



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3021839 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/18 (2006.01)
A61K 31/05 (2006.01)
A61K 31/343 (2006.01)
A61K 31/39 (2006.01)
A61K 31/4196 (2006.01)
A61K 45/06 (2006.01)
A61P 17/02 (2006.01)
A61P 19/04 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.10.04
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.06.23
(86)	European Application Nr.	14825819.7
(86)	European Filing Date	2014.07.18
(87)	The European Application's Publication Date	2016.05.25
(30)	Priority	2013.07.18, US, 201361847744 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	Baylor College Of Medicine, One Baylor Plaza, Houston, TX 77030-3411, USA
(72)	Inventor	TWEARDY, David, J., 3769 Nottingham, Houston, TX 77005, USA KASEMBELI, Moses, M., 4045 Linkwood Apt. 222, Houston, TX 77025, USA XU, Marvin, X., 11 Xicaitun RoadCommunity AJingMing DistrictKaifeng, Henan 475100, Kina AGARWAL, Sandeep, K., One Baylor Plaza, Houston, TX 77030, USA PEDROZA, Mesias, One Baylor Plaza, Houston, TX 77030, USA
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54) Title **COMPOSITIONS FOR TREATMENT OF FIBROSIS**

(56) References

Cited:

US-A1- 2010 035 793

US-A1- 2013 123 266

US-A1- 2010 041 685

M. PEDROZA ET AL: "STAT-3 contributes to pulmonary fibrosis through epithelial injury and fibroblast-myofibroblast differentiation", THE FASEB JOURNAL, vol. 30, no. 1, 31 August 2015 (2015-08-31), pages 129-140, XP055336659, US ISSN: 0892-6638, DOI: 10.1096/fj.15-273953

AFSHA A TOPAL ET AL: "Scleroderma therapy: clinical overview of current trends and future perspective", RHEUMATOLOGY INTERNATIONAL ; CLINICAL AND EXPERIMENTAL INVESTIGATIONS, SPRINGER, BERLIN, DE, vol. 33, no. 1, 3 August 2012 (2012-08-03) , pages 1-18, XP035156213, ISSN: 1437-160X, DOI: 10.1007/S00296-012-2486-1

Mesias Pedroza: "The Role Of STAT-3 In The Development Of Pulmonary and Dermal Fibrosis", , 1 October 2013 (2013-10-01), page 2573, XP055336673, Retrieved from the Internet: URL:<http://acrabstracts.org/abstract/the-role-of-stat-3-in-the-development-of-pulmonary-and-dermal-fibrosis/> [retrieved on 2017-01-18]

None

BIKASH DEBNATH ET AL: "Small Molecule Inhibitors of Signal Transducer and Activator of Transcription 3 (Stat3) Protein", JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, vol. 55, no. 15, 31 May 2012 (2012-05-31), pages 6645-6668, XP055326149, US ISSN: 0022-2623, DOI: 10.1021/jm300207s

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/>

3021839

Patentkrav

1. Forbindelse for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling, forebygging eller reduksjon av risikoen eller alvorlighetsgraden av fibrose av hud, hjerte, tarmer, bukspyttkjertel, ledd, lever, retroperitoneum eller nyrer hos et individ med behov for dette, hvor nevnte forbindelse velges fra gruppen bestående av N-(1',2'-dihydroksy-
5 1,2'-binaftalen-4'-yl)-4-metoksybenzensulfonamid, N-(3,1'-dihydroksy-
[1,2']binaftalenyl-4'-yl)-4-metoksy-benzensulfonamid, N-(4,1'-dihydroksy-
[1,2']binaftalenyl-4'-yl)-4-metoksy-benzensulfonamid, N-(5,1'-dihydroksy-
[1,2']binaftalenyl-4'-yl)-4-metoksy-benzensulfonamid, N-(6,1'-dihydroksy-
10 [1,2']binaftalenyl-4'-yl)-4-metoksy-benzensulfonamid, N-(7,1'-dihydroksy-
[1,2']binaftalenyl-4'-yl)-4-metoksy-benzensulfonamid, N-(8,1'-dihydroksy-
[1,2']binaftalenyl-4'-yl)-4-metoksy-benzensulfonamid og 4-brom-N-(1,6'-dihydroksy-
[2,2']binaftalenyl-4'-yl)-benzensulfonamid eller en blanding eller et salt derav.
- 15 2. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvor nevnte fremgangsmåte omfatter å tilveiebringe forbindelsen til nevnte individ i multiple doser, fortrinnsvis hvor de multiple doser er atskilt med timer, dager eller uker.
3. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvor nevnte individ tilveiebringes med
20 en ytterligere terapi for fibrosen.
4. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvor forbindelsen hemmer Stat3, Stat1 eller begge.
- 25 5. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvor nevnte fremgangsmåte videre omfatter diagnostisering av fibrosen.
6. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvor i nevnte fremgangsmåte tilveiebringes forbindelsen intravenøst, intradermalt, intraarterielt, intraperitonealt,
30 intralesjonalt, intrakranielt, intraartikulært, intraprostatiskalt, intrapleuralt, intratrakealt, intranasalt, intravitrealt, intravaginalt, intrarektalt, topisk, intratumoralt, intramuskulært, intraperitonealt, subkuttant, subkonjunktivalt, intravesikulært,

3021839

mukosalt, intraperikardialt, intraumbilikalt, intraokulært, oralt, topisk, lokalt, ved injeksjon, infusjon, kontinuerlig infusjon, lokalisert perfusjon, via et kateter, via en lavage, i lipidsammensetninger, i liposomsammensetninger eller som en aerosol.

- 5 **7.** Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvor i nevnte fremgangsmåte tilveiebringes forbindelsen ved injeksjon.
- 8.** Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvor i nevnte fremgangsmåte tilveiebringes forbindelsen subkutan.
- 10 **9.** Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvor i nevnte fremgangsmåte tilveiebringes forbindelsen topisk.
- 10.** Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvor i nevnte fremgangsmåte tilveiebringes forbindelsen systemisk.
- 15 **11.** Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvor i nevnte fremgangsmåte tilveiebringes forbindelsen lokalt.
- 12.** Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvor nevnte individ ikke har kreft.
- 20 **13.** Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvor nevnte individ ikke er mistenkt for å ha kreft.
- 14.** Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvor nevnte fibrose er skleroderma.
- 25 **15.** Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvor forbindelsen er N-(1',2'-dihydroksy-1,2'-binaftalen-4'-yl)-4-metoksybensensulfonamid eller et salt derav.