



(19) REPUBLIKA HRVATSKA  
DRŽAVNI ZAVOD ZA  
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator  
dokumenta:

HR P20171275 T1



HR P20171275 T1

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

(51) MKP:

**C07J 63/00** (2006.01)  
**A61K 31/565** (2006.01)  
**A61P 29/00** (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 20.10.2017.

(21) Broj predmeta: P20171275T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 22.08.2017.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2013038064  
Datum podnošenja međunarodne prijave: 24.04.2013.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 13720708.0  
Datum podnošenja europske prijave patenta: 24.04.2013.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2013163344  
Datum međunarodne objave: 31.10.2013.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2841445 A1  
Datum objave europske prijave patenta: 04.03.2015.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2841445 B1  
Datum objave europskog patenta: 14.06.2017.

(31) Broj prve prijave: 201261687669 P

(32) Datum podnošenja prve prijave: 27.04.2012.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave:  
201361775288 P  
201361780444 P

US  
08.03.2013.  
13.03.2013. US  
US

(73) Nositelj patenta:

**Reata Pharmaceuticals, Inc., 2801 Gateway Drive, Suite 150, Irving, TX  
75063-2648, US**

(72) Izumitelji:

**Eric Anderson, 602 Nicholas Ct., Southlake, TX 76092, US  
Andrea Decker, Spalenring 11, 4055 Basel, CH  
Xiaofeng Liu, 320 Meadowood Ln, Copell, TX 75019, US**

(74) Zastupnik:

Odvjetničko društvo Vukmir i suradnici, 10000 Zagreb, HR

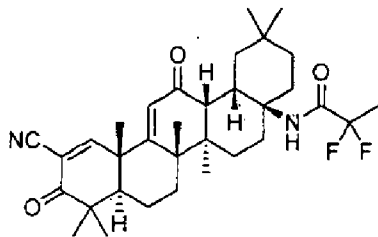
(54) Naziv izuma:

**DERIVATI 2,2-DIFLUOROPROPIONAMIDA BARDOKSOLON METILA, POLIMORFNI OBLICI I  
POSTUPCI NJIHOVE UPOTREBE**

HR P20171275 T1

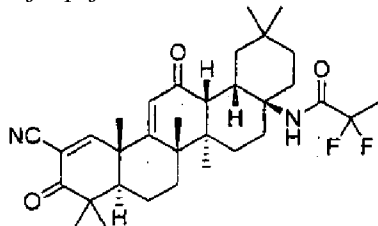
## PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Spoj s formulom:



ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

2. Spoj prema zahtjevu 1, naznačen time da je spoj s formulom:



3. Polimorfni oblik spoja u skladu sa zahtjevom 1 ili 2, naznačen time da polimorfni oblik ima uzorak rendgenske difrakcije praha ( $\text{CuK}\alpha$ ) koji obuhvaća halo vršak kod oko  $14^\circ 2\theta$ ; ili  
pri čemu polimorfni oblik je solvat koji ima uzorak rendgenske difrakcije praha ( $\text{CuK}\alpha$ ) koji obuhvaća vrške kod oko  $5.6, 7.0, 10.6, 12.7, \text{ i } 14.6^\circ 2\theta$ ; ili  
pri čemu polimorfni oblik je solvat koji ima uzorak rendgenske difrakcije praha ( $\text{CuK}\alpha$ ) koji obuhvaća vrške kod oko  $7.0, 7.8, 8.6, 11.9, 13.9$  (dvostruki vršak),  $14.2, \text{ i } 16.0^\circ 2\theta$ ; ili  
pri čemu polimorfni oblik je acetonitril hemisolvat koji ima uzorak rendgenske difrakcije praha ( $\text{CuK}\alpha$ ) koji obuhvaća vrške kod oko  $7.5, 11.4, 15.6, \text{ i } 16.6^\circ 2\theta$ ; ili  
pri čemu polimorfni oblik je solvat koji ima uzorak rendgenske difrakcije praha ( $\text{CuK}\alpha$ ) koji obuhvaća vrške kod oko  $6.8, 9.3, 9.5, 10.5, 13.6, \text{ i } 15.6^\circ 2\theta$ .
4. Spoj prema zahtjevu 1 ili 2 ili polimorfni oblik prema zahtjevu 3 naznačen time da je za uporabu kao lijek.
5. Farmaceutski pripravak naznačen time da sadrži:  
aktivni sastojak koji se sastoji od spoja prema zahtjevu 1 ili 2 ili polimorfnog oblika prema zahtjevu 3, te farmaceutski prihvatljiv nosač.
6. Farmaceutski pripravak prema zahtjevu 5, naznačen time da je farmaceutski pripravak formuliran za davanje: oralno, intraadipozno, intraarterijalno, intraartikularno, intrakranijalno, intradermalno, intralezionalno, intramuskularno, intranazalno, intraokularno, intraperikardijalno, intraperitonealno, intrapleuralno, intraprostatski, intrarektalno, intratekalno, intratrahealno, intratumoralno, intralumbalno, intravaginalno, intravenozno, intravezikularno, intravitalno, liposomalno, lokalno, mukozno, parenteralno, rektalno, pod konjunktivu, subkutano, sublingvalno, topikalno, transbukalno, transdermalno, vaginalno, u kremama, u pripravcima lipida, pomoću katetera, putem ispiranja, putem kontinuirane infuzije, infuzijom, inhalacijom, injekcijom, lokalnim davanjem, ili putem lokalizirane perfuzije.
7. Farmaceutski pripravak prema zahtjevu 6, naznačen time da je farmaceutski pripravak formuliran kao tvrda ili meka kapsula, tableta, sirup, suspenzija, emulzija, otopina, čvrsta disperzija, wafer, ili eliksir.
8. Farmaceutski pripravak prema zahtjevu 5 ili 6, naznačen time da je farmaceutski pripravak formuliran za topikalnu primjenu u obliku odabranom od losiona, kreme, gela, ulja, masti, melema, emulzije, otopine, te suspenzije.
9. Farmaceutski pripravak prema bilo kojem od zahtjeva 5 do 8, naznačen time da je količina aktivnog sastojka od  $0.01\%$  do  $5$  masenih  $\%$ .
10. Spoj prema zahtjevu 1 ili 2 ili polimorfni oblik prema zahtjevu 3 ili farmaceutski pripravak prema bilo kojem od zahtjeva 5 do 9 naznačen time da je za upotrebu za liječenje ili sprječavanje stanja povezanog s upalom ili oksidativnim stresom.
11. Spoj, polimorfni oblik ili farmaceutski pripravak za upotrebu prema zahtjevu 10, naznačen time da stanje je kožna bolest ili poremećaj, sepsa, dermatitis, osteoartritis, rak, upala, autoimuna bolest, upalna bolest crijeva, komplikacija od lokaliziranog ili cjelokupnog izlaganja ionizirajućem zračenju, mukozitis, akutno ili kronično zatajenje organa, bolest jetre, pankreatitis, poremećaj oka, plućna bolest, ili dijabetes.
12. Spoj, polimorfni oblik ili farmaceutski pripravak za upotrebu prema zahtjevu 11, naznačen time da stanje je kožna bolest ili poremećaj koji se bira od dermatitisa, toplinskih ili kemijskih opekлина, kronične rane, akni, alopecije, drugih poremećaja folikula kose, bulozne epidermolize, opekлина od sunca, komplikacija opekлина od sunca, poremećaja pigmentacije kože, stanja kože povezanog sa starenjem, rana nakon operacije, ožiljka od ozljede kože

ili opekline, psorijaze, dermatološke manifestacija autoimune bolesti ili bolesti presatka protiv domaćina, raka kože, te poremećaja koji obuhvaćaju hiperproliferaciju stanica kože.

