

(19)



REPUBLIKA SLOVENIJA
MINISTRSTVO ZA GOSPODARSKI RAZVOJ IN TEHNOLOGIJO
URAD RS ZA INTELAKTUALNO LASTNINO

(10)

SI/EP 1436012 T1

(12)

PREVOD ZAHTEVKOV EVROPSKEGA PATENTA

(21) Številka predmeta: **200231089**

(51) Int. Cl. (2017.01)

(22) Datum prijave: **18.10.2002**

A61K 47/00

(46) Datum objave prevoda zahtevkov:

30.03.2018

(96) Evropska patentna prijava:

18.10.2002 EP 02795531.9

(30) Prednostna pravica:

18.10.2001 US 330400 P

(87) Objava mednarodne patentne prijave:

WO 2003/032990, 24.04.2003

(86) Mednarodna patentna prijava:

18.10.2002 WO PCT/US2002/033325

(97) Objava evropskega patenta:

EP 1436012 B1, 20.12.2017

(72) Izumitelji: **BENTLEY Michael David, Huntsville, AL 35801, US;**
ROBERTS Michael James, Charlotte, NC 28277, US;
SHEN Xiaoming, Millbrae, CA 94030, US;
CHENG Lin, Sunnyvale, CA 94085, US

(73) Imetnik: **Nektar Therapeutics,**
455 Mission Bay Boulevard South, Suite 100, San Francisco, CA 94158, US

(74) Zastopnik: **Patentna pisarna d.o.o., Čopova 14, p.p. 1725, 1001 Ljubljana, SI**

(54) **POLIMERNI KONJUGATI OPIOIDNIH ANTAGONISTOV**

SI/EP 1436012 T1

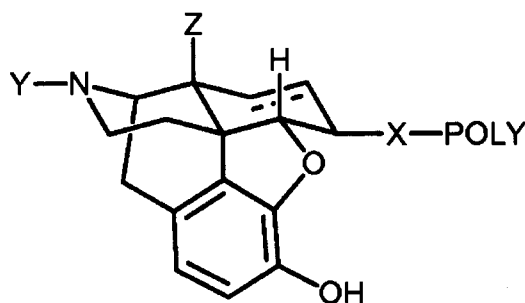
EP 1 436 012 B1

Polimerni konjugati opioidnih antagonistov

Patentni zahtevki

1. Farmacevtski sestavek, ki obsega:

polimerni konjugat ali njegovo farmacevtsko sprejemljivo sol, ki obsega poli(etilen glikolni) polimer, kovalentno vezan na opioidni antagonist, kjer je molekulska masa polimera manj kot 2000 Da, in farmacevtsko sprejemljiv nosilec, kjer ima polimerni konjugat strukturo



kjer:

POLY je poli(etilen glikolni) polimer;

X je hidrolitično stabilna vez;

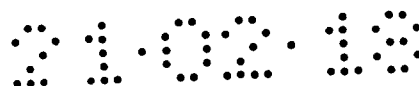
Y je alil;

Z je H ali OH; in

črtkana črta predstavlja po izbiri dvojno vez.

2. Farmacevtski sestavek po zahtevku 1, kjer je opioidni antagonist nalokson.

3. Farmacevtski sestavek po zahtevku 1, kjer je hidrolitično stabilna vez izbrana iz skupine, ki jo sestavljajo amid, amin, karbamat, eter, tioeter in sečnina.



4. Farmacevtski sestavek po zahtevku 1, kjer je molekulska masa polimera manj kot okoli 1000 Da.
5. Farmacevtski sestavek po zahtevku 1, kjer je molekulska masa polimera manj kot okoli 800 Da.
6. Farmacevtski sestavek po zahtevku 1, kjer
X je $-\text{NH}-(\text{CHR}_0)_m-\text{O}-$ ali $-\text{NH}-\text{C}(\text{O})-(\text{CHR}_0)_m-\text{O}-$,
m ali n je 1–12, in
vsak R_0 je neodvisno H ali C_1-C_6 alkil.
7. Farmacevtski sestavek po zahtevku 1, kjer je X heteroatom.
8. Farmacevtski sestavek po zahtevku 1, ki nadalje obsega opioidni agonist.
9. Farmacevtski sestavek po zahtevku 8, kjer je opioidni agonist izbran iz skupine, ki jo sestavljajo alfentanil, bremazocin, buprenorfin, butorfanol, kodein, ciklazocin, dezocin, diacetilmorfin, dihidrokodein, fentanil, hidrokodon, hidromorfon, levorfanol, meperidin (petidin), metadon, morfin, nalbufin, noskapin, oksikodon, oksimorfon, papaverin, pentazocin, petidin, fenazocin, propiram, propoksifen, sufentanil, tebain in tramadol.
10. Farmacevtski sestavek po zahtevku 1 za uporabo v zdravljenju stranskega učinka, ki je rezultat dajanja opioidnega agonista sesalcu.
11. Farmacevtski sestavek po zahtevku 10, kjer je stranski učinek izbran iz skupine, ki jo sestavljajo navzeja, konstipacija in pruritus.
12. Farmacevtski sestavek po zahtevku 10, kjer se farmacevtski sestavek daje oralno.

13. Farmacevtski sestavek po zahtevku 10, kjer se farmacevtski sestavek daje skupaj z opioidnim agonistom.
14. Farmacevtski sestavek po zahtevku 13, kjer sta polimerni konjugat in opioidni agonist formulirana v enkratni odmerni enoti.