



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20201998 T1



HR P20201998 T1

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

(51) MKP:

A61K 47/56 (2017.01)

A61K 47/65 (2017.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 05.02.2021.

(21) Broj predmeta: P20201998T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 14.12.2020.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/AU2012000647
Datum podnošenja međunarodne prijave: 06.06.2012.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 12797060.6
Datum podnošenja europske prijave patenta: 06.06.2012.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2012167309
Datum međunarodne objave: 13.12.2012.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2729179 A1
Datum objave europske prijave patenta: 14.05.2014.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2729179 B1
Datum objave europskog patenta: 23.09.2020.

(31) Broj prve prijave: 201161493886 P (32) Datum podnošenja prve prijave: 06.06.2011. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelji:

Starpharma Pty Ltd, PO Box 2022, Preston, VI 3067, AU
David Owen, 4 Leonard Court, Vermont South, VI 3133, AU
Brian Devlin Kelly, 3 Scenic Drive, Ringwood East, VI 3135, AU
Peter Karellas, 155 Nicholson Street, Coburg, VI 3058, AU

(74) Zastupnik:

Odvjetnik Tomislav Hadžija, u suradnji sa DENNEMEYER & ASSOCIATES,
BCI- Business Center International - 1. kat, 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma:

MAKROMOLEKULE

HR P20201998 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Makromolekula koja obuhvaća:

(i) dendrimer koji obuhvaća jezgru i barem jednu generaciju građevinskih jedinica, krajnja generacija građevinskih jedinica imajući površinske amino skupine naznačene time što su barem dvije različite terminalne skupine kovalentno povezane sa površinom amino skupina dendrimera;

(ii) prvu terminalnu skupinu koja je ostatak farmaceutski aktivnog agensa koji obuhvaća hidroksil skupinu;

(iii) drugu terminalnu skupinu koja je agens farmakokinetičke modifikacije;

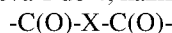
naznačeno time što je prva terminalna skupina kovalentno povezana sa površinom amino skupine dendrimera putem diacidnog veznika, diacidni veznik obuhvaća osnovicu koja sadrži jedan ili više atoma kisika, sumpora ili dušika; naznačeno time što diacidni veznik oblikuje estersku vezu s hidroksilnom skupinom farmaceutski aktivnog agensa i amidnu vezu s površinskom amino skupinom; ili farmaceutski prihvatljivu sol navedenoga.

2. Makromolekula u skladu sa zahtjevom 1, naznačena time što je agens farmakokinetičke modifikacije polietilen glikol.

3. Makromolekula u skladu sa zahtjevom 2, naznačena time što polietilen glikol ima molekularnu težinu u rasponu od 220 do 1100 Da, ili 1000 do 2500 Da, 1000 - 5500 Da.

4. Makromolekula u skladu sa zahtjevom 3, naznačena time što polietilen glikol ima molekularnu težinu u rasponu od 1000 do 2500 Da.

5. Makromolekula u skladu s bilo kojim od zahtjeva 1 do 4, naznačena time što diacidni veznik ima formulu:



naznačen time što je X $-(CH_2)_s-A-(CH_2)_t-$;

A je odabran od O-, -S-, $-NR_1-$, $-N^+(R_1)_2-$, -S-S-, i $-[OCH_2CH_2]_r-O-$;

R1 je odabran od vodika i C₁-C₄ alkila;

s i t su zasebno odabrani od 1 i 2; i

r je odabran od 1, 2 i 3.

6. Makromolekula u skladu sa zahtjevom 5, naznačena time što je X CH₂-A-CH₂ ili CH₂CH₂-A-CH₂CH₂-.

7. Makromolekula u skladu s bilo kojim od zahtjeva 1 do 6, naznačena time što je diacidni veznik $-C(O)-CH_2OCH_2-C(O)-$, $-C(O)-CH_2SCH_2-C(O)-$, $-C(O)-CH_2NHCH_2-C(O)-$, $-C(O)-CH_2N(CH_3)CH_2-C(O)-$, $-C(O)-CH_2N^+(CH_3)_2CH_2-C(O)-$, $-C(O)-CH_2-S-S-CH_2-C(O)-$ ili $-C(O)-OCH_2CH_2OCH_2CH_2OC(O)-$.

