



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20201162 T1



HR P20201162 T1

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

(51) MKP:

A61K 9/14 (2006.01)
A61K 9/48 (2006.01)
A61K 31/454 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 13.11.2020.

(21) Broj predmeta: P20201162T

(22) Datum podnošenja zahtjeva : 24.07.2020.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 15182621.1
Datum podnošenja europske prijave patenta: 27.08.2015.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3135275 A1
Datum objave europske prijave patenta: 01.03.2017.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3135275 B1
Datum objave europskog patenta: 13.05.2020.

(73) Nositelj patenta:

Grindeks, a joint stock company, 53, Krustpils Street, 1057 Riga, LV

(72) Izumitelji:

Armands Konosonoks, 1057 Riga, LV

Kestutis Merkys, 1057 Riga, LV

(74) Zastupnik:

Odvjetnik Andrej Matijević, 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma:

**FARMACEUTSKI SASTAV KOJI MOŽE UKLJUČITI LENALIDOMID U RAZLIČITIM
KRISTALINIČNIM MODIFIKACIJAMA**

HR P20201162 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

1. Oralni kruti farmaceutski sastav

naznačen time, da

sadrži

- a. od 1,0 tež.% do 50,0 tež.%, računano na osnovi baze Lenalidomida, od čestica baze Lenalidomida oblika A;
- b. od 50 tež% do 99 tež% jednog ili više punila; i
- c. po izboru jedan ili više dezintegrirajućih agensa, lubrikanata, veziva, sredstava za klizanje i drugih, farmaceutski prihvatljivih pomoćnih tvari;

sve vrijednosti navedene u tež. postocima izračunane su u odnosu na ukupnu težinu sastava; kod čega je raspodjela čestica po veličini (d_{90}) čestica Lenalidomida u području od 1 μm do 100 μm .

2. Oralni kruti farmaceutski sastav prema bilo kojem od prethodnih patentnih zahtjeva,

naznačen time, da

količina čestica modifikacije Lenalidomida jest u području od 2,0 tež% do 20,0 tež%, pogodnije od 3,0 tež% do 10,0 tež% i najpogodnije od 4,0 tež% do 8,0 tež%.

3. Oralni kruti farmaceutski sastav prema bilo kojem od prethodnih patentnih zahtjeva,

naznačen time, da

raspodjela čestica po veličini (d_{90}) čestica Lenalidomida jest u području od 2 μm do 80 μm , pogodno od 3 μm do 50 μm , najpogodnije od 30 μm do 45 μm .

4. Oralni kruti farmaceutski sastav prema bilo kojem od prethodnih patentnih zahtjeva,

naznačen time, da

raspodjela čestica po veličini (d_{50}) čestica Lenalidomida jest od 0,5 μm do 30 μm , pogodno od 2 μm do 20 μm , čak pogodnije od 3 μm do 15 μm i najpogodnije od 4 μm do 10 μm .

5. Oralni kruti farmaceutski sastav prema bilo kojem od prethodnih patentnih zahtjeva,

naznačen time, da

raspodjela čestica po veličini (d_{10}) čestica Lenalidomida jest od 0,1 μm do 2 μm , pogodno od 0,05 μm do 1 μm , čak pogodnije od 0,08 μm do 0,7 μm i najpogodnije od 0,1 μm do 0,4 μm .

6. Oralni kruti farmaceutski sastav prema bilo kojem od prethodnih patentnih zahtjeva,

naznačen time, da

se jedno ili više punila odabiru od mikrokristalinične celuloze (MCC), silicirane mikrokristalinične celuloze (SMCC), laktoze monohidrata, anhidrida laktoze, manitola, saharoze, dikalcijevog fosfata, kalcijevog karbonata, magnezijevog karbonata, predželatiranog škroba, niskosupstituirane hidroksipropilceluloze (L-HPC), praškaste celuloze, kalcijevog silikata, kalcijevog fosfata, sorbitola, manitola, dekstrina, kaolina, magnezijevog oksida, kalcijevog sulfata, ksilitola, izomalta, glukoze, fruktoze, maltoze, kiselina kao što su citronska kiselina, vinska kiselina, fumarna kiselina i kopolimera iz vinilpirolidona i vinilacetata, ili kopolimera polietilenglikola, prvenstveno odabranih između MCC i laktoze anhidrida.

