



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20231667 T1

HR P20231667 T1

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

(51) MKP:

A61K 47/34 (2017.01)
A61K 9/00 (2006.01)
A61K 31/445 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 15.03.2024.

(21) Broj predmeta: P20231667T

(22) Datum podnošenja: 08.01.2020.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2020050333
Datum podnošenja međunarodne prijave: 08.01.2020.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 20700453.2
Datum podnošenja europske prijave patenta: 08.01.2020.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2020144239
Datum međunarodne objave: 16.07.2020.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3908321 A1
Datum objave europske prijave patenta: 17.11.2021.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3908321 B1
Datum objave europskog patenta: 15.11.2023.

(31) Broj prve prijave: 201900258

(32) Datum podnošenja prve prijave: 08.01.2019.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: GB

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelji:

MedinCell S.A., 3 rue des frères Lumière, 34830 Jacou, FR
Christophe Roberge, c/o MedinCell, 3 rue des Frères Lumière, 34830 Jacou, FR
Adolfo Lopez Noriega, c/o MedinCell, 3 rue des Frères Lumière, 34830 Jacou, FR
Jean Manuel Cros, c/o MedinCell, 3 rue des Frères Lumière, 34830 Jacou, FR
Juliette Serindoux, c/o MedinCell, 3 rue des Frères Lumière, 34830 Jacou, FR
Murielle Oster, c/o MedinCell, 3 rue des Frères Lumière, 34830 Jacou, FR
Fang Liu, c/o MedinCell, 3 rue des Frères Lumière, 34830 Jacou, FR
Charlotte Molinier, c/o MedinCell, 3 rue des Frères Lumière, 34830 Jacou, FR
Sylvestre Grizot, c/o MedinCell, 3 rue des Frères Lumière, 34830 Jacou, FR
Tjasa Vrlinic, c/o MedinCell, 3 rue des Frères Lumière, 34830 Jacou, FR
Feifei Ng, c/o MedinCell, 3 rue des Frères Lumière, 34830 Jacou, FR
Elise Guégain, c/o MedinCell, 3 rue des Frères Lumière, 34830 Jacou, FR
Marie-Emérentienne Cagnon, c/o MedinCell, 3 rue des Frères Lumière, 34830 Jacou, FR

(74) Zastupnik:

PRODUCTA d.o.o., 10000 Zagreb, HR

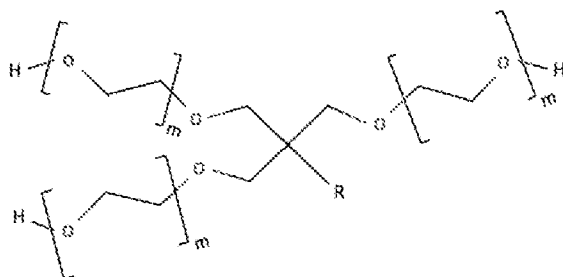
(54) Naziv izuma:

FARMACEUTSKI PRIPRAVAK

HR P20231667 T1

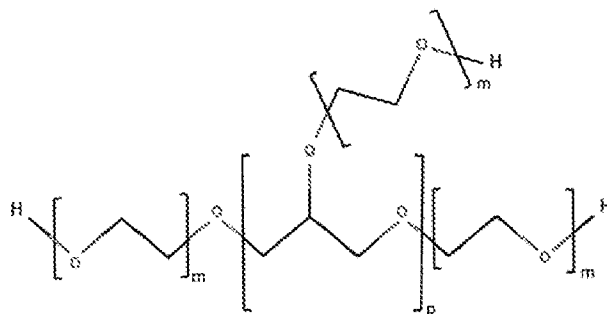
PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Farmaceutski pripravak koji sadrži:
najmanje jedan farmaceutski aktivni sastojak i biorazgradivi višestruko razgranati kopolimer koji sadrži najmanje tri poliesterska kraka pričvršćena na središnju jezgru koja sadrži polieter, pri čemu je višestruko razgranati kopolimer uglavnom netopljiv u vodenoj otopini i može se dobiti reakcijom višestruko razgranatog polietera s D,L-laktidom, a višestruko razgranati polieter se može izvesti iz poli(etilen glikola) (PEG) i poliola.
2. Pripravak prema zahtjevu 1, naznačen time što je molekularna težina polietera 10 kDa ili manje, poželjno 5 kDa ili manje, 4 kDa ili manje, 3 kDa ili manje, ili 2 kDa ili manje, ili 1 kDa ili manje, ili 0,5 kDa ili manje.
3. Farmaceutski pripravak naznačen time što sadrži:
najmanje jedan farmaceutski aktivni sastojak i biorazgradivi višestruko razgranati kopolimer koji sadrži najmanje tri poliesterska kraka pričvršćena na središnju jezgru koja sadrži polieter, pri čemu se višestruko razgranati kopolimer može dobiti reakcijom višestruko razgranatog polietera s D,L-laktidom, a višestruko razgranati polieter se može izvesti iz poli(etilen glikola) (PEG) i poliola, te pri čemu molekularna težina polietera iznosi 10 kDa ili manje, poželjno 5 kDa ili manje, 4 kDa ili manje, 3 kDa ili manje, ili 2 kDa ili manje, ili 1 kDa ili manje, ili 0,5 kDa ili manje.
4. Pripravak prema zahtjevu 3, naznačen time što je višestruko razgranati kopolimer uglavnom netopljiv u vodenoj otopini.
5. Pripravak prema bilo kojem prethodnom zahtjevu, naznačen time što višestruko razgranati kopolimer ima topljivost u vodenoj otopini manju od 15 mg/mL, po izboru manju od 10 mg/mL, manju od 5 g/mL, manju od 2 mg/mL, ili manju od 1 mg/mL, po izboru pri čemu se topljivost u vodi mjeri na 37°C.
6. Pripravak prema bilo kojem prethodnom zahtjevu naznačen time što je prikladan za stvaranje depo pripravka na licu mjesta.
7. Pripravak prema bilo kojem prethodnom zahtjevu, naznačen time što višestruko razgranati kopolimer ima formulu $A(B)_n$ pri čemu A predstavlja središnju jezgru i B predstavlja poliesterske krakove i n je cijeli broj od najmanje 3, po izboru pri čemu je n najmanje 4, ili najmanje 6, ili najmanje 8, poželjno gdje n je 4.
8. Pripravak prema bilo kojem prethodnom zahtjevu, naznačen time što poliol sadrži najmanje tri hidroksilne skupine, po izboru pri čemu je poliol ugljikovodik supstituiran s najmanje tri hidroksilne skupine, po izboru 3, 4, 5, 6, ili 8 hidroksilnih skupina, po izboru pri čemu poliol nadalje sadrži jednu ili više eterskih skupina.
9. Pripravak prema zahtjevu 8, naznačen time što poliol je pentaeritritol (PE), dipentaeritritol (DPE), trimetilolpropan (TMP), glicerol, heksaglicerol, eritritol, ksilitol, di(trimetilolpropan) (diTMP), sorbitol, ili inozitol.
10. Pripravak prema zahtjevu 8 ili zahtjevu 9 naznačen time što svaki ogranak višestruko razgranatog polietera ima terminalnu reaktivnu skupinu sposobnu reagirati s poliesterom ili monomerom ili njegovim prekursorom, po izboru pri čemu je terminalna reaktivna skupina hidroksilna skupina.
11. Pripravak prema bilo kojem od zahtjeva 8 do 10, naznačen time što višestruko razgranati polieter ima Formulu 1 ili Formulu 2 ili Formulu 3 ili Formulu 4:



