



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2558105 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/275 (2006.01)
A61P 3/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2020.02.10
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.11.20
(86)	European Application Nr.	11715645.5
(86)	European Filing Date	2011.04.12
(87)	The European Application's Publication Date	2013.02.20
(30)	Priority	2010.04.12, US, 323276 P 2010.10.01, US, 389090 P
(84)	Designated Contracting States:	AL ; 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 ; RS ; SE ; SI ; SK ; SM ; TR
	Designated Extension States:	BA ; ME
(73)	Proprietor	Reata Pharmaceuticals, Inc., 2801 Gateway Drive, Suite 150, Irving, TX 75063- 2648, USA
(72)	Inventor	MEYER, Colin, J., c/o Reata Pharmaceuticals Inc.2801 Gateway Dr.Suite 150, Irving, TX 75063-2648, USA HUFF, Warren, c/o Reata Pharmaceuticals Inc.2801 Gateway Dr.Suite 150, Irving, TX 75063-2648, USA
(74)	Agent or Attorney	CURO AS, Vestre Rosten 81, 7075 TILLER, Norge

(54) Title **BARDOXOLONE METHYL FOR THE TREATMENT OF OBESITY**

(56) References
Cited:

US-A1- 2010 056 777
WO-A1-2009/089545
WO-A2-2009/146218
VAZQUEZ-VELA M E F ET AL: "White Adipose Tissue as Endocrine Organ and Its Role in
Obesity", ARCHIVES OF MEDICAL RESEARCH, INSTITUTO MEXICANO DEL SEGURO
SOCIAL, MEXICO, MX, vol. 39, no. 8, 1 November 2008 (2008-11-01), pages 715-728, ISSN:
0188-4409, DOI: 10.1016/J.ARCMED.2008.09.005 [retrieved on 2008-11-07]
SHIN ET AL: "Inhibitory roles of NRF2 and an oleanolic triterpenoid on adipocyte differentiation
and obesity", A DISSERTATION SUBMITTED TO JOHNS HOPKINS UNIVERSITY IN
CONFORMITY WITH THE REQUIREMENTS FOR THE DEGREE OF DOCTOR OF
PHILOSOPHY, XX, US, 1 March 2009 (2009-03-01), pages I-X,1, XP008144969,

FUJIOKA KEN ET AL: "Pharmacologic treatment options for obesity: current and potential medications", NUTRITION IN CLINICAL PRAC, WILLIAMS AND WILKINS, BALTIMORE, MD, US, vol. 22, no. 1, 1 February 2007 (2007-02-01), pages 50-54, ISSN: 0884-5336

SHIN SOONA ET AL: "NRF2 modulates aryl hydrocarbon receptor signaling: Influence on adipogenesis", MOLECULAR AND CELLULAR BIOLOGY, AMERICAN SOCIETY FOR MICROBIOLOGY, WASHINGTON, US, vol. 27, no. 20, 1 October 2007 (2007-10-01), pages 7188-7197, ISSN: 0270-7306, DOI: 10.1128/MCB.00915-07

GEORGE A. BRAY ET AL: "Current and Potential Drugs for Treatment of Obesity", ENDOCRINE REVIEWS, vol. 20, no. 6, 1 December 1999 (1999-12-01), pages 805-875, US ISSN: 0163-769X, DOI: 10.1210/edrv.20.6.0383

SHIN SOONA ET AL: "Role of Nrf2 in prevention of high-fat diet-induced obesity by synthetic triterpenoid CDDO-imidazolide.", EUROPEAN JOURNAL OF PHARMACOLOGY 12 OCT 2009 LNKD- PUBMED:19698707, vol. 620, no. 1-3, 12 October 2009 (2009-10-12), pages 138-144, XP026626018, ISSN: 1879-0712

