



(19) REPUBLIKA HRVATSKA  
DRŽAVNI ZAVOD ZA  
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO



(10) Identifikator  
dokumenta:

HR P20201524 T1

HR P20201524 T1

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

(51) MKP:

**C07D 261/08** (2006.01)

**A61K 31/42** (2006.01)

**A61P 31/04** (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 05.03.2021.

(21) Broj predmeta: P20201524T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 23.09.2020.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/IB2017053468  
Datum podnošenja međunarodne prijave: 12.06.2017.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 17739696.7  
Datum podnošenja europske prijave patenta: 12.06.2017.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2017216705  
Datum međunarodne objave: 21.12.2017.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3468957 A1  
Datum objave europske prijave patenta: 17.04.2019.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3468957 B1  
Datum objave europskog patenta: 26.08.2020.

(31) Broj prve prijave: PCT/CN2016/085694 (32) Datum podnošenja prve prijave: 14.06.2016. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: WO

(73) Nositelj patenta:

**NOVARTIS AG, Lichtstrasse 35, 4056 Basel, CH**

(72) Izumitelji:

**Jiping Fu, Emeryville, CA 94608, US**

**Siyi Jiang, Shanghai 201203, CN**

**Andreas Kordikowski, 4002 Basel, CH**

**Zachary Kevin Sweeney, Redwood City, CA 94602, US**

(74) Zastupnik:

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

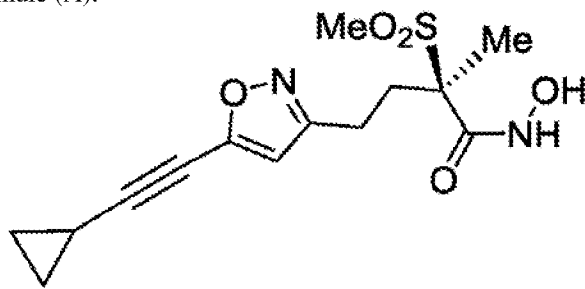
(54) Naziv izuma:

**KRISTALNI OBLIK (R)-4-(5-(CIKLOPROPILETINIL) IZOKSAZOL-3 -IL)-N-HIDROKSI-2-METIL-2-(METILSUFONIL) BUTANAMID KAO ANTIBAKTERIJSKO SREDSTVO**

HR P20201524 T1

## PATENTNI ZAHTJEVI

1. Kristalni oblik spoja formule (A):



- 5 2. Kristalni oblik prema zahtjevu 1 koji ima malu higroskopsnost, pokazuje porast mase manji od 5% kada je suhi uzorak izložen relativnoj vlazi do 80%.
3. Kristalni oblik prema zahtjevu 1, koji sadrži kristale u obliku štapića.
4. Kristalni oblik prema zahtjevu 1, koji pokazuje endotermu na diferencijalnoj skenirajućoj kalorimetriji između 75 °C i 90 °C.
- 10 5. Kristalni oblik prema zahtjevu 1, **naznačen time što** su XRPD vrhovi pod kutovima difrakcije (2Theta) od 18.4 i 14.0 stupnjeva.
6. Kristalni oblik prema zahtjevu 5, nadalje **naznačen** jednim ili više dodatnih XRPD vrhova pod kutovima difrakcije (2Theta) od 3.9 i 2.5 i 4.4 stupnja.
7. Kristalni oblik prema bilo kojem od zahtjeva 5-6, nadalje **naznačen** jednim ili više dodatnih XRPD vrhova pod kutovima difrakcije (2Theta) od 18.8 i / ili 5.3 stupnja i / ili 21.8 stupnjeva i / ili 22.1 stupnja i / ili 18.0 stupnjeva.
- 15 8. Kristalni oblik prema bilo kojem od zahtjeva 5-7, nadalje **naznačen** dodatnim XRPD vrhovima pod kutovima difrakcije (2Theta) od 18.8 i 5.3 stupnja.
9. Kristalni oblik prema zahtjevu 8, nadalje **naznačen** dodatnim XRPD vrhovima pod kutovima difrakcije (2Theta) od 21.8 stupnjeva i 22.1 stupnjeva.
- 20 10. Farmaceutski pripravak, sadrži:  
antibakterijski učinkovitu količinu kristalnog oblika prema bilo kojem od zahtjeva 1-9,  
i farmaceutski prihvatljiv nosač.
11. Farmaceutski pripravak, sadrži:  
antibakterijski učinkovitu količinu kristalnog oblika prema bilo kojem od zahtjeva 1-9,  
25 antibakterijski učinkovitu količinu drugog terapijskog sredstva, i  
farmaceutski prihvatljiv nosač.
12. Farmaceutski pripravak prema zahtjevu 11, naznačen time što je drugo terapijsko sredstvo odabrano iz skupine koju čine ampicilin, piperacilin, penicilin G, tikarcilin, imipenem, meropenem, azitromicin, eritromicin, aztreonam, cefepim, cefotaksim, ceftriakson, ceftazidim, ciprofloksacin, levofloksacin, klindamicin, doksiciklin, gentamicin, amikacin, tobramicin, tetraciklin, tigeciklin, rifampicin, vankomicin i polimiksin.
- 30 13. Postupak dobivanja visoko kristalnog spoja (A) prema zahtjevu 1, od ne-kristalnog spoja (A), koji sadrži otapanje ne-kristalnog spoja (A) u halogeniranom organskom otapalu da se dobije otopina, i dovođenje u kontakt otopine s ugljikovodičnim otapalom za izazivanje taloženja kristalnog spoja (A).
- 35 14. Kristalni oblik prema bilo kojem od zahtjeva 1-9, za uporabu u liječenju Gram-negativne bakterijske infekcije u subjekta kojem je to potrebno.