(19) 

SUOMI - FINLAND
(FI)

**PATENTTI- JA REKISTERIHALLITUS**
**PATENT- OCH REGISTERSTYRELSEN**
**FINNISH PATENT AND REGISTRATION OFFICE**

(10) **EP/EP3586825 T3**

(12) **EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS**
**ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT**
**TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION**

(45) Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning - Translation available to the public **20.03.2023**

(97) Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för det europeiska patentet - Date of grant of European patent **18.01.2023**

(96) Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan - European patent application EP19169971.9

Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date

(97) Patenttihakemuksen julkiseksitulopäivä - Patentansökans publiceringsdag - Patent application available to the public **01.01.2020**

(30) Etuoikeus - Prioritet - Priority

29.12.2010 US US201061428007 P

(73) Haltija - Innehavare - Holder

**1• MEDINCELL S.A.,** 3, rue des Frères Lumière , 34830 Jacou , (FR)

(72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor

**1• GAUDRIAULT, Georges ,** 25, rue Louis-Martin Berthoud , 34080 Montpellier , (FR)

(74) Asiamies - Ombud - Agent

**Papula Oy ,** PL 981 , 00101 Helsinki , (FI)

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

**BIOHAJOAVAT LÄÄKEAINEEN ANNOSTELUKOOSTUMUKSET**

**Biologiskt nedbrytbara läkemedelsavgivningskompositioner**

**BIODEGRADABLE DRUG DELIVERY COMPOSITIONS**

**PATENTTIVAATIMUKSET**

1. Biohajoava lääkeaineen annostelukoostumus, joka käsittää :

(a) biohajoava kolmilohkokopolymeeri, jolla on kaava:

$A_v$-$B_w$-$A_x$,

jossa A on polyesteri ja B on polyetyleeniglykoli ja v, w ja x ovat toistoyksiköiden lukumäärä, joka on välillä 4-1090 tai 6-1090, ja v = x tai v ≠ x;

(b) biohajoava kaksilohkokopolymeeri, jolla on kaava:

$C_y$-$A_z$,

jossa A on polyesteri ja C on päätyryhmän kohdalta suljettu polyetyleeniglykoli ja y ja z ovat toistoyksiköiden lukumäärä, joka on välillä 3-237 tai 7-371, jossa kohdan (a) biohajoavan kolmilohkokopolymeerin ja kohdan (b) biohajoavan CA-kaksilohkokopolymeerin välinen suhde on 1:3 - 1:8 tai 1:1 - 1:19 tai 3:2 - 1:19 mainitussa biohajoavassa lääkeainekoostumuksessa; ja

(c) vähintään yksi farmaseuttisesti vaikuttava aine.

2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen biohajoava lääkeaineen annostelukoostumus, jossa mainittu koostumus on injektoitava neste huoneenlämmössä ja se muodostaa implantin, kun sitä ruiskutetaan kehoon, tai se on pieninä kiinteinä hiukkasina tai sauvaimplantteina tai spatiaalisina formulaatioina.

3. Patenttivaatimuksen 1 tai patenttivaatimuksen 2 mukainen biohajoava lääkeaineen annostelukoostumus, jossa mainittu polyesteri valitaan ryhmästä, joka koostuu seuraavista: polymaitohappo, polyglykolihappo, polykaprolaktoni, polyetyleeniadipaatti, poly(laktidi-ko-glykolidi)happo ja polyhydroksialkanoaatti.

4. Jonkin patenttivaatimuksista 1–3 mukainen biohajoava lääkeaineen annostelukoostumus, jossa kohdan (a) biohajoavan kolmilohkokopolymeerin ja kohdan (b) biohajoavan CA-kaksilohkokopolymeerin välinen suhde

valitaan seuraavasta ryhmästä: 1:1, 1:2, 1:3, 1:4, 1:5, 1:6, 1:7, 1:8, 1:9, 1:10, 1:11, 1:12, 1: 13, 1:14, 1:15, 1:16, 1:17, 1:18 ja 1:19 tai 3:2.

5. Jonkin patenttivaatimuksista 1–4 mukainen biohajoava lääkeaineen annostelukoostumus, jossa polyetyleeniglykoliketjun koko on välillä 200 Da - 12 kDa tai 194 Da - 12 kDa ja päätyryhmän kohdalta suljetun polyetyleeniglykoliketjun koko on välillä 100 Da - 2 kDa tai 164–2 kDa.

6. Jonkin patenttivaatimuksista 1–5 mukainen biohajoava lääkeaineen annostelukoostumus, joka käsittää lisäksi farmaseuttisesti hyväksyttävän kantaja-aineen.

7. Jonkin patenttivaatimuksista 1–6 mukainen biohajoava lääkeaineen annostelukoostumus, jossa mainittua ainakin yhtä farmaseuttisesti vaikuttavaa ainetta on määränä, joka on 1 % - 20 % (painoprosentti/painoprosentti) kokonaiskoostumuksesta.

8. Jonkin patenttivaatimuksista 1–7 mukainen biohajoava lääkeaineen annostelukoostumus, jossa polymeerejä on määränä, joka on 20 % - 50 % (painoprosentti/painoprosentti) kokonaiskoostumuksesta; ja/tai jossa kolmilohkokopolymeeriä on määränä, joka on 3,0 % - 45 % (painoprosentti/painoprosentti) kokonaiskoostumuksesta; ja/tai jossa kaksilohkokopolymeeriä on määränä, joka on 8,0 % - 50 % (painoprosentti/painoprosentti) kokonaiskoostumuksesta.

