



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20171044 T1

HR P20171044 T1

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

(51) MKP:

A01N 47/28 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 06.10.2017.

(21) Broj predmeta: P20171044T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 10.07.2017.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2012044372
Datum podnošenja međunarodne prijave: 27.06.2012.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 12803924.5
Datum podnošenja europske prijave patenta: 27.06.2012.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2013003444
Datum međunarodne objave: 03.01.2013.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2723176 A1
Datum objave europske prijave patenta: 30.04.2014.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2723176 B1
Datum objave europskog patenta: 12.04.2017.

(31) Broj prve prijave: 201161501524 P (32) Datum podnošenja prve prijave: 27.06.2011. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelj patenta:

**Parion Sciences, Inc., 2800 Meridian Parkway, Suite 195, 27713 Durham,
NC 27713, US**

(72) Izumitelj:

Michael, Ross Johnson, 53524 Bickett, 27517 Chapel Hill, NC, US

(74) Zastupnik:

Hraste & Partneri odvjetničko društvo, 10000 Zagreb, HR

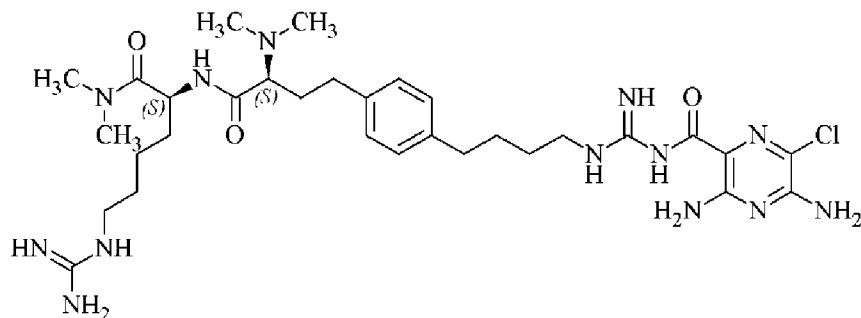
(54) Naziv izuma:

**KEMIJSKI I METABOLIČKI STABILNI DIPEPTID S POTENTNOM AKTIVNOŠĆU BLOKATORA
NATRIJEVOG KANALA**

HR P20171044 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Spoj, **naznačen time** što ga prikazuje formula (I):

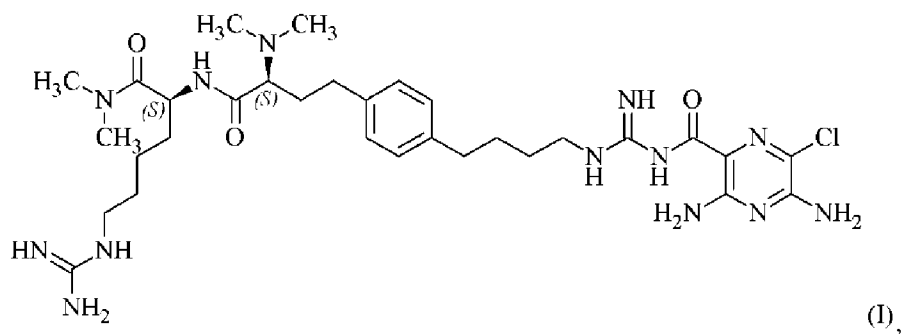


(I),

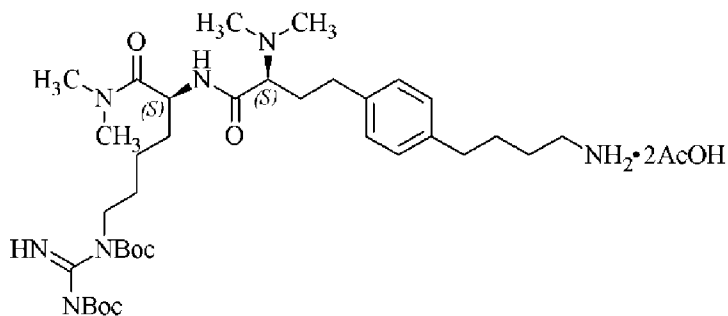
te njegovi racemati, enantiomeri, diastereomeri, tautomeri, polimorfi, pseudopolimorfi i farmaceutski prihvatljive soli.

2. Spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačen time** što je kiselna adicijska sol anorganske kiseline ili organske kiseline koju se bira iz skupine koju čine klorovodična kiselina, bromovodična kiselina, sumporna kiselina, fosforna kiselina, dušična kiselina, octena kiselina, oksalna kiselina, vinska kiselina, jantarna kiselina, maleinska kiselina, furmarna kiselina, glukonska kiselina, limunska kiselina, jabučna kiselina, askorbinska kiselina, benzojeva kiselina, taninska kiselina, palmitinska kiselina, alginska kiselina, poliglutaminska kiselina, naftalensulfonska kiselina, metansulfonska kiselina, *p*-toluensulfonska kiselina, naftalendisulfonska kiselina, poligalakturonska kiselina, malonska kiselina, sulfosalicilna kiselina, glikolna kiselina, 2-hidroksi-3-naftoat, pamoat, salicilna kiselina, stearinska kiselina, ftalna kiselina, bademova kiselina, te mliječna kiselina.
3. Farmaceutski pripravak, **naznačen time** što sadrži spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1 ili patentnim zahtjevom 2, kao i farmaceutski prihvatljivu podlogu.
4. Pripravak, **naznačen time** što sadrži:
spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1 ili patentnim zahtjevom 2; i
agonist receptora P2Y2.
5. Pripravak, **naznačen time** što sadrži:
spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1 ili patentnim zahtjevom 2; i
bronhodilator.
6. Spoj u skladu s patentnim zahtjevima 1 ili 2, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi u poticanje vlaženja površine sluznice, gdje se djelotvornu količinu spoja u skladu s patentnim zahtjevima 1 ili 2 primjenjuje na površinu sluznice subjekta.
7. Spoj u skladu s patentnim zahtjevima 1 ili 2, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi u liječenju kroničnog bronhitisa, liječenju bronhiektazije, liječenju cistične fibroze, liječenju sinusitisa, liječenju suhoće vagine, liječenju suhog oka, poticanju vlaženja oka, poticanju vlaženja rožnice, poticanju čišćenja sluzi na površinama sluznica, liječenju Sjögrenove bolesti, liječenju sindroma opstrukcije distalnog crijeva, liječenju suhe kože, liječenju ezofagitisa, liječenju suhih ustiju, liječenju dehidracije nosa, liječenju pneumonije uzrokovane respiratorom, liječenju astme, liječenju primarne cilijarne diskinezije, liječenju upale srednjeg uha, poticanju stvaranja ispljuvka u dijagnostičke svrhe, liječenju kronične opstruktivne plućne bolesti, liječenju emfizema, liječenju pneumonije, liječenju opstipacije, liječenju kroničnog divertikulitisa ili liječenje rinosinusitisa.
8. Pripravak koji sadrži osmolit i spoj u skladu s patentnim zahtjevima 1 ili 2, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi u liječenju jednog ili više stanja koja se bira iz skupine koju čine kronični bronhitis, bronhiektazija, cistična fibroza, sinusitis, suhoća vagine, suho oko, Sjögrenova bolest, sindrom opstrukcije distalnog crijeva, suha koža, ezofagitis, suha usta (kserostomija), dehidracija nosa, astma, primarna cilijarna diskinezija, upala srednjeg uha, kronična opstruktivna plućna bolest, emfizem, pneumonija, divertikulitis, rinosinusitis, te kapljične infekcije.
9. Pripravak namijenjen upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 8, **naznačen time** što se spoj primjenjuje na subjektu prije primjene osmolita.
10. Pripravak namijenjen upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 8, **naznačen time** što se spoj primjenjuje na subjektu istodobno s primjenom osmolita.
11. Pripravak namijenjen upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 8, **naznačen time** što se spoj primjenjuje na subjektu nakon primjene osmolita.
12. Pripravak namijenjen upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 8, **naznačen time** što je osmolit hipertonična slana otopina ili manitol.
13. Pripravak namijenjen upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 8, **naznačen time** što je osmolit natrijev klorid, kojeg se unosi u subjektu kao mikronizirane čestice veličine pogodne za udisanje.

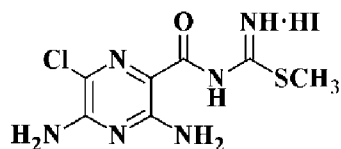
14. Pripravak namijenjen upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 8, **naznačen time** što se djelotvornu količinu osmolita i blokator natrijevog kanala primjenjuje na subjektu aerosoliziranjem uz pomoć uređaja koji može unijeti formulaciju u nosne prolaze ili plućne dišne puteve, gdje je aerosol veličine pogodne za udisanje.
15. Pripravak, **naznačen time** što sadrži:
- 5 (a) spoj u skladu s patentnim zahtjevom 1 ili patentnim zahtjevom 2 i (b) osmotski aktivni spoj.
16. Spoj u skladu s patentnim zahtjevima 1 ili 2, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi u poticanju stvaranja ispljuvka, gdje se djelotvornu količinu osmolita i spoj u skladu s patentnim zahtjevima 1 ili 2 primjenjuje na subjektu kojem je potrebno pojačano čišćenje mukocilijarnog epitela i vlaženje sluznice.
- 10 17. Spoj u skladu s patentnim zahtjevima 1 ili 2, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi u profilaksi, profilaksi nakon izlaganja, preventivnom ili terapijskom liječenju protiv bolesti ili stanja koja uzrokuju patogeni, gdje se djelotvornu količinu spoja u skladu s patentnim zahtjevima 1 ili 2 primjenjuje na subjektu kojem je potrebno pojačano čišćenje mukocilijarnog epitela i vlaženje sluznice.
18. Spoj namijenjen upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 17, **naznačen time** što je patogen bedrenica ili kuga.
- 15 19. Pripravak koji sadrži osmolit i spoj u skladu s patentnim zahtjevima 1 ili 2, **naznačen time** što je namijenjen upotrebi u profilaksi, profilaksi nakon izlaganja, preventivnom ili terapijskom liječenju protiv bolesti ili stanja koja uzrokuju patogeni, gdje se djelotvornu količinu osmolita i spoja u skladu s patentnim zahtjevima 1 ili 2 primjenjuje na subjektu kojem je potrebno pojačano čišćenje mukocilijarnog epitela i vlaženje sluznice.
20. Pripravak namijenjen upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 19, **naznačen time** što je patogen bedrenica ili kuga.
- 20 21. Postupak pripreme spoja formule I



naznačen time što se sastoji u koraku reakcije spoja sljedeće formule:



sa spojem sljedeće formule:



u prisutnosti DIPEA, u EtOH, kako bi se dobio sljedeći spoj kao međuprodukt:

