

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

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

(10)

FI/EP3706710 T3

(12)

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

(45)

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

08.07.2024

(97)

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

10.04.2024

(51)

Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -
International patent classification

A61K 9/00 (2006 . 01)

A61K 47/10 (2017 . 01)

A61K 45/06 (2006 . 01)

A61P 19/02 (2006 . 01)

A61K 31/443 (2006 . 01)

A61K 31/4465 (2006 . 01)

A61K 8/22 (2006 . 01)

(96)

Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan -
European patent application

EP18807130.2

(22)

Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date

08.11.2018

(97)

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

16.09.2020

(86)

Kansainvälinen hakemus - Internationell
ansökan - International application

08.11.2018 PCT/IB2018058788

(30)

Etuoiikeus - Prioritet - Priority

10.11.2017 US US201762584589 P

10.10.2018 US US201862743864 P

(73)

Haltija - Innehavare - Holder

1• Novartis AG, Lichtstrasse 35, 4056 Basel, (CH)

(72)

Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1• CASTAGNOLI, Carlo, c/o Novartis Pharma AG Postfach, 4002 Basel, (CH)

2• FISCH, Andreas, c/o Novartis Pharma AG Postfach, 4002 Basel, (CH)

3• LORSCHIEDER, Mathilde, c/o Novartis Pharma AG Forum 1 Novartis Campus, 4056 Basel, (CH)

4• NEHARKAR, Manjali Laxman, c/o Novartis Healthcare Pvt. Ltd. Salarpuria-Satta Knowledge City Raidurg Rangareddy District Madhapur,
Hyderabad 500 0181, (IN)

5• RIEBESEHL, Bernd Ulrich, c/o Novartis Pharma AG Postfach, 4002 Basel, (CH)

(74)

Asiamies - Ombud - Agent

Papula Oy, P.O.Box 981, 00101 Helsinki, (FI)

(54)

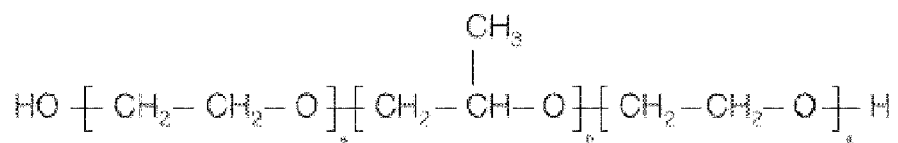
Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

**PITKÄKESTOISESTI VAPAUTUVIA FORMULAATIOITA NIVELENSISÄISIIN KÄYTTÖTARKOITUKSIIN
EXTENDED RELEASE FORMULATIONS FOR INTRA-ARTICULAR APPLICATIONS**

PATENTTIVAATIMUKSET

1. Farmaseuttinen koostumus, joka käsittää seuraavien vesipitoisen suspension: (i) mikrokiteinen N-(3,4-dikloorifenyyli)-3-(pyridin-4-yyli)-7-oksabisyklo[2.2.1]heptaani-2-karboksamidi tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävä suola; ja (ii) pinta-aktiivinen aine,
5 joka käsittää vesiliukoisen kopolymeerin, joka on **tunnettu** > 5 %:n liukoisuudesta veteen 25 °C:ssa.

2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen farmaseuttinen koostumus, jossa mainittu pinta-aktiivinen aine on vesiliukoinen lohkokopolymeeri, jolla on kaava



10 jossa:

a on 75–101; ja

b on 25–60.

3. Patenttivaatimuksen 2 mukainen farmaseuttinen koostumus, jossa mainittu vesiliukoinen lohkokopolymeeri on määritelty edelleen poloksameeri 188:ksi tai
15 poloksameeri 407:ksi.

4. Patenttivaatimuksen 2 tai 3 mukainen farmaseuttinen koostumus, jossa mainitun vesiliukoisen lohkokopolymeerin pitoisuus on vähintään 0,025 paino/tilavuus-%, ja valinnaisesti 0,05–1 paino/tilavuus-%.

5. Patenttivaatimuksen 1 mukainen farmaseuttinen koostumus, jossa mainittu pinta-
20 aktiivinen aine käsittää lisäksi natriumlauryylisulfaattia, jossa valinnaisesti mainitun natriumlauryylisulfaatin pitoisuus on vähintään 0,05 paino/tilavuus-%, ja valinnaisesti 0,05–0,5 paino/tilavuus-%.