8. Makromolekula u skladu s bilo kojim od zahtjeva 1 do 6, naznačena time što je diacidni veznik $-C(O)-CH_2OCH_2-C(O)-$ ili $-C(O)-CH_2SCH_2-C(O)-$.

9. Makromolekula u skladu s bilo kojim od zahtjeva 1 do 8, naznačena time što je jezgra benzhidrilamid lisina (BHALys).

10. Makromolekula u skladu s bilo kojim od zahtjeva 1 do 9, naznačena time što su građevinske jedinice lisin.

11. Makromolekula u skladu s bilo kojim od zahtjeva 1 do 10, naznačena time što dendrimer ima 4 do 6 generacija građevinskih jedinica.

12. Makromolekula u skladu s bilo kojim od zahtjeva 1 do 11, naznačena time što je dendrimer 5 generacija dendrimera s formulom BHALys[Lys]₂[Lys]₄[Lys]₈[Lys]₁₆[Lys]₃₂.

13. Makromolekula u skladu s bilo kojim od zahtjeva 1 do 12, naznačena time što se primjenjuju jedno ili više od sljedećeg,

i) dendrimer ima 2 do 6 generacija građevinskih jedinica,

ii) dendrimer obuhvaća građevinske jedinice lisina ili analogno lisinu,

iii) makromolekula ima veličinu čestica od manje od 1000 nm, i

iv) makromolekula ima molekularnu težinu od barem 30 kDa.

14. Makromolekula u skladu s bilo kojim od zahtjeva 1 do 13, naznačena time što su prva terminalna skupina i druga terminalna skupina prisutne u omjeru od 1:1.

15. Makromolekula u skladu s bilo kojim od zahtjeva 1 do 14, naznačena time što makromolekula obuhvaća treću terminalnu skupinu koja je blokirajuća skupina, farmaceutski agens ili ciljna skupina.

16. Makromolekula u skladu s bilo kojim od zahtjeva 1 do 15, dalje obuhvaćajući ciljnu skupinu povezanu s funkcionalnom skupinom na jezgri dendrimera, naznačenu time što je ciljni agens odabran od hormona koji ispušta luteinizirajući hormon, analoga hormona koji ispušta luteinizirajući hormon, LYP-1 i antitijela ili fragmenta antitijela.

17. Makromolekula u skladu s bilo kojim od zahtjeva 1 do 16, naznačena time što je farmaceutski aktivan agens onkološki lijek, antiviralno sredstvo ili steroid.

18. Makromolekula u skladu sa zahtjevom 17, naznačena time što je farmaceutski aktivan agens testosteron.

19. Makromolekula u skladu sa zahtjevom 17, naznačena time što je farmaceutski aktivan agens taksan, mimik somatostatina, modulatora receptora estrogena ili analog nukleosida.

20. Makromolekula u skladu sa zahtjevom 17, naznačena time što farmaceutski aktivan agens docetaksel, paklitaksel, kabazitaksel, kamptotekin, irinotekan, topotekan, gemcitabin, fulvestrant, okreotid ili kamptotecin00.

21. Farmaceutski sastav koji obuhvaća makromolekulu prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 20 i farmaceutski prihvatljiv nosač.

5

22. Makromolekula u skladu s bilo kojim od zahtjeva 1 do 20 ili sastav u skladu sa zahtjevom 21 za korištenje u metodi tretmana ili potiskivanja rasta raka, ili smanjivanja toksičnosti ili smanjivanja usputnih djelovanja povezanih s onkološkim lijekom ili formulacijom onkološkog lijeka, ili smanjivanja preosjetljivosti subjekta kod tretmana onkološkim lijekom ili formulacijom onkološkog lijeka, u kojem je farmaceutski aktivan agens onkološki lijek.
23. Makromolekula ili sastav za korištenje u skladu sa zahtjevom 22, naznačena time što se makromolekula ili sastav daju u obliku bolusa ili putem brze infuzije u manje od 30 minuta.
24. Makromolekula ili sastav za korištenje u skladu s bilo kojim od zahtjeva 22 ili 23, naznačena time što se makromolekula ili sastav daju u kombinaciji s drugom terapijom.