



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:

HR P20170241 T2



HR P20170241 T2

(12) **ISPRAVAK PRIJEVODA PATENTNIH
ZAHTJEVA EUROPSKOG PATENTA**

(15) Ispravljen podatak:

Ispravljena verzija br 1 (W1 T1)
Vidi patentne zahtjeve.

(48) Datum objave ispravke/ispravaka:
17.03.2023.

(51) MKP:

C07D 405/12 (2006.01)
A61K 31/443 (2006.01)
A61P 11/00 (2006.01)

(45) Datum objavljivanja patenta:

07.04.2017.

(21) Broj predmeta: P20170241T

(22) Datum podnošenja : 04.12.2008.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2008085456
Datum podnošenja međunarodne prijave: 04.12.2008.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 08855812.7
Datum podnošenja europske prijave patenta: 04.12.2008.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2009073757
Datum međunarodne objave: 11.06.2009.

(97) Broj objave europske prijave patenata: EP 2225230 A1
Datum objave europske prijave patenata: 08.09.2010.

(97) Broj objave europskog patenata: EP 2225230 B1
Datum objave europskog patenata: 16.11.2016.

(31) Broj prve prijave: 12162

(32) Datum podnošenja prve prijave: 07.12.2007.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelj patenta:

Vertex Pharmaceuticals Incorporated, 50 Northern Avenue, Boston, MA 02210, US

(72) Izumitelji:

Ali Keshavarz-Shokri, 4285 Corte Langostino, San Diego, CA 92130, US
Beili Zhang, 4505 Shorepointe Way, San Diego, CA 92130, US
Mariusz Krawiec, 46 Littlefield Lane, Marlborough, MA 01752, US

(74) Zastupnik:

Vukmir i suradnici odvjetničko društvo d.o.o., 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma:

ČVRSTI OBLICI 3-(6-(1-(2,2-DIFLUOROBENZO[D])[1,3]DIOKSOL-5-IL)CIKLOPROPANKARBOKSAMIDO)-3-METILPIRIDIN-2-IL)BENZOJEVE KISELINE

HR P20170241 T2

PATENTNI ZAHTEJEVI

1. 3-(6-(1-(2,2-Difluorobenzo[d][1,3]dioksol-5-il) ciklopropankarboksamido)-3-metilpiridin-2-il)benzojeva kiselina naznačena kao Oblik I, gdje je Oblik I **naznačen** s jednim ili više pikova na 15,2 do 15,6 stupnjeva, 16,1 do 16,5 stupnjeva, i 14,3 do 14,7 stupnjeva u rendgenskoj difrakciji praha dobivenoj upotrebom Cu K alfa zračenja na 40 kV, 35 mA.
2. Oblik I iz zahtjeva 1, gdje je Oblik I **naznačen** s jednim ili više pikova na 15,4, 16,3 i 14,5 stupnjeva.
3. Oblik I iz zahtjeva 1, gdje je Oblik I dalje **naznačen** s pikom na 14,6 do 15,0 stupnjeva.
4. Oblik I iz zahtjeva 3, gdje je Oblik I dalje **naznačen** s pikom na 14,8 stupnjeva.
5. Oblik I iz zahtjeva 3, gdje je Oblik I dalje **naznačen** s pikom na 17,6 do 18,0 stupnjeva.
6. Oblik I iz zahtjeva 5, gdje je Oblik I dalje **naznačen** s pikom na 17,8 stupnjeva.
7. Oblik I iz zahtjeva 5, gdje je Oblik I dalje **naznačen** s pikom na 16,4 do 16,8 stupnjeva.
8. Oblik I iz zahtjeva 7, gdje je Oblik I dalje **naznačen** s pikom na 16,4 do 16,8 stupnjeva.
9. Oblik I iz zahtjeva 8, gdje je Oblik I dalje **naznačen** s pikom na 16,6 stupnjeva.
10. Oblik I iz zahtjeva 8, gdje je Oblik I dalje **naznačen** s pikom na 7,6 do 8,0 stupnjeva.
11. Oblik I iz zahtjeva 10, gdje je Oblik I dalje **naznačen** s pikom na 7,8 stupnjeva.
12. Oblik I iz zahtjeva 10, gdje je Oblik I dalje **naznačen** s pikom na 25,8 do 26,2 stepena.
13. Oblik I iz zahtjeva 12, gdje je Oblik I dalje **naznačen** s pikom na 26,0 stupnjeva.
14. Oblik I iz zahtjeva 12, gdje je Oblik I dalje **naznačen** s pikom na 21,4 do 21,8 stupnjeva.
15. Oblik I iz zahtjeva 14, gdje je Oblik I dalje **naznačen** s pikom na 21,6 stupnjeva.
16. Oblik I iz zahtjeva 14, gdje je Oblik I dalje **naznačen** s pikom na 23,1 do 23,5 stupnjeva.
17. Oblik I iz zahtjeva 16, gdje je Oblik I dalje **naznačen** s pikom na 23,3 stepena.
18. Oblik I iz zahtjeva 1, gdje je Oblik I **naznačen** s difrakcijskim uzorkom koji je bitno sličan onom iz Slike 1.
19. Oblik I iz zahtjeva 1, gdje je Oblik I **naznačen** s difrakcijskim uzorkom koji je bitno sličan onom iz Slike 2.
20. Oblik I iz zahtjeva 1, **naznačen time da** je distribucija veličine čestica od D90 oko 82 μm ili manje.
21. Oblik I iz zahtjeva 1, **naznačen time da** je distribucija veličine čestica od D50 oko 30 μm ili manje.
22. Farmaceutska smjesa koja sadrži Oblik I iz zahtjeva 1, i farmaceutski prihvatljiv nosač.
23. Oblik I iz zahtjeva 1 za upotrebu u liječenju cistične fibroze kod sisavaca koja sadrži davanje učinkovite količine navedenog Oblika I sisavcu.
24. Oblik I za upotrebu kako je definirano zahtjevom 23, naznačen time da upotreba obuhvaća davanje dodatnog terapijskog agensa.
25. Oprema koja sadrži Oblik I iz zahtjeva 1 i uputstva za upotrebu istog.
26. Postupak za pripremu Oblika I iz zahtjeva 1 obuhvaćajući suspendiranje ili rastvaranje HCl soli 3-(6-(1-(2,2-Difluorobenzo[d][1,3]dioksol-5-il)ciklopropankarboksamido)-3-metilpiridin-2-il) benzojeve kiseline u odgovarajućem otapalu tijekom učinkovite količine vremena.
27. Postupak iz zahtjeva 26, naznačen time da je odgovarajuće otapalo voda ili 50% smjese metanol/voda.
28. Postupak iz zahtjeva 26, naznačen time da je odgovarajuće otapalo voda.
29. Postupak iz zahtjeva 26, naznačen time da je učinkovita količina vremena 2 do 24 sata.
30. Postupak iz zahtjeva 26, naznačen time da je učinkovita količina vremena 2 do 6 sati.
31. Kristalni oblik 3-(6-(1-(2,2-Difluorobenzo[d][1,3] dioksol-5-il)ciklopropankarboksamido)-3-metilpiridin-2-il)benzojeve kiseline prema zahtjevu 1 koji ima monoklinski kristalni sustav, $P2_1/n$ prostornu grupu, i sljedeće dimenzije elementarnih stanica:

$a = 4.9626 (7) \text{ \AA}$	$\alpha = 90^\circ$
$b = 12.2994 (18) \text{ \AA}$	$\beta = 93.938 (9)^\circ$
$c = 33.075 (4) \text{ \AA}$	$\gamma = 90^\circ$.