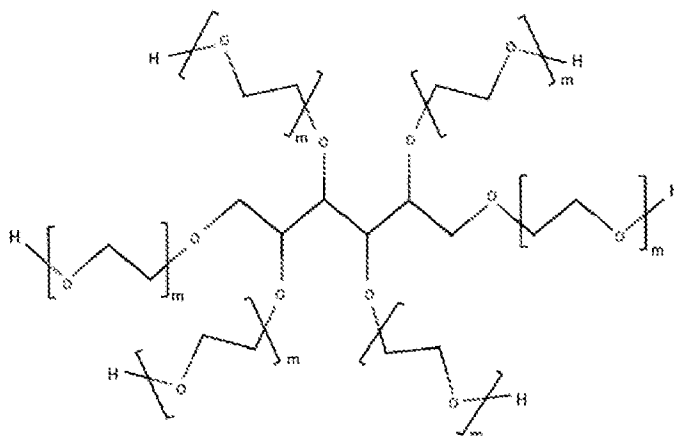
pri čemu je m cijeli broj između 2 i 150,
R je H ili alkil ili PEG

Formula 1



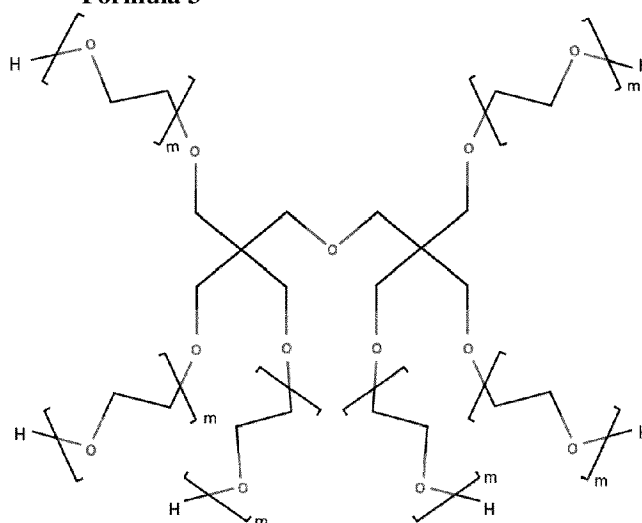
pri čemu je m cijeli broj između 2 i 150 i p je 6,