9. Jonkin patenttivaatimuksista 1–8 mukainen biohajoava lääkeaineen annostelukoostumus, jossa polyesterin toistoyksikön ja etyleenioksidin välinen moolisuhde koostumuksessa on välillä 0,5–3,5 tai 0,5–22,3 kolmilohkossa ja 2–6 tai 0,8–13 kaksilohkossa.

10. Jonkin edellä olevista patenttivaatimuksista mukainen biohajoava lääkeaineen annostelukoostumus, jossa A on PLA, C on mPEG; ja jossa kohdan (a) biohajoavan kolmilohkokopolymeerin ja kohdan (b)

biohajoavan kaksilohkokopolymeerin välinen suhde on 1:6 mainitussa biohajoavassa lääkeainekoostumuksessa.

11. Jonkin patenttivaatimuksista 1–9 mukainen biohajoava lääkeaineen annostelukoostumus, jossa A on PLA, C on mPEG; biohajoavaa kolmilohkokopolymeeriä on mukana määränä, joka on 3,0 % - 45 % (painoprosentti/painoprosentti) kokonaiskoostumuksesta; v, w ja x ovat toistoyksiköiden lukumäärä, joka on välillä 6-1090, ja v = x tai v ≠ x; biohajoavaa kaksilohkokopolymeeriä on mukana määränä, joka on 8,0 % - 50 % (painoprosentti/painoprosentti) kokonaiskoostumuksesta; kohdan (a) biohajoavan kolmilohkokopolymeerin ja kohdan (b) biohajoavan kaksilohkokopolymeerin välinen suhde on 1:4 mainitussa biohajoavassa lääkeainekoostumuksessa; ja mainittua ainakin yhtä farmaseuttisesti vaikuttavaa ainetta on mukana määränä, joka on 1 % - 20 % (painoprosentti/painoprosentti) kokonaiskoostumuksesta.

12. Patenttivaatimuksen 10 tai patenttivaatimuksen 11 mukainen biohajoava lääkeaineen annostelukoostumus, jossa mainittu koostumus on injektoitava neste huoneenlämmössä ja se muodostaa implantin, kun sitä injektoidaan kehoon, tai se on pieninä kiinteinä hiukkasina tai sauvaimplantteina tai spatiaalisina formulaatioina.

13. Menetelmä patenttivaatimuksen 1 tai patenttivaatimuksen 2 mukaisen biohajoavan lääkeaineen annostelukoostumuksen valmistamiseksi, jossa mainittu menetelmä käsittää seuraavat:

(i) liuotetaan orgaaniseen liuottimeen (a) biohajoava ABA-tyyppinen lohkokopolymeeri, jolla on seuraava kaava:

$A_v$-$B_w$-$A_x$,

jossa A on polyesteri ja B on polyetyleeniglykoli ja v, w ja x ovat toistoyksiköiden lukumäärä, joka on välillä 4–1090 tai 6–1090; ja

(b) biohajoava kaksilohkokopolymeeri, jolla on seuraava kaava:

$C_y$-$A_z$,

jossa A on polyesteri ja C on päätyryhmän kohdalta suljettu polyetyleeniglykoli ja y ja z ovat toistoyksiköiden lukumäärä, joka on välillä 3-237 tai 7-371, suhteessa 1:3 - 1:8 tai 1:1 - 1:19 tai 3,2 - 1:19 (a):(b), polymeeriseoksen muodostamiseksi; ja

(ii) lisätään ainakin yhtä farmaseuttisesti vaikuttavaa ainetta mainittuun polymeeriseokseen.

14. Patenttivaatimuksen 13 mukainen menetelmä, jossa suhde (a):(b) on 1:6 ja jossa menetelmä käsittää lisäksi (iii) mainitun liuottimen haihduttamisen.

15. Patenttivaatimuksen 13 tai patenttivaatimuksen 14 mukainen menetelmä, jossa orgaaninen liuotin valitaan seuraavasta ryhmästä: bentsyylialkoholi, bentsyylibentsoaatti, dietyleeniglykolidimetyylieetteri (Diglyme), dietyleeniglykolimonoetyylieetteri (DEGMEE), dimetyyli-isosorbidi (DMI), dimetyylisulfoksidi (DMSO), etyyliasetaatti, etyylibentsoaatti, etyylilaktaatti, etyleeniglykolimonoetyylieetteriasetaatti, glyseroliformaali, metyylietyyliketoni, metyyli-isobutyyliketoni, N-etyyli-2-pyrrolidoni, N-metyyli-2-pyrrolidinoni (NMP), pyrrolidoni-2, tetraglykoli, triasetiini, tributyriini, tripropioniini tai trietyleeniglykolidimetyylieetteri (triglyme) ja niiden seokset.

16. Jonkin patenttivaatimuksista 13-15 mukainen menetelmä, jossa orgaanista liuotinta on mukana määränä, joka on 40 % - 74 % (painoprosentti/painoprosentti) kokonaiskoostumuksesta.

17. Jonkin patenttivaatimuksista 1-12 mukaisen biohajoavan lääkeaineen annostelukoostumuksen käyttö eläinten tai kasvien sairauksien hoitoon tarkoitetun lääkkeen valmistusta varten.

18. Jonkin patenttivaatimuksista 1-12 mukainen biohajoava lääkeaineen annostelukoostumus käytettäväksi lääkinnässä.