13. Spoj, polimorfni oblik ili farmaceutski pripravak za upotrebu prema zahtjevu 11, naznačen time da stanje je dermatitis, koji je alergijski dermatitis, atopijski dermatitis, dermatitis zbog izloženosti kemikalijama, ili dermatitis izazvan zračenjem.
14. Spoj, polimorfni oblik ili farmaceutski pripravak za upotrebu prema zahtjevu 11, naznačen time da stanje je autoimuna bolest odabrana od reumatoidnog artritisa, lupusa, Crohnove bolesti, te psorijaze.
15. Spoj, polimorfni oblik ili farmaceutski pripravak za upotrebu prema zahtjevu 11, naznačen time da stanje je bolest jetre odabrana od bolesti masne jetre i hepatitisa.
16. Spoj, polimorfni oblik ili farmaceutski pripravak za upotrebu prema zahtjevu 11, naznačen time da stanje je poremećaj oka odabran od uveitisa, makularne degeneracije, glaukoma, dijabetičkog makularnog edema, blefaritisa, dijabetičke retinopatije, bolesti ili poremećaja endotela rožnice, postoperativna upala, sindrom suhog oka, alergijski konjunktivitis, te oblik konjunktivitisa.
17. Spoj, polimorfni oblik ili farmaceutski pripravak za upotrebu prema zahtjevu 11, naznačen time da stanje je plućna bolest odabrana od upale pluća, plućne fibroze, KOPB, astme, cistične fibroze, te idiopatske plućne fibroze.
18. Spoj, polimorfni oblik ili farmaceutski pripravak za upotrebu prema zahtjevu 11, naznačen time da stanje je mukozitis koji proizlazi iz terapije zračenjem ili kemoterapije.
19. Spoj, polimorfni oblik ili farmaceutski pripravak za upotrebu prema zahtjevu 11, naznačen time da stanje je rak izabran iz karcinoma, sarkoma, limfoma, leukemije, melanoma, mezotelioma, multiplog mijeloma, i seminoma.
20. Spoj, polimorfni oblik ili farmaceutski pripravak za upotrebu prema zahtjevu 19, naznačen time da stanje je melanom.
21. Spoj, polimorfni oblik ili farmaceutski pripravak za upotrebu prema zahtjevu 11, naznačen time da stanje je rak, i rak je rak mjehura, krvi, kostiju, mozga, dojke, središnjeg živčanog sustava, grlića maternice, debelog crijeva, endometrija, jednjaka, žučnog mjehura, genitalija, genitourinarnog trakta, glave, bubrega, grkljana, jetre, pluća, mišićnog tkiva, vrata, oralne ili nosne sluznice, jajnika, gušterače, prostate, kože, slezene, tankog crijeva, debelog crijeva, želuca, testisa ili štitnjače.
22. Spoj, polimorfni oblik ili farmaceutski pripravak za upotrebu prema zahtjevu 21, naznačen time da stanje je rak pluća.
23. Spoj, polimorfni oblik ili farmaceutski pripravak za upotrebu prema bilo kojem od zahtjeva 10 do 22, naznačen time da se spoj, polimorfni oblik, ili farmaceutski pripravak primjenjuje i prije i poslije nakon što je subjekt liječen zračenjem ili kemoterapijom.
24. Spoj, polimorfni oblik ili farmaceutski pripravak za upotrebu prema zahtjevu 23, naznačen time da liječenje smanjuje nuspojavu terapije zračenjem ili kemoterapijom.
25. Spoj, polimorfni oblik ili farmaceutski pripravak za upotrebu prema zahtjevu 24, naznačen time da nuspojava je mukozitis i dermatitis.
26. Spoj, polimorfni oblik ili farmaceutski pripravak za upotrebu prema bilo kojem od zahtjeva 19 do 22, naznačen time da se spoj, polimorfni oblik ili farmaceutski pripravak primjenjuje u kombinaciji s imunoterapijom.
27. Spoj, polimorfni oblik ili farmaceutski pripravak za upotrebu prema zahtjevu 26, naznačen time da imunoterapija je protutijelo koje cilja na rak.
28. Spoj prema zahtjevu 1 ili 2 ili polimorfni oblik prema zahtjevu 3 ili farmaceutski pripravak prema bilo kojem od zahtjeva 5 do 9 naznačen time da je za upotrebu za liječenje ili prevenciju neurodegenerativne bolesti.