Formula 2



pri čemu je m cijeli broj između 2 i 150

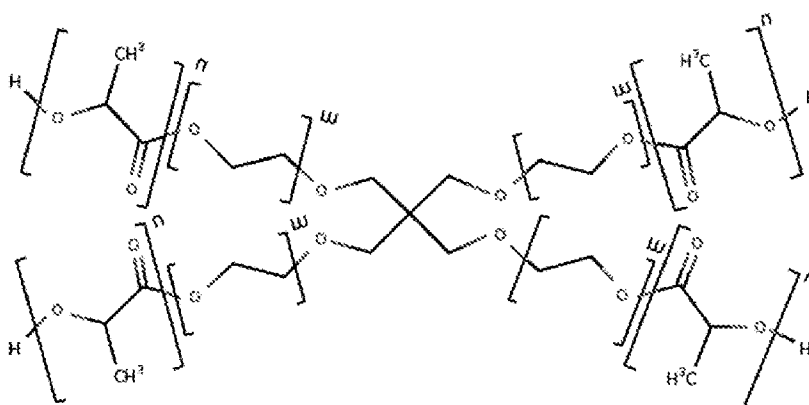
Formula 3



pri čemu je m cijeli broj između 2 i 150

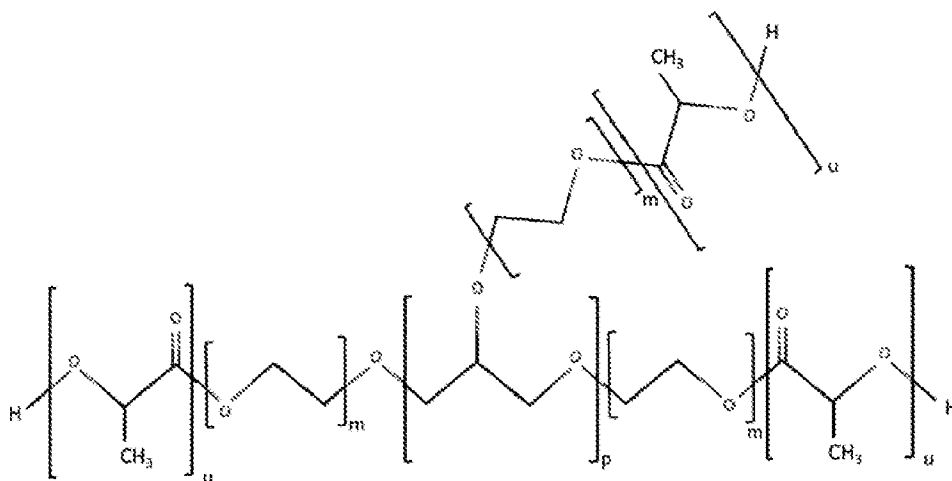
Formula 4

12. Pripravak prema bilo kojem prethodnom zahtjevu, naznačen time što se višestruko razgranati kopolimer može dobiti polimerizacijom otvaranja prstena D,L-laktida iniciranom višestruko razgranatim polieterom.
13. Pripravak prema zahtjevu 12, naznačen time što višestruko razgranati kopolimer ima Formulu 5 ili Formulu 6 ili Formulu 7 ili Formulu 8:

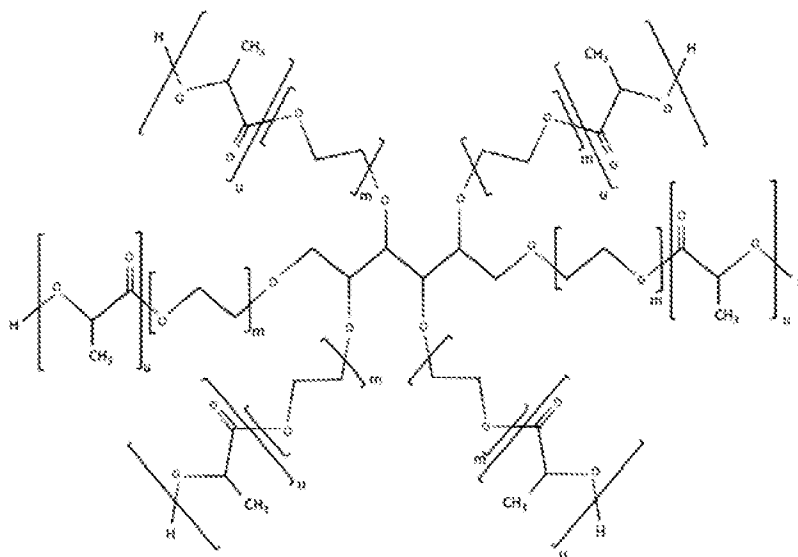


pri čemu je u cijeli broj između 4 do 200 i m je cijeli broj između 2 i 150

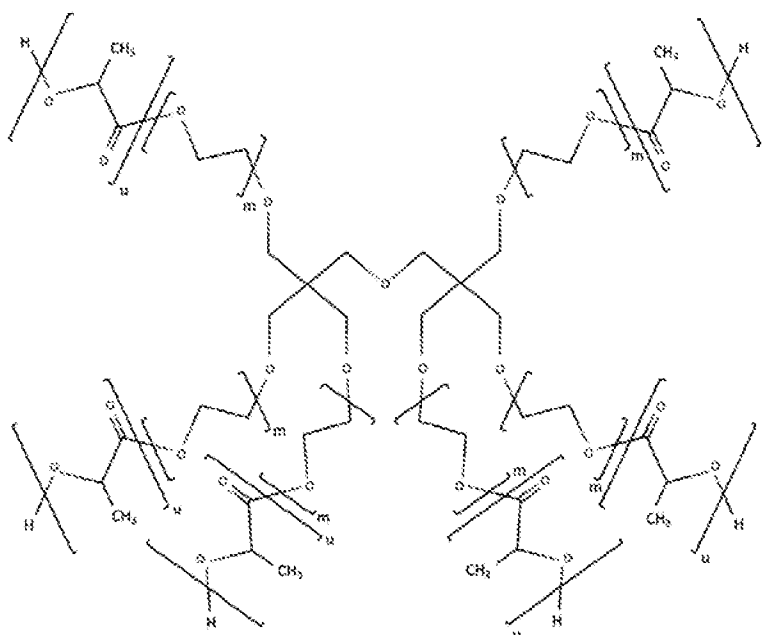
Formula 5



pri čemu je u cijeli broj između 4 do 200 i m je cijeli broj između 2 i 150 i p je 6,
Formula 6



