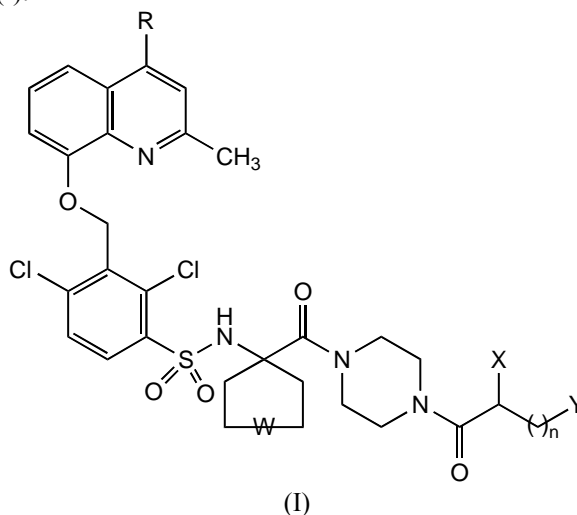


## PATENTNI ZAHTJEVI

- 5 1. Farmaceutski pripravci koji sadrži kortikosteroid i antagonist kininskog B2 receptora skupa s farmaceutski prihvatljivim nosačima i ekscipijensima, **naznačen time** da je
- a) kortikosteroid, prirodni ili sintetski, odabran od sljedećih: kortizon, hidrokortizon, beklometazon, betametazon, budezonid, deksametazon, flumetazon, flunisolid, fluokorton, flutikazon, metilprednisolon, metilprednison, parametazon, prednisolon, triamcinolon, koji mogu tvoriti ester s octenom, benzojevom, kapronskom, jantarnom, fosfornom ili valerijnskom kiselinom ili tvoriti acetonid,
- 10 b) antagonist kininskog B2 receptora odabran od sljedećih:
- H-D=Arg-Arg-Pro-Hyp-Gly-Igl-Ser-D-FSF-Igl-Arg-OH,
  - H-Arg-Arg-Pro-Hyp-Gly-Igl=Ser-D-Igl-Oic-Arg-OH,
  - H-D-Arg-Arg-Pro-Hyp-Gly-Thi-Ser-D-Tic-Oic-Arg-OH (ikatibant),
  - 15 - 4-[2-(((3-(3-brom-2-metil-imidazo[1.2-a]piridin-8-il oksimetil)-2,4-diklor-fenil]-metil-karbamoil)-metil-karbamoil)-vinil]-N,N-dimetil-benzamid,
  - 3-(6-acetilamino-piridin-3-il)-N-([[2,4-diklor-3-(2-metil-kinolin-8-il oksimetil)-fenil]-metil-karbamoil]-metil)-akrilamid,
  - 1-[2,4-diklor-3-(2,4-dimetil-kinolin-8-il oksimetil)-benzen sulfonil]-pirolidin-2-karboksilna kiselina, [3-(4-karbamidoil-benzoilamino)-propil]-amid (anatibant),
  - 20 - bradizid,
  - 4-(4-[1-[2,4-diklor-3-(2,4-dimetil-kinolin-8-iloksimetil)-benzensulfonil]-pirolidin-2-karbonil]-piperazin-1-karbonil)-benzamidin,
  - 2-[5-(4-cijano-benzoil)-1-metil-1H-pirol-2-il]-N-[2,4-diklor-3-(2-metil-kinoline-8-il-1-oksimetil)-fenil]-N-metil-acetamid,
  - 25 - spoj opće formule (I):



