



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20190186 T4

HR P20190186 T4

(12) **PRIJEVOD IZMIJENJENIH PATENTNIH
ZAHTJEVA EUROPSKOG PATENTA**

(51) MKP:
A61K 9/00 (2006.01)
A61K 31/5383 (2006.01)
A61K 31/675 (2006.01)
A61K 9/46 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 22.03.2019.
(46) Datum objave prijevoda izmijenjenih patentnih zahtjeva: 20.12.2024.

(21) Broj predmeta: P20190186T

(22) Datum podnošenja : 26.07.2012.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/GB2012051791
Datum podnošenja međunarodne prijave: 26.07.2012.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 12759802.7
Datum podnošenja europske prijave patenta: 26.07.2012.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2013014454
Datum međunarodne objave: 31.01.2013.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2736487 A1
Datum objave europske prijave patenta: 04.06.2014.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2736487 B1
Datum objave europskog patenta: 07.11.2018.

(97) Broj objave izmijenjenog europskog patenta: EP 2736487 B1
Datum objave izmijenjenog europskog patenta: 07.11.2018.

(31) Broj prve prijave: 201161512621 P (32) Datum podnošenja prve prijave: 28.07.2011. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelj patenta: **Rigel Pharmaceuticals, Inc., 1180 Veterans Boulevard, South San Francisco, CA 94080, US**

(72) Izumitelji: **Farhan Abdul Karim Alhusban, AstraZeneca, Charter Way, SK10 2NA Macclesfield Cheshire, GB**
Ian Paul Gabbott, AstraZeneca, Charter Way, SK10 2NA Macclesfield Cheshire, GB
Bindhumadhavan Gururajan, AstraZeneca R&D Mölndal, 431 83 Mölndal, SE
Dawn Sievwright, AstraZeneca, Charter Way, SK10 2NA Macclesfield Cheshire, GB
David Bradley Brook Simpson, AstraZeneca, Charter Way, SK10 2NA Macclesfield Cheshire, GB

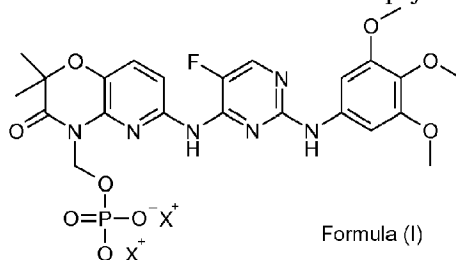
(74) Zastupnik: PRODUCTA d.o.o., 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma: NOVE FORMULACIJE (TRIMETOKSIFENILAMINO)PIRIMIDINILA

HR P20190186 T4

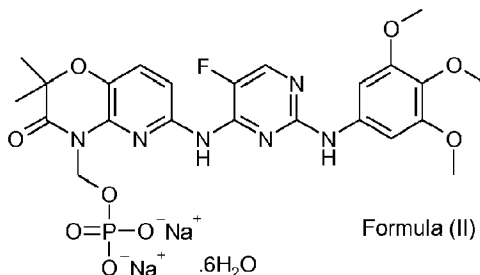
PATENTNI ZAHTJEVI

1. Farmaceutski pripravak, naznačen time što sadrži više od 15% m/m spoja s Formulom (I):



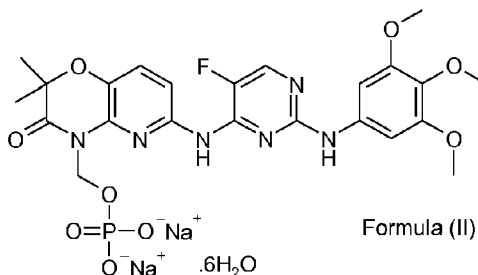
Formula (I)