5
 pri čemu je u cijeli broj između 4 do 200 i m je cijeli broj između 2 i 150,
Formula 7



pri čemu je u cijeli broj između 4 do 200 i m je cijeli broj između 2 i 150

Formula 8

14. Pripravak prema zahtjevu 13 naznačen time što višestruko razgranati kopolimer ima Formulu 5, polieterska jezgra ima molekularnu težinu od 2 kDa i molarni omjer esterske ponavljajuće jedinice prema etilen oksidu iznosi 2, 3 ili 6.
15. Pripravak prema bilo kojem prethodnom zahtjevu, naznačen time što je broj poliesterskih ponavljajućih jedinica u svakom kraku neovisno u rasponu od 4 do 200; i/ili pri čemu je molekularna težina polietera u rasponu od 0,5 kDa do 10 kDa, po izboru 1 kDa do 10 kDa poželjno 2 kDa do 10 kDa, ili poželjno 0,5 kDa do 2 kDa, ili najpoželjnije 2 kDa do 5 kDa; i/ili pri čemu je molarni omjer esterske ponavljajuće jedinice prema etilen oksidu višestruko razgranatog kopolimera u pripravku od 1 do 10, poželjno od 2 do 6.
16. Pripravak prema bilo kojem prethodnom zahtjevu, naznačen time što sadrži jedan ili više daljnjih biorazgradivih višestruko razgranatih kopolimera kako je definirano u bilo kojem prethodnom zahtjevu, po izboru koji sadrže prvi biorazgradivi višestruko razgranati kopolimer kao što je definiran u bilo kojem prethodnom zahtjevu i drugi različiti biorazgradivi višestruko razgranati kopolimer kao što je definiran u bilo kojem prethodnom zahtjevu, po izboru pri čemu je prvi biorazgradivi višestruko razgranati kopolimer prisutan u količini od 15 do 25 (m/m%) i drugi biorazgradivi višestruko razgranati kopolimer je prisutan u količini od 15 do 25 (m/m%) ukupnog pripravka.
17. Pripravak prema bilo kojem prethodnom zahtjevu naznačen time što nadalje sadrži biorazgradivi triblok kopolimer koji ima formulu:

$$Av-Bw-Ax$$

pri čemu je A poliester, a B je polietilen glikol, a v i x su broj ponavljajućih jedinica u rasponu od 1 do 3000 i w je broj ponavljajućih jedinica u rasponu od 3 do 300 i $v \neq x$; po izboru pri čemu je masa lanca polietilen glikola u rasponu od 180 Da do 12 kDa ili 194 Da do 12 kDa ili 200 Da do 12 kDa ili od 100 Da do 4 kDa, poželjno 1 kDa do 2 kDa; i/ili pri čemu je molarni omjer esterske ponavljajuće jedinice prema ponavljajućoj jedinici etilen oksida u triblok kopolimeru od 0,5 do 22,3, po izboru 0,5 do 10, poželjno 0,5 do 3,5.

18. Pripravak prema bilo kojem prethodnom zahtjevu naznačen time što nadalje sadrži biorazgradivi diblok kopolimer koji ima formulu:

$$C_y-A_z$$

pri čemu je A poliester, a C je polietilen glikol zatvoren na krajevima i y i z su broj ponavljajućih jedinica sa y u rasponu od 2 do 250 i z u rasponu od 1 do 3,000; po izboru pri čemu je molekularna težina lanca polietilen glikola zatvorenog na krajevima u rasponu od 100 Da do 10 kDa ili 164 Da do 2 kDa, poželjno 1 kDa do 2 kDa; i/ili pri čemu je molarni omjer esterske ponavljajuće jedinice prema ponavljajućoj jedinici etilen oksida u diblok kopolimeru od 0,8 do 15, po izboru 1 do 10.

