



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20190733 T1

HR P20190733 T1

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

(51) MKP:

A61K 9/48 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 14.06.2019.

(21) Broj predmeta: P20190733T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 17.04.2019.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2014059424
Datum podnošenja međunarodne prijave: 07.10.2014.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 14786429.2
Datum podnošenja europske prijave patenta: 07.10.2014.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2015054199
Datum međunarodne objave: 16.04.2015.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3054927 A1
Datum objave europske prijave patenta: 17.08.2016.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3054927 B1
Datum objave europskog patenta: 20.02.2019.

(31) Broj prve prijave: 201361888419 P (32) Datum podnošenja prve prijave: 08.10.2013. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelj patenta:

Celgene Corporation, 86 Morris Avenue, Summit, NJ 07901, US

(72) Izumitelji:

Darshan Parikh, 1605 Vroom Drive, Bridgewater, NJ 08807, US

Anil Menon, 1717 Merriam Drive, Martinsville, NJ 08836, US

(74) Zastupnik:

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

(54) Naziv izuma:

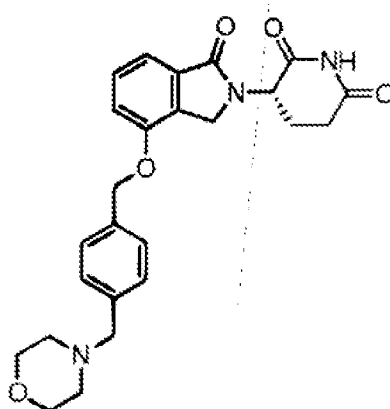
FORMULACIJE (S)-3-{4-[(4-(MORFOLINOMETIL)BENZILOKSI)-1-OKSOIZOINDOLIN-2-IL]PIPERIDIN-2,6-DIONA

HR P20190733 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Oralni oblik doziranja u obliku kapsule naznačen time što sadrži:

1) spoj A sa sljedećom strukturom:



ili njegovu farmaceutski prihvatljivu sol, hidrat, stereoizomer, tautomer ili njihove racemične smjese, u količini od oko 0,1 do oko 3 težinska postotka ukupne težine oblika za doziranje; 2) nosač ili pomoćnu tvar u količini od oko 90 do 99,9 težinskih postotaka ukupne težine oralnog oblika za doziranje, pri čemu je nosač ili pomoćna tvar smjesa škroba i laktoze; i 3) sredstvo za povećanje skliskosti, pri čemu je sredstvo za povećanje skliskosti stearinska kiselina.

2. Oralni oblik doziranja prema zahtjevu 1, naznačen time što je spoj A prisutan u količini od oko 0,1 do oko 1 težinskog postotka ukupne težine oblika za doziranje; proizvoljno

pri čemu je nosač ili pomoćna tvar prisutna u količini od oko 95 do oko 99,9 težinskih postotaka ukupne težine oblika za doziranje; ili

pri čemu težinski omjer laktoze prema škrobu u oralnom obliku za doziranje iznosi od oko 1:1 do oko 5:1; naročito je težinski omjer laktoze prema škrobu u oralnom obliku za doziranje oko 3:1; ili

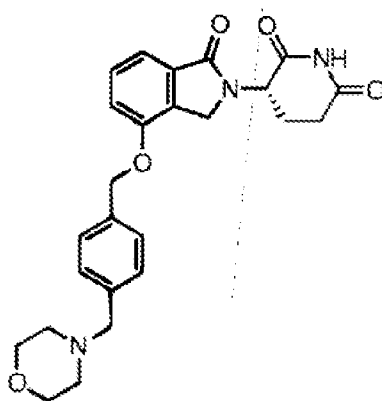
pri čemu je škrob preželatizirani škrob; ili

pri čemu laktoza je bezvodna laktoza; ili

pri čemu je sredstvo za povećanje skliskosti prisutno u količini od 0,01 do 1 težinskog postotka ukupne težine oblika za doziranje; naročito

pri čemu je sredstvo za povećanje skliskosti prisutno u količini od 0,1 do 0,5 težinskih postotaka ukupne težine oblika za doziranje.

3. Oralni oblik doziranja prema zahtjevu 1, naznačen time što teži oko 75 mg i sadrži: 1) spoj A sa sljedećom strukturom:



ili njegovu farmaceutski prihvatljivu sol, hidrat, stereoizomer, tautomer ili njihove racemične smjese, u količini koja osigurava 0,3 mg potentnosti spoja A; 2) farmaceutski prihvatljiv nosač ili pomoćnu tvar, pri čemu je nosač ili pomoćna tvar smjesa škroba i laktoze; i 3) sredstvo za povećanje skliskosti, pri čemu je sredstvo za povećanje skliskosti stearinska kiselina.

4. Oblik doziranja prema zahtjevu 3, naznačen time što je škrob preželatizirani škrob, proizvoljno

pri čemu je preželatizirani škrob prisutan u količini od oko 18,075 mg; ili

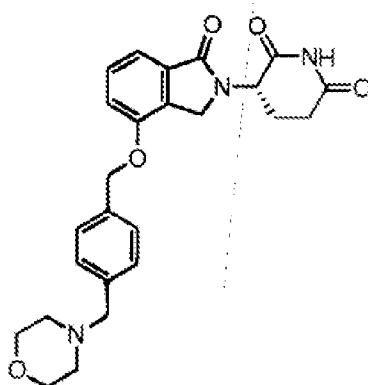
pri čemu je stearinska kiselina prisutna u količini od oko 0,225 mg, ili

pri čemu laktoza je bezvodna laktoza, proizvoljno

pri čemu je bezvodna laktoza prisutna u količini koja daje ukupnu težinu pripravka od oko 75 mg, ili

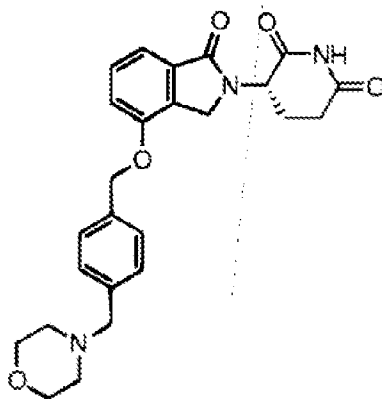
koji je u obliku kapsule veličine 4 ili veće kapsule.

5. Oralni oblik doziranja prema zahtjevu 1, naznačen time što teži oko 75 mg i sadrži: 1) spoj A sa sljedećom strukturom:



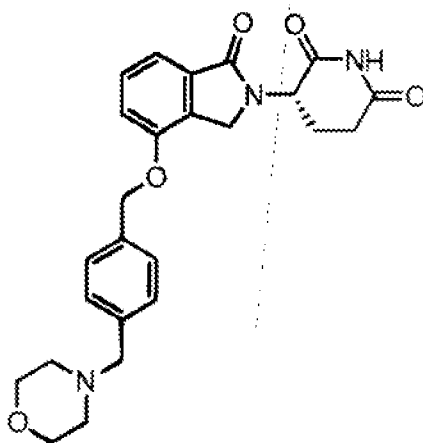
ili njegovu farmaceutski prihvatljivu sol, hidrat, stereoizomer, tautomer ili njihove racemične smjese, u količini koja osigurava 0,1 mg potentnosti spoja A; 2) farmaceutski prihvatljiv nosač ili pomoćnu tvar, pri čemu je nosač ili pomoćna tvar smjesa škroba i laktoze; i 3) sredstvo za povećanje skliskosti, pri čemu je sredstvo za povećanje skliskosti stearinska kiselina.