6. Jonkin patenttivaatimuksista 1–5 mukainen farmaseuttinen koostumus, joka käsittää lisäksi suspension stabilointiaineen, jossa valinnaisesti mainitun suspension
25 stabilointiaineen pitoisuus on 0,1–10 paino/tilavuus-%.

7. Patenttivaatimuksen 6 mukainen farmaseuttinen koostumus, jossa mainittu suspension stabilointiaine on valittu seuraavista: (i) polyvinyylipyrrolidoni, jonka keskimääräinen molekyylipaino on 1–10 kDa, ja valinnaisesti 2–5 kDa; (ii)

karboksimeetyliselluloosa, jonka keskimääräinen molekyylipaino on 25–2500 kDa, ja valinnaisesti 75–125 kDa; ja (iii) niiden yhdistelmä.

8. Patenttivaatimuksen 7 mukainen farmaseuttinen koostumus, jossa mainitun polyvinyylipyrrolidonin pitoisuus on 1–5 paino/tilavuus-%, ja valinnaisesti noin 2–4 paino/tilavuus-%; ja mainitun karboksimeetyliselluloosan pitoisuus on 0,5–2 % (paino/tilavuus), ja valinnaisesti 0,75–1,5 paino/tilavuus-%.

9. Patenttivaatimuksen 8 mukainen farmaseuttinen koostumus, jossa mainittu polyvinyylipyrrolidoni on määritelty edelleen PVP-12:ksi.

10. Patenttivaatimuksen 1 mukainen farmaseuttinen koostumus, jossa mainittu vesipitoinen suspensio käsittää: (i) 1–400 mg mikrokiteistä N-(3,4-dikloorifenyyli)-3-(pyridin-4-yyli)-7-oksabisyklo[2.2.1]heptaani-2-karboksamidia kohti 1 ml:aa mainittua vesipitoista suspensiota; (ii) 0,05–1 paino/tilavuus-% vesiliukoista lohkokopolymeeriä, jossa valinnaisesti mainittu vesiliukoinen lohkokopolymeeri on poloksameeri 188 tai poloksameeri 407; ja valinnaisesti (iii) 1–5 paino/tilavuus-% polyvinyylipyrrolidonia, jossa valinnaisesti mainittu polyvinyylipyrrolidoni on PVP-K12.

11. Jonkin patenttivaatimuksista 1–10 mukainen farmaseuttinen koostumus, jossa mainittu N-(3,4-dikloorifenyyli)-3-(pyridin-4-yyli)-7-oksabisyklo[2.2.1]heptaani-2-karboksamidi on määritelty edelleen (1R,2R,3S,4S)-N-(3,4-dikloorifenyyli)-3-(pyridin-4-yyli)-7-oksabisyklo[2.2.1]heptaani-2-karboksamidiksi.

12. Jonkin patenttivaatimuksista 1–11 mukainen farmaseuttinen koostumus, jossa mainittu koostumus soveltuu nivelensisäiseen injektioon.

13. Jonkin patenttivaatimuksista 1–12 mukainen farmaseuttinen koostumus käytettäväksi akuutin nivelvaurion tai -vamman hoitamisessa, parantamisessa tai ennaltaehkäisemissä sitä tarvitsevassa kohteessa, ja valinnaisesti yhdistelmässä toisen terapeuttisen aineen kanssa.

14. Farmaseuttinen koostumus käytettäväksi patenttivaatimuksen 13 mukaisesti, jossa mainittu farmaseuttinen koostumus käsittää annosalueen, joka on enintään 25 mg, enintään 75 mg, enintään 100 mg, enintään 200 mg tai enintään 400 mg mikrokiteistä N-(3,4-dikloorifenyyli)-3-(pyridin-4-yyli)-7-oksabisyklo[2.2.1]heptaani-2-karboksamidia.

15. Yhdistelmä, joka käsittää jonkin patenttivaatimuksista 1–12 mukaisen farmaseuttisen koostumuksen ja toisen terapeuttisen aineen.