(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator dokumenta:

HR P20241735 T1

HR P20241735 T1

(12) PRIJEVOD PATENTNIH ZAHTJEVA EUROPSKOG PATENTA

(51) MKP:
A61K 9/48 (2006.01)
A61K 31/451 (2006.01)
A61K 47/10 (2017.01)
A61K 47/14 (2017.01)
A61K 47/40 (2006.01)
A61K 47/44 (2017.01)
A61P 29/00 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 28.02.2025.

(21) Broj predmeta: P20241735T

(22) Datum podnošenja : 27.11.2019.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 23160271.5
Datum podnošenja europske prijave patenta: 27.11.2019.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 4233850 A2
Datum objave europske prijave patenta: 30.08.2023.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 4233850 B1
Datum objave europskog patenta: 02.10.2024.

(31) Broj prve prijave: 201862773848 P (32) Datum podnošenja prve prijave: 30.11.2018. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US
(62) Broj i datum prvobitne prijave u slučaju podjele patenta: 19889873.6 27.11.2019.

(73) Nositelj patenta: **ChemoCentryx, Inc., One Amgen Center Drive, Thousand Oaks, CA 91320, US**

(72) Izumitelji: **Manmohan Reddy Leleti, CA 94568, US**
Jay P Powers, CA 94044, US

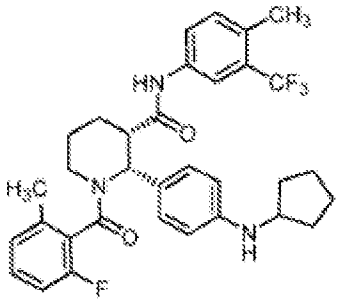
(74) Zastupnik: Odvjetnik Tomislav Hadžija, u suradnji sa DENNEMEYER & ASSOCIATES, 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma: FORMULACIJE KAPSULA

HR P20241735 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

1. Formulacija kapsule čvrste otopine koja sadrži spoj 1 kao slobodnu bazu, u njenom neutralnom obliku



(spoj 1)

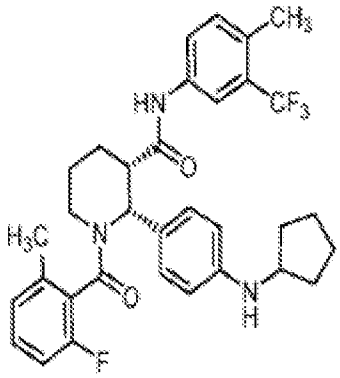
i nosač koji sadrži

najmanje jedan ne-ionski surfaktant koji je odabran iz grupe koju čine polioksietilen 40 ricinusovo ulje, makrogol-40-glicerol hidroksistearat, makrogolglicerol ricinoleat, makrogol-15-hidroksistearat, polioksietilen 60 ricinusovo ulje, polioksietilen 60 hidrogenizovano ricinusovo ulje, polioksietilen 100 hidrogenizovano ricinusovo ulje, polioksietilen 200 ricinusovo ulje, i polioksietilen 200 hidrogenizovano ricinusovo ulje, i

najmanje jedan solubilizator topiv u vodi koji je odabran iz grupe koju čine PEG-1000, PEG-1500, PEG-1540, PEG-2000, PEG-3000, PEG-3350, PEG-4000, PEG-6000, PEG-8000, PEG-10000, PEG-20000, poloksamer 188, poloksamer 237, poloksamer 338, i poloksamer 407.

