

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

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

- (10) **FI/EP4045038 T3**
- (12) **EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION**
- (45) Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning - **13.03.2024**
Translation available to the public
- (97) Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för **06.12.2023**
det europeiska patentet - Date of grant of European patent
- (51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -
International patent classification
A61K 31/433 (2006 . 01)
C07D 285/08 (2006 . 01)
A61K 9/48 (2006 . 01)
A61P 3/10 (2006 . 01)
A61K 9/20 (2006 . 01)
A61K 9/28 (2006 . 01)
- (96) Eurooppapatentihakemus - Europeisk patentansökan - **EP20799795.8**
European patent application
- (22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date **16.10.2020**
- (97) Patentihakemuksen julkiseksitilopäivä - Patentansökans **24.08.2022**
publiceringsdag - Patent application available to the public
- (86) Kansainvälinen hakemus - Internationell **16.10.2020 PCT/GB2020052618**
ansökan - International application
- (30) Etuoikeus - Prioritet - Priority
18.10.2019 GB GB201915094

(73) Haltija - Innehavare - Holder

1• Betagenon AB, Västra Strandgatan 9B , 903 26 Umeå , (SE)

(72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1• EDLUND, Thomas , Kungsgatan 46B , 90326 Umeå , (SE)

2• WESTMAN, Jacob , Jonsund Blomsberg 109 , 74497 Järlåsa , (SE)

(74) Asiamies - Ombud - Agent

Leitzinger Oy , c/o Spaces Mannerheiminaukio 1A , 00100 Helsinki , (FI)

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

**4-KLOORI-N-[2-[(4-KLOORIFENYLI)METYYLI]-3-OKSO-1,2,4-TIADIATSOL-5-YL]BENTSAMIDIN UUDET FORMULAATIOT
NEW FORMULATIONS OF 4-CHLORO-N-[2-[(4-CHLOROPHENYL)METHYL]-3-OXO-1,2,4-THIADIAZOL-5-YL]BENZAMIDE**

Patenttivaatimukset

1. 4-kloori-N-[2-[(4-kloorifenyyl)metyyli]-3-okso-1,2,4-tiadiatsol-5-yyli]bentsamidin alkalimetallisuola.
5
2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen suola, jossa suola on 4-kloori-N-[2-[(4-kloorifenyyl)metyyli]-3-okso-1,2,4-tiadiatsol-5-yyli]bentsamidin natrium- tai kalium-suola.
- 10 3. Patenttivaatimuksen 2 mukainen suola, jossa suola on 4-kloori-N-[2-[(4-kloorifenyyl)metyyli]-3-okso-1,2,4-tiadiatsol-5-yyli]bentsamidin natriumsuola.
4. Farmaseuttinen formulaatio, joka käsittää jonkin patenttivaatimuksen 1–3 mukaista suolaa.
15
5. Patenttivaatimuksen 4 mukainen farmaseuttinen formulaatio, jossa mainittu suola on jauhettu.
6. Patenttivaatimuksen 4 tai 5 mukainen farmaseuttinen formulaatio, jossa formulaatio käsittää jonkin patenttivaatimuksen 1–3 mukaista suolaa sisältäviä hiukkasia, joilla mainituilla hiukkasilla on D90 määrittämä hiukkaskokojakauma, joka on alle 10 µm, vaihtoehtoisesti, joissa D90 määrittämä hiukkaskokojakauma on alle 9 µm; D50 on alle 6 µm; D50 on alle 5 µm; D10 on alle 2 µm; tai D10 on alle 1,5 µm.
20
- 25 7. Jonkin patenttivaatimuksen 4–6 mukainen farmaseuttinen formulaatio, jossa formulaatio käsittää lisäksi enterisen päällysteen, jolloin suolistossa liukeneva pinnoite sisältää valinnaisesti mehiläisvahaa, sellakkaa, alkyyliselluloosapolymerihartsia (esim. etyyliiselluloosapolymeerejä, karboksimeytyylietyyliiselluloosaa tai hydroksipropyylimetyyliiselluloosaftalaattia) tai akryylyipolymerihartsia (esim. akryylihapo- ja
30 metakryylihapokopolymeerit, metakryylihapokopolymeerit, metyylimetakrylaattikopolymeerit, etoksietyylimetakrylaattit, syanoetyylimetakrylaatti, metyylimetakrylaatti, kopolymeerit, metakryylihapokopolymeerit, metyylimetakrylaattikopolymeerit, metyylimetakrylaattikopolymeerit, metakrylaattikopolymeerit, aminoalkyylimetakrylaattikopolymeerit, metakryylihapokopolymeerit, metyylimetakrylaattikopoly-

meerit, poly(akryylihapo), poly(metakryylihapo, metakryylihapon alkyylimidiko-
 polymeeri, poly(metyylimetakrylaatti), poly(metakryylihapo)(anhydridi), metyylimet-
 5 takrylaatti, polymetakrylaatti, metyylimetakrylaattikopolymeeri, poly(metyyli-
 metakrylaatti), poly(metyylimetakrylaatti)kopolymeeri, polyakryyliamidi, aminoalkyy-
 limetakrylaattikopolymeeri, poly(metakryylihapoanhydridi) ja glysidyylimetakrylaat-
 tikopolymeerit), selluloosa-asetaatiftalaatti, polyvinyliasetaatiftalaatti.

