



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20160179 T1

HR P20160179 T1

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

(51) MKP:

A61K 9/28 (2006.01)
A61K 9/48 (2006.01)
A61K 31/437 (2006.01)
A61P 7/02 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 08.04.2016.

(21) Broj predmeta: P20160179T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 19.02.2016.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2011025994
Datum podnošenja međunarodne prijave: 24.02.2011.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 11707284.3
Datum podnošenja europske prijave patenta: 24.02.2011.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2011106478
Datum međunarodne objave: 01.09.2011.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2538925 A2
Datum objave europske prijave patenta: 02.01.2013.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2538925 B1
Datum objave europskog patenta: 16.12.2015.

(31) Broj prve prijave: 308056 P

(32) Datum podnošenja prve prijave: 25.02.2010.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelji patenta:

**Bristol-Myers Squibb Company, Route 206 and Province Line Road,
Princeton, NJ 08543, US**

(72) Izumitelji:

Pfizer Inc., 235 East 42nd Street, New York, NY 10017, US

**Jatin Patel, c/o Bristol-Myers Squibb Company, Route 206 and Province
Line Road, Princeton, NJ 08543, US**

**Charles Frost, c/o Bristol-Myers Squibb Company, Route 206 and
Province Line Road, Princeton, NJ 08543, US**

**Jingpin Jia, c/o Bristol-Myers Squibb Company, Route 206 and Province
Line Road, Princeton, NJ 08543, US**

**Chandra Vema-Varapu, c/o Bristol-Myers Squibb Company, Route 206
and Province Line Road, Princeton, NJ 08543, US**

(74) Zastupnik:

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

(54) Naziv izuma: **FORMULACIJE APIKSABANA**

HR P20160179 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

- 5 1. Tableta ili kapsula koja sadrži farmaceutsku kompoziciju, gdje farmaceutska kompozicija sadrži apiksaban i farmaceutski prihvatljiv razrijeđivač ili nosač, gdje je apiksaban u obliku tvari i kristalnom obliku i pojedinačne tvari apiksabana, bilo da tvari postoje zasebno ili u aglomeratu, imaju D90 jednak ili manji od 89 µm kao što je mjereno raspršivanjem laserske svjetlosti.
- 10 2. Tableta ili kapsula kao što je određena u patentnom zahtjevu 1, gdje tvari apiksabana imaju D90 jednak ili manji od 85 µm kao što je mjereno raspršivanjem laserske svjetlosti.
3. Tableta ili kapsula kao što je određena u patentnom zahtjevu 1 ili patentnom zahtjevu 2, gdje spomenuta kompozicija sadrži Oblik N-1 apiksabana.
4. Tableta ili kapsula kao što je određena u bilo kojem od patentnih zahtjeva 1-3, gdje tvari imaju D90 jednak ili manji od 50µm kao što je mjereno raspršivanjem laserske svjetlosti.
- 15 5. Tableta ili kapsula kao što je određena u bilo kojem od patentnih zahtjeva 1-3, gdje tvari imaju D90 jednak ili manji od 30µm kao što je mjereno raspršivanjem laserske svjetlosti.
6. Tableta ili kapsula kao što je određena u bilo kojem od patentnih zahtjeva 1-3, gdje tvari imaju D90 jednak ili manji od 25µm kao što je mjereno raspršivanjem laserske svjetlosti.
- 20 7. Tableta ili kapsula kao što je određena u bilo kojem od patentnih zahtjeva 1-6, koja dalje sadrži: od 1% do 2 % po težini surfaktanta.
8. Tableta ili kapsula kao što je određena u patentnom zahtjevu 7, gdje je surfaktant natrijev lauril sulfat.
9. Tableta ili kapsula kao što je određena u bilo kojem od patentnih zahtjeva 1-8 za uporabu u tretmanu tromboembolijskog poremećaja.
- 25 10. Postupak za proizvodnju apiksaban tablete koja ima kompoziciju kao što je određena u bilo kojem od patentnih zahtjeva 1-8, koji sadrži korake:
 - (1) miješanje sirovih materijala prije granulacije;
 - (2) granulacija sirovih materijala iz koraka (1) korištenjem postupka suhe ili vlažne granulacije;
 - (3) miješanje granula dobijenih u koraku (2) sa ekstragranuloznim sirovim materijalom;
 - (4) komprimiranje smjese iz koraka (3) u tabletu; i
 - 30 (5) oblaganje filmom tablete iz koraka (4).
11. Postupak prema patentnom zahtjevu 10, koji sadrži korake:
 - (1) miješanje sirovih materijala, sa apiksabanom kontrolirane veličine tvari;
 - (2) dodavanje intragranuloznih dijelova vezujućeg sredstva, sredstva za raspadanje i najmanje jednog punitelja u smjesu iz koraka (1) da se formira smjesa;
 - 35 (3) granuliranje materijala iz koraka (2) korištenjem postupka suhe granulacije ili postupka vlažne granulacije, gdje postupak suhe granulacije obuhvaća:
 - uklanjanje grudica iz intragranuloznog lubrikanta uporabom sita ili mlina; dodavanje intragranuloznog lubrikanta u smjesu iz koraka (2) i miješanje do formiranja ovlažene smjese;
 - sabijanje ovlažene smjese u trake gustoće u opsegu od 1.1 do 1.2 g/cc i formiranje do dobijene veličine sabijenih traka uporabom valjka kompaktora, i gdje postupak vlažne granulacije obuhvaća:
 - 40 vlažno granuliranje smjese iz koraka (2) korištenjem vode do ciljane krajnje točke i izbornu, formiranje vlažnih granula do dobijene veličine propuštanjem kroz sito/mlin.
 - uklanjanje vode iz granulacije sušenjem u konvekcijskoj peći ili uređaju za sušenje sa fluidnim slojem; formiranje suhih granula do dobijene veličine propuštanjem kroz sito/mlin;
 - 45 (4) miješanje granula dobijene veličine iz koraka (3) i ekstragranuloznog sredstva za raspadanje u miješalici;
 - (5) uklanjanje grudica iz ekstragranularnog lubrikanta uporabom sita ili mlina i miješanje sa granulama iz koraka (4);
 - (6) komprimiranje smjese iz (5) u tablete; i
 - (7) oblaganje filmom tableta iz koraka (6).
 - 50 12. Postupak prema patentnom zahtjevu 10 ili 11, gdje je korišten postupak suhe granulacije.