6. Oblik doziranja prema zahtjevu 5, naznačen time što je škrob preželatizirani škrob, proizvoljno pri čemu je preželatizirani škrob prisutan u količini od oko 18,75 mg, ili pri čemu je stearinska kiselina prisutna u količini od oko 0,225 mg, ili pri čemu laktoza je bezvodna laktoza, proizvoljno pri čemu je bezvodna laktoza prisutna u količini koja daje ukupnu težinu pripravka od oko 75 mg, ili koji je u obliku kapsule veličine 4 ili veće kapsule.
7. Oralni oblik doziranja prema zahtjevu 1, naznačen time što teži oko 150 mg i sadrži: 1) spoj A sa sljedećom strukturom:



ili njegovu farmaceutski prihvatljivu sol, hidrat, stereoizomer, tautomer ili njihove racemične smjese, u količini koja osigurava 0,2 mg potentnosti spoja A; 2) farmaceutski prihvatljiv nosač ili pomoćnu tvar, pri čemu je nosač ili pomoćna tvar smjesa škroba i laktoze; i 3) sredstvo za povećanje skliskosti, pri čemu je sredstvo za povećanje skliskosti stearinska kiselina.

8. Oblik doziranja prema zahtjevu 7, naznačen time što je škrob preželatizirani škrob, proizvoljno pri čemu je preželatizirani škrob prisutan u količini od oko 37,5 mg, ili pri čemu je stearinska kiselina prisutna u količini od oko 0,45 mg, ili pri čemu je laktoza bezvodna laktoza, proizvoljno pri čemu je bezvodna laktoza prisutna u količini koja daje ukupnu težinu pripravka od oko 150 mg, ili koji je u obliku kapsule veličine 3 ili veće kapsule.
9. Oralni oblik doziranja prema zahtjevu 1, naznačen time što teži oko 125 mg i sadrži: 1) spoj A sa sljedećom strukturom:



ili njegovu farmaceutski prihvatljivu sol, hidrat, stereoizomer, tautomer ili njihove racemične smjese, u količini koja osigurava 0,5 mg potentnosti spoja A; 2) farmaceutski prihvatljiv nosač ili pomoćnu tvar, pri čemu je nosač ili pomoćna tvar smjesa škroba i laktoze; i 3) sredstvo za povećanje skliskosti, pri čemu je sredstvo za povećanje skliskosti stearinska kiselina.