7. Oralni kruti farmaceutski sastav prema bilo kojem od prethodnih patentnih zahtjeva,

naznačen time, da

su jedan ili više dezintegrirajućih agensa odabrani od kroskarmeloze, kalcijkarboksimitilceluloze, natrijevog škrobglikolata, kukuruznog škroba, predželatiranog škroba, krumpirovog škroba, alginske kiseline, polivinilpirolidona (krospovidona) i niskosupstituirane hidroksipropilceluloze (L-HPC), prvenstveno kroskarmeloze-natrij.

8. Oralni kruti farmaceutski sastav prema bilo kojem od prethodnih patentnih zahtjeva,

naznačen time, da

su jedan ili više lubrikanata odabrani od magnezijevog stearata, kalcijevog stearata, natrijevog stearata, stearinske kiseline, natrijglicerilbehenata, heksandiojeve kiseline, hidrogeniranog biljnog ulja, natrijevog stearilfumarata i glicerinfumarata, prvenstveno magnezijevog stearata.

9. Oralni kruti farmaceutski sastav prema bilo kojem od prethodnih patentnih zahtjeva,

naznačen time, da

su jedno ili više veziva izabrani iz skupine koja obuhvaća hidroksipropilmetilcelulozu (HPMC), dihidroksipropilcelulozu, metilcelulozu, hidroksietilcelulozu, etilcelulozu, natrijkarboksimitilcelulozu, polietilenglikol, maltodekstrin, predželatirani škrob, škrob, polimetakrilate, natrijev alginat, polivinilpirolidon (povidon) i kopolimer vinilpirolidona/vinilacetata (kopovidon).

10. Oralni kruti farmaceutski sastav prema bilo kojem od prethodnih patentnih zahtjeva,

naznačen time, da

je jedno ili više sredstava za klizanje odabrano od koloidnog silicijevog dioksida, talka i magnezijevog karbonata.

11. Oralni kruti farmaceutski sastav prema bilo kojem od prethodnih patentnih zahtjeva u obliku kapsule,

naznačen time, da

- i. količina jednog ili više punila jest u području od 60,0 tež.% do 98,0 tež. %, prvenstveno od 80,0 tež.% do 95,0 tež.%;
- ii. količina jednog ili više dezintegrirajućih agensa jest u području od 1,0 tež.% do 10,0 tež.%;
- iii. količina jednog ili više lubrikanata jest u području od 0,5 tež.% do 2,0 tež. %.

12. Postupak miješanja suhog praha za proizvodnju oralnog krutog farmaceutskog sastava u obliku kapsule prema patentnom zahtjevu 11,

naznačen time, da

sadrži stupnjeve:

- 5 a. Mljevenje kristalinične modifikacije Lenalidomida izabrane iz skupine koja sadrži Lenalidomid bazu, Lenalidomid hidrokloridnu sol, Lenalidomid amonijev klorid kokristal ili njihove smjese;
- b. Miješanje smljevenog Lenalidomida i prvog dijela od jednog ili više punila da se dobije smjesa 1;
- c. Miješanje smjese 1 i drugog dijela od jednog ili više punila da se dobije smjesa 2;
- 10 d. Miješanje dezintegrirajućeg agensa ili dezintegrirajućih agensa i lubrikanta ili lubrikanata da se dobije smjesa 3;
- e. Prosijavanje smjese 3;
- f. Miješanje smjese 2 i smjese 3 (lubrikacija) da se dobije konačna smjesa;
- g. Punjenje kapsula konačnom smjesom.

13. Postupak za proizvodnju kapsule prema patentnom zahtjevu 12,

naznačen time, da

obuhvaća stupnjeve:

- a. Mljevenje kristalinične modifikacije Lenalidomida izabrane iz skupine koja sadrži bazu Lenalidomida oblika A, Lenalidomid hidrokloridnu sol, Lenalidomid amonijev klorid kokristal ili njihove smjese;
- b. Miješanje smljevenog Lenalidomida i laktoze da se dobije smjesa 1;
- 20 c. Miješanje smjese 1 i mikrokristalinične celuloze da se dobije smjesa 2;
- d. Miješanje natrijeve kroskarmeloze i magnezijevog stearata da se dobije smjesa 3;
- e. Prosijavanje smjese 3;
- f. Miješanje smjese 2 i smjese 3 da se dobije konačna smjesa; i
- g. Punjenje kapsula konačnom smjesom.