



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2252283 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/275 (2006.01)
A61K 31/277 (2006.01)
A61K 31/4164 (2006.01)
A61K 31/4174 (2006.01)
A61P 3/00 (2006.01)
A61P 9/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2019.03.11
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.11.28
(86)	European Application Nr.	09701279.3
(86)	European Filing Date	2009.01.12
(87)	The European Application's Publication Date	2010.11.24
(30)	Priority	2008.01.11, US, 20624 P 2008.10.28, US, 109114 P
(84)	Designated Contracting States:	AT ; BE ; BG ; CH ; CY ; CZ ; DE ; DK ; EE ; ES ; FI ; FR ; GB ; GR ; HR ; HU ; IE ; IS ; IT ; LI ; LT ; LU ; LV ; MC ; MK ; MT ; NL ; NO ; PL ; PT ; RO ; SE ; SI ; SK ; TR
	Designated Extension States:	AL ; BA ; RS
(73)	Proprietor	Reata Pharmaceuticals, Inc., 2801 Gateway Drive, Suite 150, Irving, TX 75063, USA Trustees of Dartmouth College, 11 Rope Ferry Road, Hanover, NH 03766, USA
(72)	Inventor	SPORN, Michael, 9 Sporn Drive, TunbridgeVT 05077, USA LIBY, Karen, 131 North Main Street, West LebanonNH 03784, USA GRIBBLE, Gordon, W., 15 Eldridge Street, LebanonNH 03766, USA HONDA, Tadashi, 16 Macdonald Drive, HanoverNH 03755, USA KRAL, Robert, M., 2405 Brittany Lane, GrapevineTX 76051, USA MEYER, Colin, J., 3884 Truman Drive, FriscoTX 75034, USA
(74)	Agent or Attorney	CURO AS, Vestre Rosten 81, 7075 TILLER, Norge

(54)	Title	SYNTHETIC TRITERPENOIDS AND METHODS OF USE IN THE TREATMENT OF DISEASE
------	-------	---

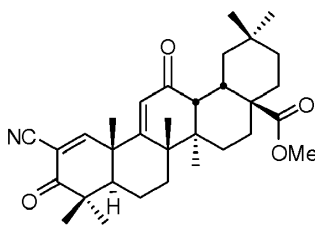
(56)	References Cited:	WO-A-2007/005879, WO-A-2008/136838, LIBY K ET AL: "The Synthetic Triterpenoids, CDDO and CDDO-Imidazolidine, Are Potent Inducers of Heme Oxygenase-1 and Nrf2/ARE Signaling" CANCER RESEARCH, AMERICAN ASSOCIATION FOR CANCER RESEARCH, BALTIMORE, MD.; US, vol. 65, no. 11, 1 June 2005 (2005-06-01), pages 4789-4798, XP003020927 ISSN: 0008-5472, SHIN SOONA ET AL: "NRF2 modulates aryl hydrocarbon receptor signaling:
------	-------------------	---

Influence on adipogenesis" MOLECULAR AND CELLULAR BIOLOGY, vol. 27, no. 20, October 2007 (2007-10), pages 7188-7197, XP002517697 ISSN: 0270-7306, WO-A-2006/029221, WO-A-2009/023232, YATES S M ET AL: "Pharmacodynamic characterization of chemopreventive triterpenoids as exceptionally potent inducers of Nrf2-regulated genes" MOLECULAR CANCER THERAPEUTICS, AMERICAN ASSOCIATION OF CANCER RESEARCH, US, vol. 6, no. 1, 1 January 2007 (2007-01-01), pages 154-162, XP002456640 ISSN: 1535-7163, WO-A-2005/042002, WO-A-02/03996, WO-A-2008/111497

Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters concerning the validity of the patent, language of the application/patent granted at the EPO will be used as the basis for the decision. The patent documents published by the EPO are available through Espacenet (<http://worldwide.espacenet.com>) or via the search engine on our website here: <https://search.patentstyret.no/>

Patentkrav

1. Forbindelse med formelen



for anvendelse i en framgangsmåte for å fremme renal-(nyre)-funksjon i et subjekt.