19. Pripravak prema bilo kojem od zahtjeva 17 ili 18 naznačen time što je navedeni poliester A u triblok ili diblok kopolimeru odabran iz skupine koju čine polimljična kiselina (PLA), poliglikolna kiselina, polikaprolakton, polietilen adipat, polihidroksialkanoat, poli(ε-kaprolakton-kolaktid) (PCLA), poli(mljična-ko-glikolna kiselina) (PLGA) i njihove smjese i po izboru pri čemu je polietilen glikol zatvoren na krajevima metoksi polietilen glikol.
20. Pripravak prema bilo kojem prethodnom zahtjevu, naznačen time što nadalje sadrži farmaceutski prihvatljiv vehikulum, po izboru pri čemu je farmaceutski prihvatljiv vehikulum organsko otapalo, po izboru pri čemu je organsko otapalo biokompatibilno organsko otapalo, po izboru pri čemu je količina navedenog vehikuluma najmanje 25%, ili najmanje 35% (m/m%) ukupnog pripravka, po izboru pri čemu je farmaceutski prihvatljiv vehikulum odabran iz skupine koju čine: benzil alkohol, benzil benzoat, dimetil izosorbid (DMI), dimetil sulfoksid (DMSO), etil acetat, etil benzoat, etil laktat, glicerol formal, metil etil keton, metil izobutil keton, N-etil-2-pirolidon, N-metil-2-pirolidinon (NMP), pirolidon-2, tetraglikol, triacetin, tributirin, tripropionin, glikofurol, i njihove smjese.
21. Pripravak prema bilo kojem prethodnom zahtjevu, naznačen time što je farmaceutski aktivni sastojak hidrofoban; i/ili pri čemu je farmaceutski aktivni sastojak meloksikam, bupivakain, tamsulozin, oktreotid, tadalafil, empagliflozin, tenofovir, liotironin ili njihove kombinacije.
22. Pripravak prema bilo kojem prethodnom zahtjevu, naznačen time što je najmanje jedan farmaceutski aktivni sastojak prisutan u količini od 0,05 % do 60%, po izboru 0,05% do 40%, po izboru 0,05% do 30%, po izboru 0,05% do 10%, po izboru 0,05% do 7%, po izboru 0,05% do 2% (m/m%) ukupnog pripravka; i/ili pri čemu je pripravak tekućina za injekciju; i/ili pri čemu je višestruko razgranati kopolimer prisutan u količini od 2% do 80%, po izboru 2% do 70%, po izboru 2% do 60%, po izboru 10% do 60%, po izboru 10% do 50%, po izboru 20% do 40%, po izboru 20% do 35%, po izboru 30% do 50% (m/m%) ukupnog pripravka; i/ili koji je pripravak definiran u Tablici 1 ili Tablici 4; i/ili koji je prikladan za isporuku farmaceutski aktivnog sastojka subjektu tijekom najmanje 1 dana, po izboru najmanje 3 dana, po izboru najmanje 7 dana, po izboru najmanje 30 dana, po izboru najmanje 90 dana, po izboru najmanje 1 godine.
23. Pripravak kako je definiran u bilo kojem prethodnom zahtjevu, naznačen time što se koristi kao lijek.
24. Postupak za proizvodnju farmaceutskog pripravka prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 22, naznačen time što navedeni postupak uključuje otapanje višestruko razgranatog kopolimera kako je definirano u bilo kojem od zahtjeva 1 do 22 u farmaceutski prihvatljivom nosaču, i naknadno dodavanje farmaceutski aktivnog sastojka u pripravak.
25. Biorazgradivi depo pripravak koji se proizvodi *ex vivo* dovodenjem u kontakt pripravka kako je definiran u bilo kojem od zahtjeva 1 do 22 s vodenim medijem, vodom ili tjelesnom tekućinom.