



(19) REPUBLIKA HRVATSKA  
DRŽAVNI ZAVOD ZA  
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator  
dokumenta:



HR P20190960 T1

HR P20190960 T1

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

(51) MKP:

**A61K 9/107** (2006.01)  
**A61K 39/015** (2006.01)  
**A61K 39/00** (2006.01)  
**A61K 39/12** (2006.01)  
**A61K 39/39** (2006.01)  
**A61K 47/24** (2006.01)  
**A61K 47/26** (2006.01)  
**A61K 9/113** (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 26.07.2019.

(21) Broj predmeta: P20190960T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 27.05.2019.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2013025204  
Datum podnošenja međunarodne prijave: 07.02.2013.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 13746983.9  
Datum podnošenja europske prijave patenta: 07.02.2013.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2013119856  
Datum međunarodne objave: 15.08.2013.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2811981 A1  
Datum objave europske prijave patenta: 17.12.2014.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2811981 B1  
Datum objave europskog patenta: 08.05.2019.

(31) Broj prve prijave: 201261596066 P (32) Datum podnošenja prve prijave: 07.02.2012. (33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelj patenta:

**Infectious Disease Research Institute, 1616 Eastlake Avenue East, Suite  
400, Seattle, WA 98102, US**

(72) Izumitelji:

**Christopher Fox, 15107 63rd Street East, Sumner, WA 98390, US**  
**Steven G. Reed, 2843 122nd Place NE, Bellevue, WA 98005, US**  
**Susan Baldwin, 2000 NE 113th Street, Seattle, WA 98125, US**  
**Thomas Vedvick, 124 South 300th Place, Federal Way, WA 98003, US**

(74) Zastupnik:

**Hraste & Partneri odvjetničko društvo, 10000 Zagreb, HR**

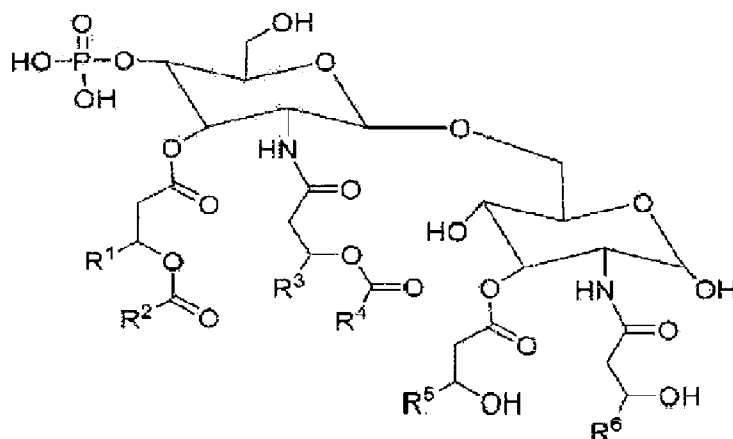
(54) Naziv izuma:

**POBOLJŠANE ADJUVANTNE FORMULACIJE KOJE SADRŽE AGONISTE TLR4 I POSTUPCI  
NJIHOVE UPOTREBE**

HR P20190960 T1

## PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Emulzija ulja u vodi koja sadrži agonist TLR<sup>4</sup> i metabolizirajuće ulje, **naznačena time** što je metabolizirajuće ulje prisutno u emulziji ulja u vodi u koncentraciji od 0,01%-1% vol./vol., te što je ravnoteža hidrofobno:lipofilno (HLB) emulzije ulja u vodi veća od 9, ili veća od 10, ili između 9 i 12, gdje se agonist TLR<sup>4</sup> bira iz skupine koju čine monofosforilirani lipid A (MPL), 3-O-deacilirani monofosforilirani lipid A i sintetski glukopiranozilirani lipidni adjuvans (GLA).
2. Emulzija ulja u vodi u skladu s patentnim zahtjevom, **naznačena time** što je metabolizirajuće ulje prisutno u emulziji ulja u vodi u koncentraciji od 0,01 %-0.5% vol./vol.
3. Emulzija ulja u vodi u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačena time** što emulzija dodatno sadrži 1,2-dimiristoil-*sn*-glycero-3-fosfocholine (DMPC), izborno gdje emulzija ne sadrži antioksidans.
4. Emulzija ulja u vodi u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačena time** što agonist TLR<sup>4</sup> sadrži sintetski GLA.
5. Emulzija ulja u vodi u skladu s patentnim zahtjevom 4, **naznačena time** što sintetski GLA ima sljedeću strukturu: (i)