8. Jonkin patenttivaatimuksen 4–7 mukainen farmaseuttinen formulaatio, jolloin
 formulaatio käsittää lisäksi vähintään yhden farmaseuttisesti hyväksyttävän täyteai-
 10 neen, jossa valinnaisesti:

- (a) vähintään yksi farmaseuttisesti hyväksyttävä täyteaine valitaan ryhmästä,
 joka koostuu liukuaineesta, sideaineesta, täyteaineesta, pinta-aktiivisesta ai-
 neesta, laimennusaineesta, tarttumista estävästä aineesta, pinnoitteesta, aro-
 15 miaineesta, väriaineesta, liukuaineesta, säilöntäaineesta, makeutusaineesta,
 hajotusaineesta, adsorbentista, puskurointiaineesta, antioksidantista, kela-
 toivasta aineesta, liukenemista edistävästä aineesta, liukenemista hidastavasta
 aineesta ja kostutusaineesta; ja/tai
 (b) formulaatio käsittää PVP K30:tä, Na-dokusaattia ja mannitolia.

9. Jonkin patenttivaatimuksen 4–8 mukainen farmaseuttinen formulaatio, jossa for-
 mulaatio on kapselin tai tabletin muodossa, jossa valinnaisesti:

- (a) mainitussa kapselissa tai tablettissa on enterinen päällyste; ja tai
 (b) kapseli tai tabletti sisältää partikkeleita, jotka käsittävät suolan, ja jolloin
 jokainen partikkeli on päällystetty enterisellä päällysteellä.

10. Jonkin patenttivaatimuksen 4-9 mukainen farmaseuttinen formulaatio, jossa 4-
 kloori-N-[2-[(4-kloorifenyli)metyyli]-3-okso-1,2,4-tiadiatsol-5-yyli]bentsamidi suola
 on jauhettu siten, että suolaa sisältävillä hiukkasilla on D90 määrittämä hiukkasja-
 kauma joka on alle 10 µm, ja jolloin formulaatio sisältää lisäksi enteropinnoitteen.

11. Jonkin patenttivaatimuksen 1–3 mukainen suola tai jonkin patenttivaatimuksen
 4–10 mukainen farmaseuttinen formulaatio käytettäväksi häiriön tai tilan hoidossa,
 jota AMPK:n aktivaatio parantaa.

12. Suola tai farmaseuttinen formulaatio käytettäväksi patenttivaatimuksen 11 mukaisesti, jolloin häiriö tai tila, joka parannetaan AMPK:n aktivaationilla on:

(a) tyypin 2 diabetes;

5 (b) tila, joka liittyy hyperinsulinismiin, joka on valittu ryhmästä, joka koostuu liikalihavuudesta ja sydän- ja verisuonitaudeista; tai

(c) syöpä

13. Menetelmä jonkin patenttivaatimuksen 6–10 mukaisen farmaseuttisen formulaation valmistamiseksi, jossa prosessi käsittää jonkin patenttivaatimuksen 1–3 mukaisen suolan jauhamisen valinnaisesti yhdessä yhden tai useamman täyteaineen kanssa, jolloin saadaan partikkeleita, joissa D90 määrittämä hiukkaskokojakauma on alle 10 µm, jossa valinnaisesti:

(a) prosessi käsittää kuivajauhatuksen, jossa valinnaisesti kuivajauhatus sisältää suihkujauhatuksen; ja/tai

15 (b) 4-kloori-N-[2-[(4-kloorifenyyli)metyyli]-3-okso-1,2,4-tiadiatsol-5-yyli]bentsamidin suola sekoitetaan yhden tai useamman täyteaineen kanssa 4-kloori-N-[2-[(4-kloorifenyyli)metyyli]-3-okso-1,2,4-tiadiatsol-5-yyli]bentsamidi suolan jauhamisen jälkeen.

20 **14.** Patenttivaatimuksen 13 mukainen menetelmä, jossa farmaseuttinen formulaatio tarjotaan kapselin tai tabletin muodossa ja menetelmä käsittää lisäksi vaiheen jossa:

(a) päällystetään mainittu kapseli tai tabletti enteropäällysteellä, sen jälkeen kun 4-kloori-N-[2-[(4-kloorifenyyli)metyyli]-3-okso-1,2,4-tiadiatsol-5-yyli]bentsamidi jauhettu suola sisällytetään mainittuun kapseliin tai tablettiin;

25 tai

(b) enteropinnoitteen levittäminen 4-kloori-N-[2-[(4-kloorifenyyli)metyyli]-3-okso-1,2,4-tiadiatsol-5-yyli]bentsamidin jauhetulle suolalle ennen mainitun jauhetun suolan lisäämistä kapseliin tai tablettiin.