



(19) REPUBLIKA HRVATSKA  
DRŽAVNI ZAVOD ZA  
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator  
dokumenta:

HR P20210044 T1



HR P20210044 T1

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

(51) MKP:

**A61K 31/155** (2006.01)  
**A61K 31/19** (2006.01)  
**A61K 31/195** (2006.01)  
**C07C 279/14** (2006.01)  
**C07C 57/15** (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 30.04.2021.

(21) Broj predmeta: P20210044T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 12.01.2021.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2016048643  
Datum podnošenja međunarodne prijave: 25.08.2016.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 16840104.0  
Datum podnošenja europske prijave patenta: 25.08.2016.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2017035331  
Datum međunarodne objave: 02.03.2017.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3340973 A1  
Datum objave europske prijave patenta: 04.07.2018.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3340973 B1  
Datum objave europskog patenta: 14.10.2020.

(31) Broj prve prijave: 201562209624 P (32) Datum podnošenja prve prijave: 25.08.2015. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelji:

**Rgenix, Inc., 310 East 67th Street, Suite 1-12, New York, NY 10065, US**  
**Eduardo J. Martinez, 632 Dayton Road, Bryn Mawr, PA 19010, US**  
**Andreas G. Grill, 7 Wilderness Road, Saint James, NY 11780, US**  
**Aniruddh Singh, 63 Essex Street, no. 5206, Carteret, NJ 07008, US**

(74) Zastupnik:

Odvjetničko društvo Vukmir i suradnici, 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma:

**FARMACEUTSKI PRIHVATLJIVE SOLI BETA-GVANIDINOPROPIONSKE KISELINE SA  
POBOLJŠANIM SVOJSTVIMA I NJIHOVA UPOTREBA**

HR P20210044 T1

## PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Farmaceutski prihvatljiva sol  $\beta$ -gvanidinopropionske kiseline **naznačena time** da ima Carr-ov indeks manji od 20 i/ili Hausner-ov odnos manji od 1.25, pri čemu navedena farmaceutski prihvatljiva sol predstavlja sol  $\beta$ -gvanidinopropionske kiseline i dikarboksilne kiseline.
2. Farmaceutski prihvatljiva sol prema patentnom zahtjevu 1, **naznačena time** da je navedena farmaceutski prihvatljiva sol 1:1 fumaratna sol, 2:1 sukcinatna sol ili 1:1 oksalatna sol.
3. Farmaceutski prihvatljiva sol prema patentnom zahtjevu 2, **naznačena time** da je navedena farmaceutski prihvatljiva sol 2:1 sukcinatna sol.
4. Farmaceutski prihvatljiva sol prema patentnom zahtjevu 3, **naznačena time** da je navedena sol kristalna, a po mogućnosti da ova sol sadrži manje od 40 tež. % amornog spoja.
5. Farmaceutski prihvatljiva sol prema patentnom zahtjevu 3, **naznačena time** da navedena sol ima endotermne pikove na oko 130, 175 i 232 °C, a egzotermne pikove ima na oko 179 °C na profilu diferencijalne skenirajuće kalorimetrije (DCS).
6. Farmaceutski prihvatljiva sol prema bilo kojem od patentnih zahtjeva od 1 do 5, **naznačena time** da ima najmanje jedan pik kod kuta difrakcije  $2\theta$  (°) od  $27 \pm 0.5$ , mjereno rendgenskom difrakcijom praha, pri čemu ova sol, po mogućnosti ima najmanje jedan pik kod kuta difrakcije  $2\theta$  (°) od 19.99, 20.62 i/ili 27.26, mjereno rendgenskom difrakcijom praha.
7. Farmaceutski prihvatljiva sol prema patentnim zahtjevima od 4 do 6 **naznačen time** da je u obliku štapićastih kristala.
8. Farmaceutski prihvatljiva sol prema bilo kojem od patentnih zahtjeva od 3 do 7, **naznačena time** da od 31°C do 135°C ima gubitak težine od oko 0.4%, mjereno termo-gravimetrijskom analizom.
9. Farmaceutski prihvatljiva sol prema bilo kojem od patentnih zahtjeva od 3 do 8, **naznačena time** da od 135 °C do 215 °C ima gubitak težine od oko 13%, mjereno termo-gravimetrijskom analizom.
10. Pripravak koji sadrži farmaceutski prihvatljivu sol prema bilo kojem od patentnih zahtjeva od 1 do 9, **naznačen time** da sadrži manje od 10 tež.% amornog spoja i farmaceutski prihvatljiv ekscipijent.
11. Farmaceutski pripravak u obliku jedinične doze, **naznačen time** da sadrži farmaceutski prihvatljivu sol prema bilo kojem od patentnih zahtjeva 1 do 9 i farmaceutski prihvatljiv ekscipijent.
12. Farmaceutski pripravak **naznačen time** da sadrži farmaceutski prihvatljivu sol prema bilo kojem od patentnih zahtjeva od 1 do 9 i farmaceutski prihvatljiv ekscipijent, pri čemu je navedeni farmaceutski pripravak formuliran za intravensku infuziju.
13. Farmaceutski prihvatljiva sol prema bilo kojem od patentnih zahtjeva od 1 do 9 ili kompozicija prema bilo kojem od patentnih zahtjeva od 10 do 12 **naznačena time** da je za upotrebu u liječenju karcinoma, po mogućnosti gdje je:
  - (a) spomenuti karcinom je metastatski karcinom;
  - (b) spomenuta efikasna količina sadrži količinu efikasnu za suzbijanje metastatske kolonizacije spomenutog karcinoma;
  - (c) spomenuti karcinom je gastrointestinalni karcinom.
14. Vodeni pripravak, **naznačen time** da sadrži farmaceutski prihvatljivu sol prema bilo kojem od patentnih zahtjeva od 1 do 9 i farmaceutski prihvatljiv ekscipijens u količini koja je efikasna za suzbijanje metastatske kolonizacije navedenog karcinoma za upotrebu u liječenju metastatskog karcinoma.
15. Vodena kompozicija za upotrebu prema patentnom zahtjevu 14, **naznačena time** da spomenuti metastatski karcinom je gastrointestinalni karcinom.