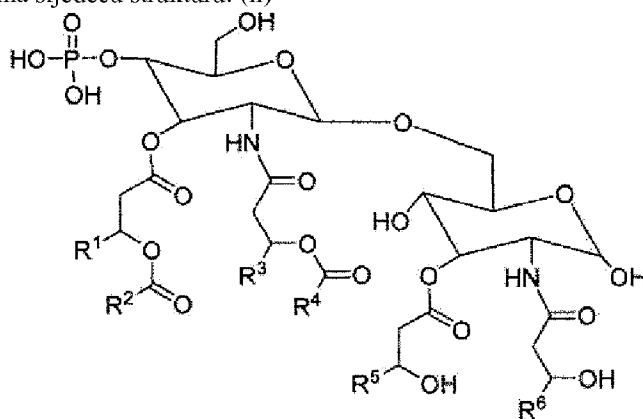


gdje:

R<sup>1</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>5</sup> i R<sup>6</sup> su C<sub>11</sub>-C<sub>20</sub> alkil; i

R<sup>2</sup> i R<sup>4</sup> su C<sub>12</sub>-C<sub>20</sub> alkil;

ili, gdje sintetski GLA ima sljedeću strukturu: (ii)

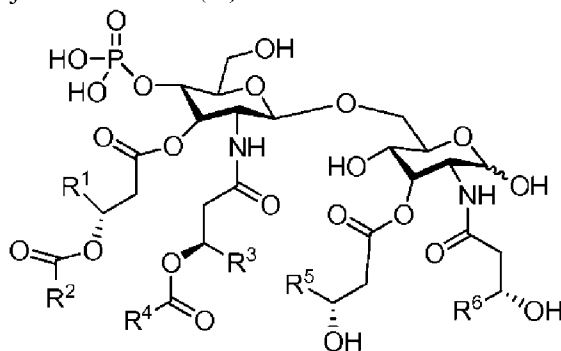


ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, gdje:

R<sup>1</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>5</sup> i R<sup>6</sup> su C<sub>11</sub>-20 alkil; i

R<sup>2</sup> i R<sup>4</sup> su C<sub>9-20</sub> alkil;

ili, gdje sintetski GLA ima sljedeću strukturu: (iii)

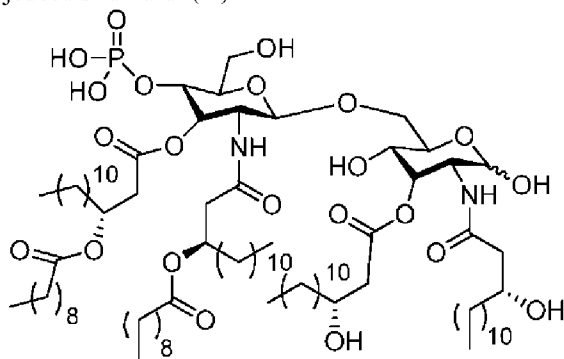


ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, gdje:

$R^1$ ,  $R^3$ ,  $R^5$  i  $R^6$  su  $C_{11}$ - $C_{20}$  alkil; i

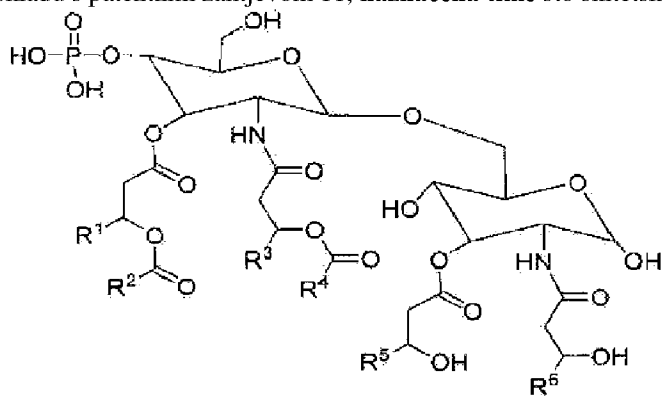
$R^2$  i  $R^4$  su  $C_9$ - $C_{20}$  alkil;

ili gdje sintetski GLA ima sljedeću strukturu: (iv)



ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

6. Emulzija ulja u vodi u skladu s patentnim zahtjevom 5(i), **naznačena time** što  $R^1$ ,  $R^3$ ,  $R^5$  i  $R^6$  su  $C_{11}$  alkil; i  $R^2$  i  $R^4$  su  $C_{13}$  alkil.
7. Emulzija ulja u vodi u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 6, **naznačena time** što emulzija dodatno sadrži surfaktant, izborno gdje je surfaktant Pluronic F68.
8. Emulzija ulja u vodi u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 7, **naznačena time** što je metabolizirajuće ulje skvalen.
9. Emulzija ulja u vodi u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 8, **naznačena time** što emulzija dodatno sadrži antioksidans, izborno gdje je antioksidans vitamin E.
10. Emulzija ulja u vodi u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 9, **naznačena time** što emulzija dodatno sadrži najmanje jedan antigen.
11. Emulzija ulja u vodi u skladu s patentnim zahtjevom 1, **naznačena time** što je agonist  $TLR^4$  sintetski GLA, gdje je HLB emulzije veći od otprilike 10 i gdje emulzija dodatno sadrži DMPC u koncentraciji od otprilike 0,002%-2%.
12. Emulzija ulja u vodi u skladu s patentnim zahtjevom 11, **naznačena time** što sintetski GLA ima sljedeću strukturu:

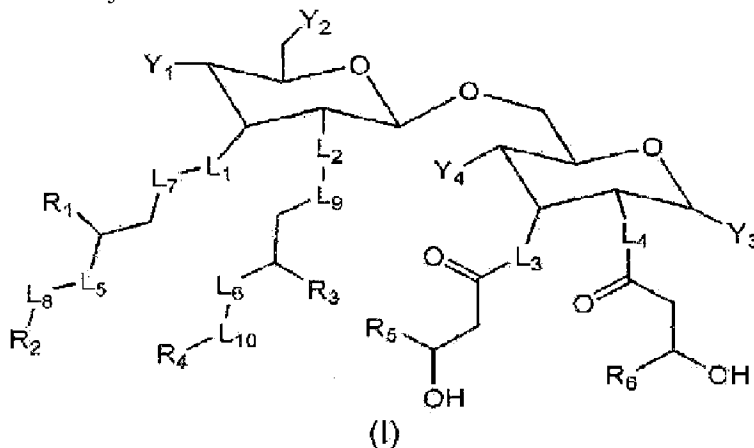


gdje:

$R^1$ ,  $R^3$ ,  $R^5$  i  $R^6$  su  $C_{11}$ - $C_{20}$  alkil; i  $R^2$  i  $R^4$  su  $C_{12}$ - $C_{20}$  alkil, izborno,

gdje su  $R^1$ ,  $R^3$ ,  $R^5$  i  $R^6$   $C_{11}$  alkil; i  $R^2$  i  $R^4$  su  $C_{13}$  alkil;

ili, gdje sintetski GLA ima sljedeću strukturu:



ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, gdje:

$L_1, L_2, L_3, L_4, L_5$  i  $L_6$  su isti ili različiti i neovisno -O-, -NH-ili  $-(CH_2)-$ ;

$L_7, L_8, L_9$  i  $L_{10}$  su isti ili različiti i neovisno odsutni ili  $-C(=O)-$ ;

$Y_1$  je kiselinska funkcionalna skupina;