- u kojoj
- 30 R jest vodik ili metil;
- W predstavlja jednostruku vezu ili kisikov atom,
- n = 3, 4,
- X je vodik ili amino-skupina -NR<sub>1</sub>R<sub>2</sub> u kojoj R<sub>1</sub> i R<sub>2</sub> neovisno jedan od drugog jesu vodik ili skupina odabrana od sljedećih: metil, etil, n-propil, izopropil,
- 35 Y je kvaterna amonijeva sol -NR<sub>3</sub>R<sub>4</sub>R<sub>5</sub> u kojoj R<sub>3</sub>, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub>, neovisno jedan od drugog jesu metil, etil, n-propil, izopropil, butil, izobutil, n-pentil,
- A<sup>-</sup> je anion koji se formalno izvodi od farmaceutski prihvatljive kiseline, njene farmaceutski prihvatljive soli, enantiomera i enantiomerne smjese.
2. Farmaceutski pripravak prema patentnom zahtjevu 1, **naznačen time** da antagonist kininskog B2 receptora jest ikatiban ili spoj opće formule (I).
- 40 3. Farmaceutski pripravak prema patentnom zahtjevu 2, **naznačen time** da rečeni antagonist kininskog B2 receptora u skladu s općom formulom (1) jest spoj (4-(S)-amino-5-(4-{4-[2,4-diklor-3-(2,4-dimetil-kinolin-8-iloksimetil)-benzensulfonilamino]-tetrahydro-piran-4-karbonil}-piperazin-1-il)-5-oksi-pentil]-trimetil-amonijeva sol klorovodične, octene, sumporne, trifluoroctene, metansulfonske, jantarne ili etilendiaminotetraoctene kiseline, preferirano u obliku bis-hidrokidnog klorida (MEN16132).
- 45 4. Farmaceutski pripravak prema patentnim zahtjevima 1-3, **naznačen time** da količina kortikosteroida po jediničnoj dozi iznosi 0.01–100 mg, preferirano 0.1–10 mg.

5. Farmaceutski pripravak prema patentnim zahtjevima 1-4, **naznačen time** da je količina antagonista kininskog B2 receptora po jediničnoj dozi u rasponu od  $6 \times 10^{-5}$  do  $2 \times 10^{-2}$ , preferirano od  $1 \times 10^{-4}$  do  $1 \times 10^{-2}$ , preferiranije od  $3 \times 10^{-4}$  do  $6 \times 10^{-3}$  mmol, što odgovara količini MEN16132 u rasponu od 0.05 do 17, od 0.09 do 9, odnosno od 0.26 do 5 mg po jediničnoj dozi.
- 5 6. Farmaceutski pripravak prema patentnim zahtjevima 1-5, **naznačen time** da je u obliku intra-artikularne ili intrabukalne otopine za injekcije ili u transdermalnom obliku odabranom od sljedećih: krema, gel, transdermalni zavoj, očne kapi, sprej ili aerosolne otopine, te nazalni sprej.
7. Farmaceutski pripravak prema patentnom zahtjevu 6, **naznačen time** da je rečeni antagonist kininskog B2 receptora kristalinična, amorfna ili liofilizirana krutina koju valja otopini prije upotrebe otopine koja sadrži kortikosteroid, čime nastaje intrabruskalna otopina za injekciju.
- 10 8. Farmaceutski pripravak prema patentnim zahtjevima 1-7, **naznačen time** da dalje sadrži, neovisno jedne od drugih, fosfatnu ili citratnu sol kao pufer, natrijev klorid kao sredstvo za toničnost, natrijev edetat kao konzervans i sredstvo za keliranje.
- 15 9. Upotreba kombinacije kortikosteroida i antagonista kininskog B2 receptora prema patentnom zahtjevu 1, **naznačena time** da su kortikosteroid antagonista kininskog B2 receptora, u skladu s patentnim zahtjevom 1, za pripremu lijeka za prevenciju ili terapiju sljedećih: artikularna upala, lezija i degeneracija, a posebice osteoartritis i posttraumatski osteoartritis, osteoartroza (gonartroza, spondilartroza), spondiloza, sinovitis, tenosinovitis, bursitis, kontuzija, distrozija, dislokacija i subdislokacija te artropatija uzrokovana alteracijom rasta kao što je osteokondroza i displazija.
- 20 10. Upotreba kombinacije kortikosteroida i antagonista kininskog B2 receptora prema patentnom zahtjevu 1, **naznačena time** da je za pripremu lijeka za prevenciju i terapiju upala respiratornog trakta dermatoloških i oftalmoloških bolesti, alergijskih ili nealergijskih, kroničnih ili akutnih, posebice sljedećih: astma, rinitis, opstruktivna kronična bronhopatija, dermatitis od opekline (sunca ili topline), dermatitis ili ekcem zbog izlaganja alergenima ili tvarima koje zrače, atopični dermatitis, autoimuni dermatitis (psorijaza), blefaritis, konjunktivitis i befarokonjunktivitis.
- 25 11. Upotreba kombinacije kortikosteroida i antagonista kininskog B2 receptora prema patentnim zahtjevima 9 ili 10, **naznačena time** da rečeni antagonist kininskog B2 receptora jest MEN 16132.