin-3-yyli]-5-(2-hydroksietoksi)syklopentaani-1,2-dioli on olennaisesti läsnä polymorfi II:n muodossa.

5 **6.** Jonkin patenttivaatimuksista 1–4 mukainen tabletti, jossa (1*S*,2*S*,3*R*,5*S*)-3-[7-  
{[(1*R*,2*S*)-2-(3,4-difluorifenyyli)syklopropyyli]amino}-5-(propyyli)-3*H*]-1,2,3]-triatsolo[4,5-*d*]pyrimidin-3-yyli]-5-(2-hydroksietoksi)syklopentaani-1,2-dioli on olennaisesti läsnä polymorfi III:n muodossa.

10 **7.** Menetelmä jossakin edeltävistä patenttivaatimuksista määritellyn tabletin valmistamiseksi, joka menetelmä käsittää vaiheen, jossa sekoitetaan yhteen  
(1*S*,2*S*,3*R*,5*S*)-3-[7-  
{[(1*R*,2*S*)-2-(3,4-difluorifenyyli)syklopropyyli]amino}-5-(propyyli)-3*H*]-1,2,3]-triatsolo[4,5-*d*]pyrimidin-3-yyli]-5-(2-hydroksietoksi)syklopentaani-1,2-diolia ja kolloidista vedetöntä piidioksidia yhdessä nesteen kanssa tai nesteessä siten märkägranulaatin aikaansaaden.

15

**8.** Jossakin patenttivaatimuksista 1–6 määritelty tabletti käytettäväksi hoidettaessa tai ehkäistessä aterotromboottisia tapahtumia potilaassa, jolla on sydän- ja verisuonitauti, valinnaisesti jolloin aterotromboottiset tapahtumat valitaan ryhmästä, joka koostuu sydän- ja verisuoniperäisestä kuolemasta, sydäninfarktista, aivohalvauksesta ja ääreisvaltimotaudista.

20

**9.** Jossakin patenttivaatimuksista 1–6 määritelty tabletti käytettäväksi hoidettaessa tai ehkäistessä stentitromboosia potilaassa, jolle on asennettu stentti akuutin sepelvaltimo-oireyhtymän hoitamiseksi.

25

**10.** Tabletti käytettäväksi patenttivaatimuksen 8 tai 9 mukaisesti, jolloin käyttöön sisältyy mainitun tabletin antaminen vanhuspotilaaseen tai potilaaseen, jolla on ollut sydäninfarkti tai aivohalvaus.