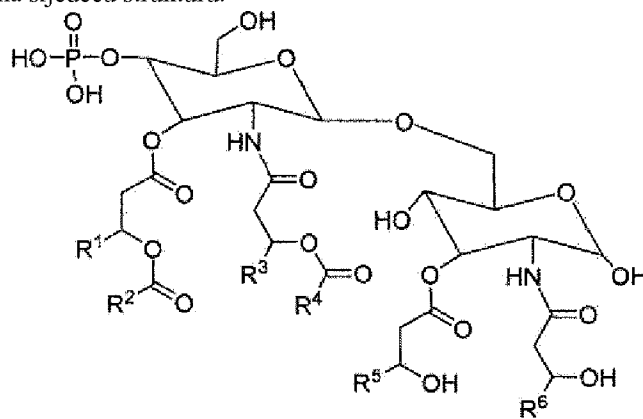
$Y_2$  i  $Y_3$  su isti ili različiti i neovisno -OH-, -SH-, ili kiselinska funkcionalna skupina;

$Y_4$  je -OH ili -SH;

$R_1, R_3, R_5$  i  $R_6$  su isti ili različiti i neovisno  $C_{8-13}$  alkil; i

$R_2$  i  $R_4$  su isti ili različiti i neovisno  $C_{6-11}$  alkil, izborno gdje su  $R_1, R_3, R_5$  i  $R_6$   $C_{10}$  alkil; i  $R_2$  i  $R_4$  su  $C_8$  alkil;

ili gdje sintetski GLA ima sljedeću strukturu:

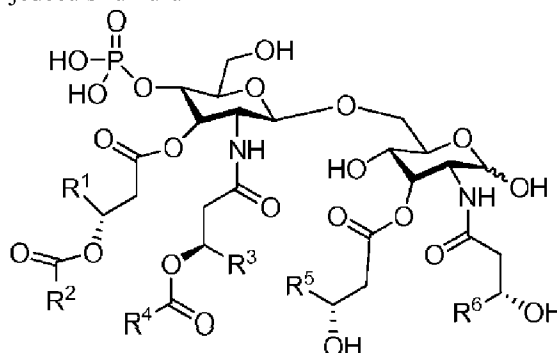


ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, gdje:

$R^1, R^3, R^5$  i  $R^6$  su  $C_{11-20}$  alkil; i

$R^2$  i  $R^4$  su  $C_{9-20}$  alkil;

ili, gdje sintetski GLA ima sljedeću strukturu:

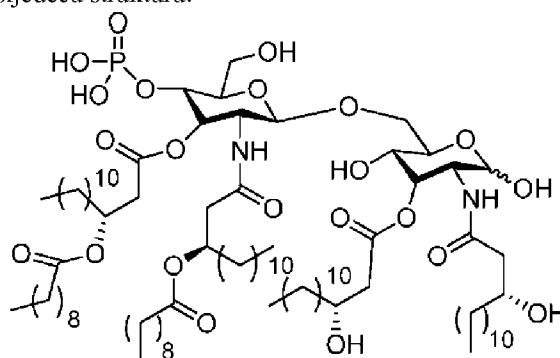


ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, gdje:

$R^1, R^3, R^5$  i  $R^6$  su  $C_{11-C_{20}}$  alkil; i

$R^2$  i  $R^4$  su  $C_{9-C_{20}}$  alkil;

ili, gdje sintetski GLA ima sljedeću strukturu:



ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol.

13. Emulzija ulja u vodi u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1-12, **naznačena time** što je namijenjena upotrebi u terapijskom postupku stimuliranja imunostnog odgovora kod subjekta.
14. Emulzija ulja u vodi namijenjena upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 13, **naznačena time** što je imunostni odgovor nespecifični imunostni odgovor ili imunostni odgovor specifičan za antigen.
15. Emulzija ulja u vodi namijenjena upotrebi u skladu s patentnim zahtjevom 13 ili patentnim zahtjevom 14, **naznačena time** što se emulziju ulja u vodi primjenjuje intradermalno.