2. Formulacija kapsule čvrste otopine prema patentnom zahtjevu **1,**
   (a) gdje nosač sadrži oko 97 do 99% po masi od ukupne mase punjenja navedene formulacije kapsule čvrste otopine i/ili
   (b) sadrži oko 1 do 3% spoja 1 po masi od ukupne mase punjenja navedene formulacije kapsule čvrste otopine.
3. Formulacija kapsule čvrste otopine prema patentnom zahtjevu **2,**
   (a) gdje nosač sadrži oko 98% po masi od ukupne mase punjenja navedene kapsule čvrste otopine; i/ili
   (b) sadrži oko 2% spoja 1 po masi od ukupne mase punjenja navedene formulacije kapsule čvrste otopine.
4. Formulacija kapsule čvrste otopine prema bilo kojem od patentnih zahtjeva **1** do **3,** gdje:
   (a) ukupnu masu nosača čini najmanje jedan ne-ionski surfaktant prema najmanje jednom solubilizatoru koji je topiv u vodi u odnosu 30:70 do 65:35.; ili
   (b) ukupnu masu nosača čini najmanje jedan ne-ionski surfaktant prema najmanje jednom solubilizatoru koji je topiv u vodi u odnosu 35:65 do 65:35; ili
   (c) ukupnu masu nosača čini najmanje jedan ne-ionski surfaktant prema najmanje jednom solubilizatoru koji je topiv u vodi u odnosu 40:60 do 60:40; ili
   (d) ukupnu masu nosača čini najmanje jedan ne-ionski surfaktant prema najmanje jednom solubilizatoru koji je topiv u vodi u odnosu 45:55 do 55:45; ili
   (e) ukupnu masu nosača čini najmanje jedan ne-ionski surfaktant prema najmanje jednom solubilizatoru koji je topiv u vodi u odnosu oko 50:50.
5. Formulacija kapsule čvrste otopine prema bilo kojem od patentnih zahtjeva **1** do **4,**
   pri čemu najmanje jedan ne-ionski surfaktant jest makrogol-40-glicerol hidroksistearat ili makrogolglicerol ricinoleat.
6. Formulacija kapsule čvrste otopine prema patentnom zahtjevu 5, pri čemu najmanje jedan ne-ionski surfaktant jest makrogol-40-glicerol hidroksistearat.
7. Formulacija kapsule čvrste otopine prema bilo kojem od patentnih zahtjeva **1** do **6,**
   pri čemu najmanje jedan solubilizator topiv u vodi je izabran iz grupe koju čine PEG-1540, PEG-2000, PEG-3000, PEG-3350, PEG-4000, PEG-6000.
8. Formulacija kapsule čvrste otopine prema patentnom zahtjevu 7**,** pri čemu najmanje jedan solubilizator topiv u vodi jest PEG-4000.
9. Formulacija kapsule čvrste otopine prema bilo kojem od patentnih zahtjeva **1** do **8,**
   pri čemu:
   (a) ukupna masa punjenja navedene kapsule čvrste otopine jest od oko 130 mg do 900 mg, poželjno gdje ukupna masa punjenja navedene kapsule čvrste otopine je oko 500 mg; i/ili
   (b) veličina kapsule bira se iz grupe koja se sastoji od #00, #0, #1, #2, #3, #4, ili #5, poželjno pri čemu veličina kapsule jest #0; i/ili
   (c) kapsula je tvrda kapsula.
10. Formulacija kapsule čvrste otopine kao što je definirano prema bilo kojem od patentnih zahtjeva **1** do **9** za upotrebu u postupku za liječenje pojedinca koji pati od ili je podložan bolesti ili poremećaju koji uključuju patološku aktivaciju C5a receptora, postupak obuhvaća davanje pojedincu efikasne količine formulacije kapsule čvrste otopine.
11. Formulacija kapsule čvrste otopine za upotrebu prema patentnom zahtjevu **10**, pri čemu je bolest ili poremećaj upalna bolest ili poremećaj.

