



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20210379 T1

HR P20210379 T1

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

(51) MKP:

A61K 9/00 (2006.01)
A61K 31/167 (2006.01)
A61K 31/56 (2006.01)
A61P 11/02 (2006.01)
A61K 31/573 (2006.01)
A61K 31/045 (2006.01)
A61K 45/06 (2006.01)
A61P 43/00 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 16.04.2021.

(21) Broj predmeta: P20210379T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 04.03.2021.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2010065569
Datum podnošenja međunarodne prijave: 15.10.2010.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 10768760.0
Datum podnošenja europske prijave patenta: 15.10.2010.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2011045429
Datum međunarodne objave: 21.04.2011.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2488157 A1
Datum objave europske prijave patenta: 22.08.2012.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2488157 B1
Datum objave europskog patenta: 30.12.2020.

(31) Broj prve prijave: 0918150

(32) Datum podnošenja prve prijave: 16.10.2009.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: GB

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelj:

Jagotec AG, Wildensteinerstrasse 1, 4132 Muttenz, CH
Rudi Mueller-Walz, Hans-Vetter-Strasse 108, 79650 Schopfheim, DE
Lise-Marie Fueg, Neumattstrasse 58, 4144 Arlesheim, CH

(74) Zastupnik:

CPZ - CENTAR ZA PATENTE d.o.o., 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma:

