



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20170002 T1

HR P20170002 T1

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

(51) MKP:

A61K 9/48 (2006.01)
A61K 31/4196 (2006.01)
A61P 5/26 (2006.01)
A61P 15/08 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 24.02.2017.

(21) Broj predmeta: P20170002T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 03.01.2017.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2012053846
Datum podnošenja međunarodne prijave: 06.09.2012.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 12758966.1
Datum podnošenja europske prijave patenta: 06.09.2012.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2013036563
Datum međunarodne objave: 14.03.2013.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2753313 A1
Datum objave europske prijave patenta: 16.07.2014.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2753313 B1
Datum objave europskog patenta: 14.12.2016.

(31) Broj prve prijave: 201161532459 P

(32) Datum podnošenja prve prijave: 08.09.2011.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US
201261638588 P

26.04.2012. US

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelj:

Mereo BioPharma 2 Limited, 1 Cavendish Place, W1G 0QF London, GB
Ann Taylor, c/o Novartis Institutes for BioMedical Research Inc., 220
Massachusetts Avenue, Cambridge, 02139 MA, US
Lloyd B. Klickstein, c/o Novartis Institutes for BioMedical Research Inc.,
220 Massachusetts Avenue, Cambridge, 02139 MA, US
Jeewan Thakur, Novartis Pharma AG, Postfach, 4002 Basel, CH

(74) Zastupnik:

ZMP IP d.o.o., 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma:

FARMACEUTSKI PRIPRAVCI KOJI SADRŽE INHIBITOR AROMATAZE

HR P20170002 T1

PATENTNI ZAHTEJVI

- 5 1. Nisko-dozirni farmaceutski pripravak u obliku kapsule, koji sadrži mješavinu koja obuhvaća
 - (a) terapijski učinkovitu količinu 4,4'-[fluoro-(1-H-1,2,4-triazol-1-il)metilen]bisbenzonitrila, koja količina jest od oko 0.01 do 5 mg po kapsuli;
 - (b) smjesu 3 punila, gdje su ta punila mikrokristalična celuloza, laktoza hidrat i kukuruzni škrob,
 - (c) sredstvo za raspadanje, gdje je to sredstvo natrijev škrob glikolat (SSG),
 - 10 (d) lubrikant, gdje je taj lubrikant magnezijev stearat,
 - (e) sredstvo za kliženje, gdje je to sredstvo koloidni silicijev dioksid,
 - smjesa punila se koristi u količini u rasponu od 80% to 96%, po težini sadržaja kapsule;
 - sredstvo za raspadanje se koristi u količini u rasponu od 3% do 6% po težini sadržaja kapsule;
 - lubrikant se koristi u količini u rasponu od 0.25% do 5% po težini sadržaja kapsule i
 - 15 sredstvo za kliženje se koristi u količini u rasponu od 0.25% do 1% po težini sadržaja kapsule.
2. Farmaceutski pripravak prema zahtjevu 1, gdje je ta terapijski učinkovita količina 4,4'-[fluoro-(1-H-1,2,4-triazol-1-il)metilen]bisbenzonitrila oko 0.01 mg, oko 0.05 mg, oko 0.1 mg, oko 0.3 mg, oko 0.5 mg, oko 1 mg po kapsuli.
3. Farmaceutski pripravak prema zahtjevu 1, gdje je ta terapijski učinkovita količina 4,4'-[fluoro-(1-H-1,2,4-triazol-1-il)metilen]bisbenzonitrila oko 0.1 mg, oko 0.3 mg, oko 0.5 mg, ili oko 1 mg po kapsuli.
- 20 4. Farmaceutski pripravak prema zahtjevu 1, gdje se navedena smjesa punila koristi u količini u rasponu od 85-95% ili 89-94%, po težini sadržaja kapsule.
5. Farmaceutski pripravak prema zahtjevu 1, gdje se sredstvo za raspadanje koristi u količini od 4% ili 5%, po težini sadržaja kapsule;
6. Farmaceutski pripravak prema zahtjevu 1, gdje se lubrikant koristi u količini od 0.5%, 1% ili 2%, po težini sadržaja kapsule.
- 25 7. Farmaceutski pripravak prema zahtjevu 1, gdje se sredstvo za kliženje koristi u količini od 0.25%, 0.5% ili 0.75%, po težini sadržaja kapsule.
8. Postupak pripreme farmaceutskog pripravka prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 7 koji obuhvaća korake:
 - (a) uzastopno dodavanje dva dijela punila ili smjese punila i jednog dijela terapijskog spoja 4,4'-[fluoro-(1-H-1,2,4-triazol-1-il)metilen]bisbenzonitrila (CGP47645) redom prvi dio punila, terapijski spoj, drugi dio punila u prikladni spremnik za miješanje i miješanje slojeva komponenti prikladnom miješalicom da se dobije pred-smjesa,
 - (b) prosijavanje pred-smjese kroz sito veličine otvora ne veće od 1.0 mm, poželjno od 0.5 mm,
 - (c) po izboru miješanje prosijane pred-smjese pomoću prikladne miješalice,
 - (d) prosijavanje smjese preostalih pomoćnih tvari, osim lubrikanta, kroz sito veličine otvora ne veće od 1.0 mm,
 - 35 poželjno od 0.5 mm,
 - (e) miješanje pred-smjese s mješavinom preostalih pomoćnih tvari, osim lubrikanta, pomoću prikladne miješalice,
 - (f) prosijavanje dobivene smjese kroz sito veličine otvora ne veće od 1.0 mm, poželjno od 0.5 mm,
 - (g) po izboru miješanje prosijane smjese pomoću prikladne miješalice,
 - (h) prosijavanje lubrikanta, kroz sito veličine otvora ne veće od 1.0 mm, poželjno od 0.5 mm i zatim dodavanje lubrikanta dobivenoj smjesi iz koraka (f) ili (g),
 - 40 (i) miješanje dobivene smjese prikladnom miješalicom da se dobije konačna mješavina,
 - (j) punjenje konačne mješavine iz koraka (i) u kapsule, po izboru pomoću prikladnog stroja za punjenje kapsula.
9. Farmaceutski pripravak prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 7 za uporabu (i) u liječenju ili prevenciji (i) stanja ili poremećaja povezanog s aktivnošću aromataze koji se odabiru iz skupine koju čine bolesti ovisne o estrogenu, kao što je tumor dojke, endometrioza, uterini fibroidi, uterini leiomiom, uterina adenomioza, disfunkcijsko uterino krvarenje i abnormalno zadebljanje endometrija; prerani porod; endometrijski tumori u žena; ginekomastija u muškaraca, (ii) u liječenju hipogonadizma ili hipogonadotropnog hipogonadizma u muškog bolesnika, poželjno prekomjerno teškog ili pretilog muškog bolesnika.
- 45