- 5 pri čemu svaki X^+ predstavlja jednovalentni kation;
 ili pri čemu X^+ i X^+ su uzeti zajedno tako da predstavljaju dvovalentni kation X^{2+} ;
 i/ili njegov hidrat;
 i barem 5% m/m jednog ili više šumećih sredstava; i nadalje sadrži jedan ili više farmaceutski prihvatljivih sastojaka.
- 10 2. Farmaceutski pripravak prema zahtjevu 1 naznačen time što sadrži više od ili jednako 25% m/m spoja s Formulom (I) i/ili njegovog hidrata.
3. Farmaceutski pripravak prema bilo kojem od prethodnih zahtjeva naznačen time što sadrži manje od ili jednako 20% m/m šumećeg sredstva.
- 15 4. Farmaceutski pripravak prema bilo kojem od prethodnih zahtjeva naznačen time što sadrži više od 15% m/m spoja s Formulom (I) i/ili njegovog hidrata i manje od ili jednako 20% m/m šumećeg sredstva; i nadalje sadrži jedan ili više farmaceutski prihvatljivih sastojaka.
5. Farmaceutski pripravak prema bilo kojem od prethodnih zahtjeva naznačen time što je šumeće sredstvo natrijev hidrogenkarbonat.
- 20 6. Farmaceutski pripravak prema bilo kojem od prethodnih zahtjeva naznačen time što svaki X^+ u spoju s Formulom (I) predstavlja natrijev kation (Na^+).
7. Farmaceutski pripravak prema bilo kojem od prethodnih zahtjeva naznačen time što je spoj s Formulom (I) u obliku heksahidrata.
8. Farmaceutski pripravak prema bilo kojem od prethodnih zahtjeva naznačen time što je spoj s Formulom (I) u obliku Formula (II):



Formula (II)

- 25 9. Farmaceutski pripravak prema zahtjevu 1, naznačen time što je:
- (a) formulacija vlažne granulacije koja sadrži spoj s Formulom (I) i/ili njegov hidrat, vodu, jedno ili više šumećih sredstava, punila, vezivno sredstvo(a) i sredstvo(a) za raspadanje;
- 30 (b) formulacija vlažne granulacije koja sadrži više od 15% m/m spoja s Formulom (I) i/ili njegovog hidrata i manje od ili jednako 20% m/m jednog ili više šumećih sredstava; i nadalje sadrži jedan ili više farmaceutski prihvatljivih sastojaka;
- (c) formulacija za sabijanje valjkom koja sadrži više od 15% m/m spoja s Formulom (I) i/ili njegovog hidrata i manje od ili jednako 20% m/m jednog ili više šumećih sredstava; i nadalje sadrži jedan ili više farmaceutski prihvatljivih sastojaka; ili
- 35 (d) formulacija za izravnu kompresiju koja sadrži više od 15% m/m spoja s Formulom (I) i/ili njegovog hidrata i manje od ili jednako 20% m/m jednog ili više šumećih sredstava; i nadalje sadrži jedan ili više farmaceutski prihvatljivih sastojaka.
10. Formulacija vlažne granulacije, formulacija za sabijanje valjkom ili formulacija za izravnu kompresiju prema zahtjevu 9 naznačen time što je šumeće sredstvo natrijev hidrogenkarbonat.
- 40 11. Formulacija vlažne granulacije, formulacija za sabijanje valjkom ili formulacija za izravnu kompresiju prema zahtjevu 9 naznačen time što svaki X^+ u spoju s Formulom (I) predstavlja natrijev kation (Na^+).
12. Formulacija vlažne granulacije, formulacija za sabijanje valjkom ili formulacija za izravnu kompresiju prema zahtjevu 9 naznačen time što je spoj s Formulom (I) u obliku heksahidrata.
- 45 13. Formulacija vlažne granulacije, formulacija za sabijanje valjkom ili formulacija za izravnu kompresiju prema zahtjevu 9 naznačen time što je spoj s Formulom (I) u obliku Formula (II):



14. Postupak za pripravu farmaceutskog pripravka prema zahtjevu 1, naznačen time što navedeni postupak sadrži:
- a) miješanje spoja s Formulom (I) i/ili njegovog hidrata s jednim ili više šumećih sredstava, jednim ili više punila i proizvoljno u prisutnosti jednog ili više vezivnih sredstava i/ili jednog ili više sredstava za raspadanje i/ili jednog ili više drugih pomoćnih tvari;
 - b) dodavanje između 10% i 45 masenih % pročišćene vode i/ili otopine veziva u praškastu smjesu a) iznad i miješanje da se dobiju povećane granule i proizvoljno prolaz kroz sito za filtriranje da se razbiju veliki aglomerati;
 - c) sušenje povećanih granula proizvedenih u koraku b) iznad dok se ne postigne LOD manji od 10%, da se dobiju osušene granule.
15. Postupak prema zahtjevu 14 naznačen time što nadalje sadrži mljevenje osušanih granula, kako bi se dobile mljevene granule, i proizvoljno nadalje obuhvaća miješanje mljevenih granula s sredstvom za povećanje skliskosti dok se ne dobije postigne homogena smjesa, te zatim tabletiranje dobivenog pripravka