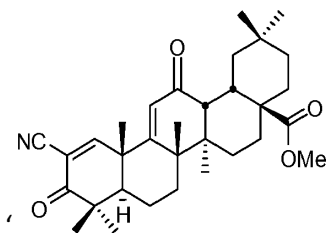
DAVID T. HUGHES ET AL: "The Synthetic Triterpenoid CDDO-Im Inhibits Fatty Acid Synthase Expression and Has Antiproliferative and Proapoptotic Effects in Human Liposarcoma Cells", CANCER INVESTIGATION., vol. 26, no. 2, 1 January 2008 (2008-01-01), pages 118-127, US ISSN: 0735-7907, DOI: 10.1080/07357900701522612

WELLS ET AL: "Ghrelin - Defender of fat", PROGRESS IN LIPID RESEARCH, PERGAMON PRESS, PARIS, FR, vol. 48, no. 5, 1 September 2009 (2009-09-01), pages 257-274, ISSN: 0163-7827 [retrieved on 2009-05-03]

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 terapeutisk reduksjon av vekten av en menneskelig pasient med behov av samme.

5 2. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvori:

- (a) pasienten ikke har blitt diagnostisert til å ha kronisk nyresykdom (CKD); eller
- (b) pasienten ikke har blitt diagnostisert til å ha diabetisk nefropati (DN).

3. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvori:

- (a) pasienten ikke har kronisk nyresykdom (CKD);

10 (b) pasienten ikke lider av nyresykdom; eller

- (c) pasienten ikke har diabetisk nefropati (DN).

4. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvori:

- (a) pasienten ikke har blitt diagnostisert til å ha diabetes;

- (b) pasienten ikke har blitt diagnostisert til å ha insulinresistens; eller

15 (c) pasienten ikke har blitt diagnostisert til å ha glukoseintoleranse.

5. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvori:

- (a) pasienten ikke har diabetes;

- (b) pasienten ikke har insulinresistens; eller

- (c) pasienten ikke har glukoseintoleranse.

20 6. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvori pasienten ikke har blitt diagnostisert til å ha kardiovaskulær sykdom.

7. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvori patienten ikke har kardiovaskulær sygdom.

8. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvori pasienten ikke har blitt diagnostisert til å ha fettlever sykdom.

9. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvori pasienten ikke har fettlevversykdom.
10. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvori pasienten ikke har forhøyede nivåer av minst én biomarkør forbundet med metabolsk syndrom.
11. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvori pasienten ikke har blitt diagnostisert til å ha kreft.
- 5 12. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvori pasienten ikke har kreft.
13. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvori:
- (a) pasienten ikke lider av autoimmunsykdom;
 - (b) pasienten ikke lider av respiratorisk sykdom;
 - (c) pasienten ikke lider av neurodegenerativ sykdom;
 - 10 (d) pasienten ikke lider av leversykdom; eller
 - (e) pasienten ikke lider av smittsom sykdom.
14. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvori pasienten er ekstremt overvektig.
15. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvori i det minste en del av forbindelsen er til stede som en amorf form som oppviser et røntgendiffraksjonsmønster ($\text{CuK}\alpha$) med en halotopp ved
- 15 omtrent $13,5^\circ 2\theta$, og en T_g fra omtrent 120°C til omtrent 135°C .
16. Forbindelse for anvendelse ifølge enhver ett av kravene 1 til 15, hvori forbindelsen administreres i en daglig dose fra 5 mg til 50 mg.
17. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 16, hvori den daglige dosen er omtrent 10 mg, omtrent 20 mg, eller omtrent 40 mg.
- 20 18. Anvendelse av en forbindelse som definert i krav 1 eller krav 15 for framstilling av et medikament for terapeutisk reduksjon av vekten av en menneskelig pasient som definert i ett av kravene 1 til 14.
19. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvori forbindelsen er formulert som en fast dispersjon som omfatter forbindelsen ifølge krav 1 og et hjelpestoff.
20. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 19, hvori hjelpestoffet er en metakrylsyre-etylakrylat-
- 25 kopolymer.
21. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 20, hvori monomerforholdet i metakrylsyre-etylakrylat-kopolymeren er 1:1.