10. Oblik doziranja prema zahtjevu 9, naznačen time što je škrob preželatizirani škrob, proizvoljno pri čemu je preželatizirani škrob prisutan u količini od oko 31,25 mg, ili pri čemu je stearinska kiselina prisutna u količini od oko 0,375 mg, ili pri čemu je laktoza bezvodna laktoza, proizvoljno pri čemu je bezvodna laktoza prisutna u količini koja daje ukupnu težinu pripravka od oko 125 mg, ili koji je u obliku kapsule veličine 3 ili veće kapsule.
11. Oralni oblik doziranja prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 10, naznačen time što je za upotrebu u postupku za liječenje, prevenciju ili upravljanje bolešću ili poremećajem, pri čemu postupak sadrži davanje pacijentu oralnog oblika doziranja, pri čemu je bolest ili poremećaj rak, lupus, skleroderma, lupus pernicio, sarkoidoza, Sjogrenov sindrom, ANCA-inducirani vaskulitis, antifosfolipidni sindrom, mijastenija gravis, Addisonova bolest, alopecija areata, ankilozantni spondilitis, sindrom antifosfolipidnog protutijela, antifosfolipidni sindrom, primarni ili sekundarni antifosfolipidni sindrom, astma, autoimuni gastritis, autoimuna hemolitička anemija, autoimuni hepatitis, autoimuna bolest unutarnjeg uha, autoimuna limfoproliferativna bolest, autoimuna trombocitopenijska purpura, Balo bolest, Behcetova bolest, bulozni pemfigoid, kardiomiopatija, celijakija, Chagasova bolest, kronična upalna demijelinacijska polineuropatija, ožiljkasti pemfigoid, naročito pemfigoid sluznice, bolest hladnih aglutinina, Degosova bolest, dermatitis hepatiformis, esencijalna miješana krioglobulinemija, Goodpastureov sindrom, Gravesova bolest, Guillain-Barreov sindrom, Hashimotov tireoiditis (Hashimotova bolest; autoimuni tiroditis), idiopatska plućna fibroza, idiopatska trombocitopenija purpura, IgA nefropatija, juvenilni artritis, lichen planus, Menierova bolest, mješovita bolest vezivnog tkiva, morfea, narkolepsija, neuromiotonija, pedijatrijski autoimuni neuropsihijatrijski poremećaji (PANDA), pemfigus vulgaris, perniciozna anemija, poliarteritis nodoza, polihondritis, polimialgija reumatika, primarna agamaglobulinemija, primarna bilijarna ciroza, Rainaudova bolest (Rainaudov fenomen), Reiterov sindrom, recidivirajući polihondritis, reumatska groznica, Sjogrenov sindrom, sindrom ukočene osobe (Moersch-Woltmannov sindrom), Takayasuov arteritis, temporalni arteritis (arteritis divovskih stanica), uveitis, vaskulitis, naročito vaskulitis koji nije povezan s eritemskim lupusom, vitiligo ili Wegenerova granulomatoza.
12. Oralni oblik doziranja prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 10 za upotrebu prema zahtjevu 11, naznačen time što je bolest ili poremećaj rak, te pri čemu je rak napredujuća maligna bolest, amiloidoza, neuroblastom, meningiom, hemangiopericitom, višestruke moždane metastaze, multiformni glioblastom, glioblastom, gliom moždanog stabla, maligni tumor mozga s lošom prognozom, maligni gliom, anaplastični astrocitom, anaplastični oligodendrogliom, neuroendokrini tumor, rektalni adenokarcinom, rak debelog crijeva Dukes C i D, neodstranjivi kolorektalni karcinom, metastatski hepatocelularni karcinom, Kaposijev sarkom, kriotip akutne mijeloblastne leukemije, Hodgkinov limfom, ne-Hodgkinov limfom, kožni T-stanični limfom, kožni B-stanični limfom, difuzni limfom velikih B-stanica, folikularni limfom niskog stupnja, maligni melanom, maligni mezoteliom, sindrom malignog mezotelioma pleuralnog izljeva, peritonealni karcinom, papilarni serozni karcinom, ginekološki sarkom, sarkom mekog tkiva, sklerodermija, kožni vaskulitis, histiocitoza Langerhansovih stanica, leiomiosarkom, fibrodysplasia ossificans progressiva, rak prostate refraktoran na hormone, operabilni visokorizični sarkom mekog tkiva, neoperabilni hepatocelularni karcinom, Waldenstromova makroglobulinemija, tinjajući mijelom, indolentni mijelom, rak jajovoda, androgen-neovisni karcinom prostate, androgen ovisni ne-metastazirajući rak prostate stupanj IV, rak prostate koji nije osjetljiv na hormone, rak prostate koji nije osjetljiv na kemoterapiju, papilarni karcinom štitnjače, folikularni karcinom štitnjače, medularni karcinom štitnjače ili leiomiom.
13. Oralni oblik doziranja prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 10 za upotrebu prema zahtjevu 11, naznačen time što je bolest ili poremećaj rak, te pri čemu je rak tumor koji se prenosi krvlju, proizvoljno

- 5 pri čemu je rak mijelom, leukemija ili limfom, ili
 pri čemu je rak solidni tumor, proizvoljno
 pri čemu se rak odnosi na rak dojke, rak debelog crijeva, jajnika, prostate, rak gušterače ili rak bubrega, ili
 pri čemu je rak hepatocelularni karcinom, rak prostate, rak jajnika ili glioblastom, ili
 pri čemu je rak ne-Hodgkinov limfom, proizvoljno
 pri čemu je ne-Hodgkinov limfom difuzni limfom velikih B-stanica, naročito
 pri čemu je difuzni limfom velikih B-stanica aktiviranog fenotipa B-stanica, preciznije
 pri čemu se difuzni limfom velikih B-stanica odlikuje ekspresijom jednog ili više biomarkera koji su
 10 prekomjerno eksprimirani u staničnim linijama RIVA, U2932, TMD8 ili OCI-Ly10; ili
 pri čemu je rak multipli mijelom.
14. Oralni oblik doziranja prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 10 za upotrebu prema bilo kojem od zahtjeva 11 do 13, naznačen time što je rak relapsirajući ili refraktoran.
15. Oralni oblik doziranja prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 10 za upotrebu prema bilo kojem od zahtjeva 11 do 14, naznačen time što je rak otporan na lijekove.