- 5 2. Forbindelse for anvendelsen ifølge krav 1, hvori subjektet har kronisk nyresykdom (CKD) eller oppviser symptomer på renal/nyre-sykdom (RKD).
3. Forbindelse for anvendelsen ifølge krav 1, hvori subjektet har diabetisk nefropati (DN) eller oppviser symptomer på DN.
4. Forbindelse for anvendelsen ifølge krav 1, hvori forbedret nyrefunksjon er reflektert ved en
10 forbedret estimert glomerulær filtreringsrate (eGFR).
5. Forbindelse for anvendelsen ifølge krav 1, hvori forbedret nyrefunksjon er reflektert ved en forbedret serumkreatininkonsentrasjon.
6. Forbindelse for anvendelsen ifølge krav 1, hvori subjektet har insulinresistens eller oppviser ett eller flere symptomer på insulinresistens.
- 15 7. Forbindelse for anvendelsen ifølge krav 2, hvori subjektet også har kardiovaskulær sykdom (CVD) eller oppviser ett eller flere symptomer på CVD.
8. Forbindelse for anvendelsen ifølge ett av kravene 1 til 7, hvori subjektet er et menneske.
9. Forbindelse for anvendelsen ifølge ett av kravene 1 til 8, hvori i det minste en del av forbindelsen er til stede som en krystallinsk form med et røntgendiffraksjonsmønster (CuKa) omfattende
20 signifikante diffraksjonstopper ved omtrent 8,8, 12,9, 13,4, 14,2 og 17,4°2θ.
10. Forbindelse for anvendelsen ifølge krav 9, hvori røntgendiffraksjonsmønstret (CuKa) er hovedsakelig som vist i FIG. 12A eller FIG. 12B.
11. Forbindelse for anvendelsen ifølge ett av kravene 1 til 8, hvori i det minste en del av forbindelsen er til stede som en amor form med et røntgendiffraksjonsmønster (CuKa) med en halotopp ved
25 omtrent 13,5° 2θ, hovedsakelig som vist i FIG. 12C, og en T_g fra 120°C til 135 °C.
12. Forbindelse for anvendelsen ifølge krav 11, hvori T_g er fra 125°C til 130°C.

14. Forbindelse for anvendelsen ifølge ett av kravene 1 til 13, hvori forbindelsen er formulert som en hard eller myk kapsel eller en tablett.

16. Forbindelse for anvendelsen ifølge ett av kravene 1 til 8, 13 og 14, hvori forbindelsen er formulert med en metakrylsyre/etylakrylat-(1:1)-kopolymer som et hjelpestoff.

18. Forbindelse for anvendelsen ifølge ett av kravene 1 til 16, hvori forbindelsen administreres ved en daglig dose på 0,1 mg til 30 mg.

20. Forbindelse for anvendelsen ifølge krav 19, hvori nevnte RKD er diabetisk nefropati (DN).

21. Forbindelse for anvendelsen ifølge krav 19, hvori nevnte RKD er kronisk RKD.

22. Forbindelse for anvendelsen ifølge krav 19, hvori subjektet har RKD og diabetes.

23. Forbindelse for anvendelsen ifølge ett av kravene 19 til 22, hvori subjektet er et menneske.

20 24. Forbindelse for anvendelsen ifølge ett av kravene 19 til 23, hvori i det minste en del av forbindelsen er til stede som en krystallinsk form med en røntgendiffraksjonsmønster (CuKα) som omfatter signifikante diffraksjonstopper ved omtrent 8,8, 12,9, 13,4, 14,2 og 17,4°2θ.

25. Forbindelse for anvendelsen ifølge krav 24, hvori røntgendiffraksjonsmønstret (CuK α) er hovedsakelig som vist i FIG. 12A eller FIG. 12B.

26. Forbindelse for anvendelsen ifølge ett av kravene 19 til 23, hvori i det minste en del av forbindelsen er til stede som en amorf form med et røntgendiffraksjonsmønster (CuK α) med en halotopp ved omtrent 13,5° 2 θ , hovedsakelig som vist i FIG. 12C, og en T_g fra 120°C til 135 °C.
27. Forbindelse for anvendelsen ifølge krav 26, hvori T_g er fra 125°C til 130°C.
- 5 28. Forbindelse for anvendelsen ifølge ett av kravene 19 til 27, hvori forbindelsen er formulert for oral, intraarteriell eller intravenøs administrering.
29. Forbindelse for anvendelsen ifølge ett av kravene 19 til 28, hvori forbindelsen er formulert som en hard eller myk kapsel eller en tablett.
30. Forbindelse for anvendelsen ifølge ett av kravene 19 til 29, hvori forbindelsen er formulert som
- 10 en polymerdispersjon.
31. Forbindelse for anvendelsen ifølge ett av kravene 19 til 23, 28 og 29, hvori forbindelsene er formulert med en metakrylsyre/etylakrylat-(1:1)-kopolymer som et hjelpestoff.
32. Forbindelse for anvendelsen ifølge ett av kravene 19 til 31, hvori forbindelsen administreres ved en daglig dose på 10 mg til 200 mg.
- 15 33. Forbindelse for anvendelsen ifølge ett av kravene 19 til 31, hvori forbindelsen administreres ved en daglig dose på 0,1 mg til 30 mg.
34. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 19 eller 20, hvori forbindelsen fremmer nyrefunksjon.
35. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 34, hvori forbedret nyrefunksjon er reflektert ved en forbedret estimert glomerulær filtreringsrate.
- 20 36. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 34, hvori forbedret nyrefunksjon er reflektert ved forbedret serumkreatininkonsentrasjon.