

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

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

(10)

FI/EP2464337 T4

(12)

**MUUTETUSSA MUODOSSA HYVÄKSYTYN EUROOPPAPATENTIN
KÄÄNNÖS
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT I ÄNDRAD FORM
TRANSLATION OF AMENDED EUROPEAN PATENT
SPECIFICATION**

(45)

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

18.07.2024

(97)

Muutetussa muodossa hyväksytyn Eurooppapatentin
myöntämispäivä - Meddelandedatum för det europeiska
patentet i ändrad form - Date of grant of amended European
patent

26.06.2024

(51)

Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -
International patent classification

A61K 9/14 (2006 . 01)

A61K 31/47 (2006 . 01)

A61P 19/10 (2006 . 01)

A61P 19/00 (2006 . 01)

A61P 43/00 (2006 . 01)

A61K 45/06 (2006 . 01)

A61K 31/44 (2006 . 01)

(96)

Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan -
European patent application

EP10708442.8

(22)

Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date

18.02.2010

(97)

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

20.06.2012

(86)

Kansainvälinen hakemus - Internationell
ansökan - International application

18.02.2010 PCT/US2010024609

(30)

Etuoikeus - Prioritet - Priority

13.08.2009 WO PCT/US2009/000462

13.08.2009 US 583066

(73)

Haltija - Innehavare - Holder

1 • Vertex Pharmaceuticals Incorporated , 50 Northern Avenue , Boston, MA 02210 , (US)

(72)

Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1 • ROWE, William , 770 Highland Avenue , Medford MA 02155 , (US)

2 • HURTER, Patricia , 49 Tahanto Trail , Harvard MA 01451 , (US)

3 • YOUNG, Christopher, R. , 42 Francis Street Unit 1 , Waltham MA 02451 , (US)

4 • DINEHART, Kirk , 60 Hemlock Drive , Holliston MA 01746 , (US)

5 • VERWIJS, Marinus, Jacobus , 4 Carter Drive , Framingham MA 01701 , (US)

6 • OVERHOFF, Kirk , 47 Alder Street 25 , Waltham MA 02453 , (US)

7 • GROOTENHUIS, Peter, D. J. , 4801 Riding Ridge Road , San Diego CA 92130 , (US)

8 • BOTFIELD, Martyn , 47 Walden Terrace , Concord MA 01742 , (US)

9 • GROSSI, Alfredo , 102 Tern Hills Road , Somerville MA 02145 , (US)

10 • ZLOKARNIK, Gregor , 2754 Palomino Circle , La Jolla CA 92037 , (US)

11 • VAN GOOR, Fredrick F. , 832 Ormond Court , San Diego CA 92109 , (US)

(74)

Asiamies - Ombud - Agent

Boco IP Oy Ab , Kansakoulukatu 3 , 00100 Helsinki , (FI)

(54)

Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

**N-[2,4-bis(1,1-dimetyylietyyli)-5-hydroksifenyyli]-1,4-dihydro-4-oksoinoliini-3-karboksamidin tablettiformulaatio
KÄYTETTÄVÄKSI KYSTISEN FIBROOSIN HOITAMISESSA**

**Tablettformulering av N-[2,4-bis(1,1-dimetyyletyl)-5-hydroxifenyl]-1,4-dihydro-4-oxokinolin-3-karboxamid för användning vid
behandling av cystisk fibros**

**Tablet formulation of N-[2,4-bis(1,1-dimethylethyl)-5-hydroxyphenyl]-1,4-dihydro-4-oxoquinoline-3-carboxamide for use in the
treatment of cystic fibrosis**

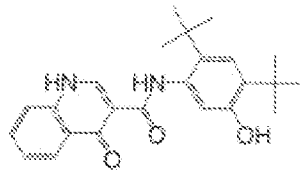
(56)

Viitejulkaisut - Anförda publikationer - References cited

WO-A2-2007/079139; WO-A2-2009/023509; WO-A2-2010/019239;

N-[2,4-BIS(1,1-DIMETYYLIETYYLI)-5-HYDROKSIFENYyli]-1,4-DIHYDRO-4-OKSOKINOLIINI-3-KARBOKSAMIDIN TABLETTIFORMULAATIO KÄYTETTÄVÄKSI KYSTISEN FIBROOSIN HOITAMISESSA

1. Farmaseuttinen koostumus, joka käsittää noin 34,1 paino-% kiinteää dispersiota koostumuksen painosta, jossa dispersio käsittää 80 paino-% olennaisesti amorfista tai amorfista N-[2,4-bis(1,1-dimetyylietyyli)-5-hydroksifenyyli]-1,4-dihydro-4-oksokinoliini-3-karboksamidia (Yhdiste 1)



Yhdiste 1

- dispersion painosta, 19,5 paino-% HPMCAS:a dispersion painosta ja 0,5 paino-% SLS:a dispersi-
on painosta; noin 30,5 paino-% mikrokiteistä selluloosaa koostumuksen painosta; noin 30,4 paino-
% laktoosia koostumuksen painosta; noin 3 paino-% natriumkroscarmelloosia koostumuksen pai-
nosta; noin 0,5 paino-% SLS:a koostumuksen painosta; noin 0,5 paino-% kolloidista piidioksidia
koostumuksen painosta; noin 1 paino-% magnesiumstearaattia koostumuksen painosta;

jossa farmaseuttinen koostumus valmistetaan tabletkiksi;

- 15 käytettäväksi kystisen fibroosin hoitamisessa tai vakavuuden lieventämisessä potilaassa;

jossa mainittu käyttö käsittää farmaseuttisen koostumuksen annostelun samanaikaisesti, ennem-
min tai myöhemmin kuin yksi tai useampi muu haluttu lääkeaine;

jossa potilaalla on kystisen fibroosin transmembraaninen reseptori (CFTR) ΔF508-mutaatiolla mo-
lemmissa alleeleissa; ja

- 20 jossa muu haluttu lääkeaine on CFTR-modulaattori, joka on muu kuin Yhdiste 1.

2. Farmaseuttinen koostumus käytettäväksi patenttivaatimuksen 1 mukaisesti, jossa farmaseutti-
nen koostumus sisältää 150 mg Yhdistettä 1.

3. Farmaseuttinen koostumus käytettäväksi patenttivaatimuksen 1 mukaisesti, jossa farmaseutti-
nen koostumus sisältää 100 mg Yhdistettä 1.

4. Farmaseuttinen koostumus käytettäväksi patenttivaatimuksen 1 mukaisesti, jossa muu haluttu lääkeaine on (3-(6-(1-(2,2-difluoribentso[d][1,3]dioksol-5-yyli)syklopropanikarboksamido)-3-metyylipyridin-2-yyli)bentsoehappoa.