POBOLJŠANE FORMULACIJE

HR P20210379 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Uporaba ovlaživača u aerosolnoj suspenzijskoj formulaciji koja sadrži čestice formoterolfumarat dihidrata i flutikazon propionata, suspendirane u HFA pogonskom gorivu, koje se nalaze u doznom inhalatoru s odmjernom dozom koji obuhvaća posudu i mjerni ventil, **naznačena time, da** je za smanjivanje taloženja čestica na površinama posude i mjernog ventila, pri čemu se ovlaživač odabire iz skupine koja se sastoji od etanola, propilen glikola, glicerola, butandiola i njihovih mješavina, gdje je ovlaživač poželjno etanol.
2. Uporaba prema patentnom zahtjevu 1, **naznačena time, da** se ovlaživač koristi u količini manjoj od 2% mase na temelju ukupne mase aerosolne suspenzijske formulacije, poželjno od 1,99 do 0,01% mase na temelju ukupne mase aerosolne suspenzijske formulacije, poželjnije od 1,5 do 1,0% mase na temelju ukupne mase aerosolne suspenzijske formulacije.
3. Uporaba prema patentnom zahtjevu 1, **naznačena time, da** HFA pogonsko gorivo jest HFA 227.
4. Uporaba prema patentnom zahtjevu 1, **naznačena time, da** se formoterol fumarat dihidrat koristi u količini od 0,003 do 0,04% mase.
5. Uporaba prema patentnom zahtjevu 1, **naznačena time, da** se flutikazon propionat koristi u količini od 0,01 do 0,6% mase.
6. Uporaba prema patentnom zahtjevu 1, **naznačena time, da** aerosolna suspenzijska formulacija sadrži sol odabranu iz skupine koja se sastoji od nedokromila i kromoglicinske kiseline, poželjno gdje je sol natrijev kromoglikat (DSCG), poželjno gdje se natrijev kromoglikat koristi u količini od 0,01 do 0,1% mase na temelju ukupne mase formulacije.
7. Uporaba prema patentnom zahtjevu 1, **naznačena time, da** kada se aerosolna suspenzijska formulacija ispušta iz inhalatora s odmjernom dozom, ona dostavlja dozu oba i formoterol fumarat dihidrata i flutikazon propionata, koja ima varijancu ne veću od +/- 15% od prosječne ispuštene ciljane doze (i ne više od jedne vrijednosti izvan +/- 25% od ciljane vrijednosti i niti jedne izvan +/- 30% od ciljane vrijednosti), kada se formulacija pohranjuje na 25 stupnjeva Celzijusa i 60% relativne vlažnosti, prvenstveno na 40 stupnjeva Celzijusa i 75% relativne vlažnosti u vremenskom periodu od najviše jednog mjeseca, još poželjnije do najviše tri mjeseca, te osobito poželjno do najviše šest mjeseci.
8. Uporaba prema patentnom zahtjevu 1, **naznačena time, da** kada je aerosolna suspenzijska formulacija pohranjena u inhalatoru s odmjernom dozom u vremenu od najmanje dva tjedna i na temperaturi od 17 do 25 stupnjeva Celzijusa te uz relativnu vlažnost od 29 do 63%, ima prosječnu frakciju finih čestica od 30 do 60 % od označene doze kao u *in vitro* zastupljenosti aerodinamičke raspodjele veličine čestica.
9. Uporaba prema patentnom zahtjevu 1, **naznačena time, da** aerosolna suspenzijska formulacija koja se nalazi u inhalatoru s odmjernom dozom, sadrži:
 - (i) 0,035% flutikazon propionata, 0,007% formoterol fumarata, 0,034% natrijevog kromoglikata, 1,4% etanola i HFA 227 *q.s. ad* 100, gdje se svi postoci temelje na ukupnoj masi pripravka, i gdje nominalna doza iznosi 50 mikrograma za flutikazon propionat i 10 mikrograma za formoterol fumarat, dva puta dnevno (BID);
 - (ii) 0,071% flutikazon propionata, 0,007% formoterol fumarata, 0,034% natrijevog kromoglikata, 1,4% etanola i HFA 227 *q.s. ad* 100, gdje se svi postoci temelje na ukupnoj masi pripravka, i gdje nominalna doza iznosi 100 mikrograma za flutikazon propionat, i 10 mikrograma za formoterol fumarat, dva puta dnevno (BID);
 - (iii) 0,178% flutikazon propionata, 0,007% formoterol fumarata, 0,034% natrijevog kromoglikata, 1,4% etanola i HFA 227 *q.s. ad* 100, gdje se svi postoci temelje na ukupnoj masi pripravka, i gdje nominalna doza iznosi 250 mikrograma za flutikazon propionat, i 10 mikrograma za formoterol fumarat, dva puta dnevno (BID);
 - (iv) 0,357% flutikazon propionata, 0,007% formoterol fumarata, 0,034% natrijevog kromoglikata, 1,4% etanola i HFA 227 *q.s. ad* 100, gdje se svi postoci temelje na ukupnoj masi pripravka, i gdje nominalna doza iznosi 500 mikrograma za flutikazon propionat, i 10 mikrograma za formoterol fumarat, dva puta dnevno (BID);
 - (v) 0,357% flutikazon propionata, 0,014% formoterol fumarata, 0,068% natrijevog kromoglikata, 1,4% etanola i HFA 227 *q.s. ad* 100, gdje se svi postoci temelje na ukupnoj masi pripravka, i gdje nominalna doza iznosi 500 mikrograma za flutikazon propionat, i 20 mikrograma za formoterol fumarat, dva puta dnevno; ili 0,357% flutikazon propionata, 0,014% formoterol fumarata, 0,034% natrijevog kromoglikata, 1,4% etanola i HFA 227 *q.s. ad* 100, gdje se svi postoci temelje na ukupnoj masi pripravka, i gdje nominalna doza iznosi 500 mikrograma za flutikazon propionat, i 20 mikrograma za formoterol fumarat, dva puta dnevno.
10. Aerosolna suspenzijska formulacija, **naznačena time, da** sadrži čestice formoterol fumarat dihidrata i flutikazon propionata, suspendirane u HFA pogonskom gorivu i ovlaživač, gdje se ovlaživač odabire iz skupine koja se sastoji od etanola, propilen glikola, glicerola, butandiola i njihovih mješavina, s time, da se ovlaživač koristi u količini manjoj od 2% po masi na temelju ukupne mase formulacije, i pritom čestice posjeduju raspodjelu veličina čestica pri čemu se D10 (10% od distribucijskog volumena) nalazi u rasponu od 0,2 do 2 mikrometra, D50 se nalazi su rasponu od 1 do 4 mikrometra i D90 se nalazi u rasponu od 2 do 6 mikrometara, kada se mjeri pomoću laserske difrakcije ili u suspenziji ili kao dispergirani suhi prah.