12. Formulacija kapsule čvrste otopine za upotrebu prema patentnom zahtjevu **11**, pri čemu je bolest ili poremećaj izabrana iz grupe koja se sastoji iz neutropenije, sepse, septičkog šoka, Alzheimerove bolesti, multiple skleroze, moždanog udara, upalne bolesti crijeva, starosne degeneracije makule, kroničnog opstruktivnog poremećaja pluća, upale povezane s opekotinama, povrede pluća, osteoartritisa, atopijskog dermatitisa, kronične urtikarije, iskemijsko-reperfuzijske povrede, akutnog respiratornog distres sindroma, sindroma sistemskog inflamatornog odgovora, sindroma višestruke disfunkcije organa, odbacivanja presađenog tkiva, raka i hiperaktivnog odbacivanja presađenih organa.
13. Formulacija kapsule čvrste otopine za upotrebu prema patentnom zahtjevu **10,** pri čemu bolest ili poremećaj je kardiovaskularni ili cerebrovaskularni poremećaj.
14. Formulacija kapsule čvrste otopine za upotrebu prema patentnom zahtjevu **13**, pri čemu je bolest ili poremećaj izabran iz grupe koja se sastoji od infarkta miokarda, koronarne tromboze, vaskularne okluzije, postoperativne vaskularne reokluzije, arteroskleroze, traumatske povrede centralnog živčanog sistema i iskemijske bolesti srca.
15. Formulacija kapsule čvrste otopine za upotrebu prema patentnom zahtjevu **10,** pri čemu je bolest ili poremećaj autoimuni poremećaj.
16. Formulacija kapsule čvrste otopine prema patentnom zahtjevu **15,** pri čemu je bolest ili poremećaj odabran od grupe koja se sastoji iz reumatoidnog artritisa, C3 glomerulopatije (C3G), *hidradenitis suppurativa* (HS), sistemskog eritematoznog lupusa, Guillain -Barreov (*Guillain-Barre*) sindroma, pankreatitisa, lupus nefritisa, lupus glomerulonefritisa, psorijaze, imunoglobulin A (IgA) nefropatije, Kronove (*Crohn*) bolesti, vaskulitisa, sindroma iritabilnog crijeva, dermatomiozitisa, multiple skleroze, bronhijalne astme, pemfigusa, pemfigoida, skleroderme, mijastenije gravis, autoimunih hemolitičkih i trombocitopeničnih stanja, Gudpasturovog (*Goodpasture*) sindroma, imunskog vaskulitisa, odbacivanja presađenog tkiva i hiperakutnog odbacivanja presađenih organa.
17. Formulacija kapsule čvrste otopine za upotrebu prema patentnom zahtjevu **10,** pri čemu je bolest ili poremećaj:
    (a) patološka posljedica povezana s grupom koja se sastoji od inzulin zavisnog dijabetesa, melitusa, lupusne nefropatije, Heymanovog (*Heyman*) nefritisa, membranoznog nefritisa, glomerulonefritisa, reakcija osjetljivosti na kontakt, i zapaljenja koje je posljedica kontakta krvi sa vještačkim površinama; ili
    (b) bira se iz grupe koja se sastoji od vaskulitisa povezanog s antineutrofilnim citoplazmatskim antitijelom (ANCA), C3 glomerulopatije, *hidradenitis suppurativa*, i lupusnog nefritisa; ili
    (c) vaskulitis s anti-neutrofilnim citoplazmatskim antitijelom (ANCA); ili
    (d) C3 glomerulopatije; ili
    (d) *hidradenitis suppurativa* ili
    (e) lupusnog nefritisa.
18. Kapsula s jediničnim dozom koja sadrži oko 2.6 mg do 25.2 mg spoja 1 kao slobodnu bazu, u njenom neutralnom obliku



(spoj 1)

    i nosač koji sadrži
    makrogol-40-glicerol hidroksistearat, i
    PEG-4000
    gdje ukupnu masu nosača čini makrogol-40 glicerol hidroksistearat prema PEG-4000 u odnosu oko 50:50.
19. Kapsula s jediničnom dozom prema patentnom zahtjevu **18**, koja sadrži oko 2.6 mg do 18 mg spoja 1 kao slobodnu bazu, u njenom neutralnom obliku.
20. Kapsula s jediničnim dozom prema patentnom zahtjevu **19**, koja sadrži oko 10 mg spoja 1 kao slobodnu bazu, u njenom neutralnom obliku.
21. Kapsula s jediničnom dozom prema bilo kojem od patentnih zahtjeva **18** do **20,** pri čemu ukupna masa punjenja navedene kapsule čvrste otopine je od oko 130 mg do 900 mg.
22. Komplet koji sadrži jednu ili više formulacija kapsula čvrste otopine prema bilo kojem od patentnih zahtjeva **1** do **9,** ili jednu ili više jediničnih doza prema bilo kojem od patentnih zahtjeva **18** do **21.**