11. Aerosolna suspenzijska formulacija prema patentnom zahtjevu 10, **naznačena time, da** se ovlaživač koristi u količini od 1,99 do 0,01% mase na temelju ukupne mase aerosolne suspenzijske formulacije, poželjno u količini od 1,5 do 1,0% mase na temelju ukupne mase aerosolne suspenzijske formulacije.
- 5 12. Aerosolna suspenzijska formulacija prema patentnom zahtjevu 10, **naznačena time, da** HFA pogonsko gorivo jest HFA 227.
13. Aerosolna suspenzijska formulacija prema patentnom zahtjevu 10, **naznačena time, da** se formoterol fumarat dihidrat unosi u količini od 0,003 do 0,04% mase.
14. Aerosolna suspenzijska formulacija prema patentnom zahtjevu 10, **naznačena time, da** se flutikazon propionat unosi u količini od 0,01 do 0,6% mase.
- 10 15. Aerosolna suspenzijska formulacija prema patentnom zahtjevu 10, **naznačena time, da** aerosolna suspenzijska formulacija dodatno sadrži sol odabranu iz skupine koja se sastoji od nedokromila i kromoglicilne kiseline, gdje se poželjno radi o soli natrijevog kromoglikata (DSCG), još poželjnije gdje se natrijev kromoglikat koristi u količini od 0,01 do 0,1% mase na temelju ukupne mase formulacije.
- 15 16. Aerosolna suspenzijska formulacija prema patentnom zahtjevu 10, koja se nalazi u inhalatoru s odmjernom dozom, **naznačena time, da** sadrži:
 - (i) 0,035% flutikazon propionata, 0,007% formoterol fumarata, 0,034% natrijevog kromoglikata, 1,4% etanola i HFA 227 *q.s. ad* 100, gdje se svi postoci temelje na ukupnoj masi pripravka, i gdje nominalna doza iznosi 50 mikrograma za flutikazon propionat i 10 mikrograma za formoterol fumarat, dva puta dnevno (BID);
 - 20 (ii) 0,071% flutikazon propionata, 0,007% formoterol fumarata, 0,034% natrijevog kromoglikata, 1,4% etanola i HFA 227 *q.s. ad* 100, gdje se svi postoci temelje na ukupnoj masi pripravka, i gdje nominalna doza iznosi 100 mikrograma za flutikazon propionat i 10 mikrograma za formoterol fumarat, dva puta dnevno (BID);
 - 25 (iii) 0,178% flutikazon propionata, 0,007% formoterol fumarata, 0,034% natrijevog kromoglikata, 1,4% etanola i HFA 227 *q.s. ad* 100, gdje se svi postoci temelje na ukupnoj masi pripravka, i gdje nominalna doza iznosi 250 mikrograma za flutikazon propionat i 10 mikrograma za formoterol fumarat, dva puta dnevno (BID);
 - (iv) 0,357% flutikazon propionata, 0,007% formoterol fumarata, 0,034% natrijevog kromoglikata, 1,4% etanola i HFA 227 *q.s. ad* 100, gdje se svi postoci temelje na ukupnoj masi pripravka, i gdje nominalna doza iznosi 500 mikrograma za flutikazon propionat i 10 mikrograma za formoterol fumarat, dva puta dnevno (BID);
 - 30 (v) 0,357% flutikazon propionata, 0,014% formoterol fumarata, 0,068% natrijevog kromoglikata, 1,4% etanola i HFA 227 *q.s. ad* 100, gdje se svi postoci temelje na ukupnoj masi pripravka, i gdje nominalna doza iznosi 500 mikrograma za flutikazon propionat i 20 mikrograma za formoterol fumarat, dva puta dnevno; ili
 - (vi) 0,357% flutikazon propionata, 0,014% formoterol fumarata, 0,034% natrijevog kromoglikata, 1,4% etanola i HFA 227 *q.s. ad* 100, gdje se svi postoci temelje na ukupnoj masi pripravka, i gdje nominalna doza iznosi 500 mikrograma za flutikazon propionat i 20 mikrograma za formoterol fumarat, dva puta dnevno.
- 35 17. Aerosolna suspenzijska formulacija prema patentnom zahtjevu 10, **naznačena time, da** je za uporabu u liječenju astme, alergijskog rinitisa ili kronične opstruktivske plućne bolesti (KOPB).
- 40 18. Aerosolna suspenzijska formulacija prema patentnom zahtjevu 17, **naznačena time, da** je za uporabu istovremeno, uzastopno ili odvojeno s beta-2-agonistom kratkog djelovanja, pri čemu je beta-2-agonist kratkog djelovanja odabran iz skupine koja se sastoji od albuterola, salbutamola, terbutalina, fenoterola, levalbuterola, reproterola i pirbuterola.