



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3444261 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07J 63/00 (2006.01)
A61K 31/565 (2006.01)
A61P 29/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

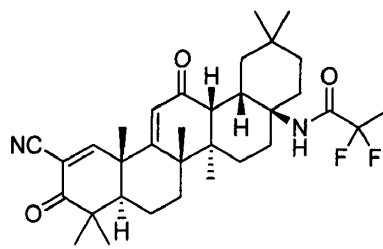
(45)	Translation Published	2021.04.26
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.01.13
(86)	European Application Nr.	17175885.7
(86)	European Filing Date	2013.04.24
(87)	The European Application's Publication Date	2019.02.20
(30)	Priority	2012.04.27, US, 201261687669 P 2013.03.08, US, 201361775288 P 2013.03.13, US, 201361780444 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
(62)	Divided application	EP2841445, 2013.04.24
(73)	Proprietor	Reata Pharmaceuticals, Inc., 2801 Gateway Drive, Suite 150, Irving, TX 75063- 2648, USA
(72)	Inventor	ANDERSON, Eric, 602 Nicholas Ct., Southlake, TX 76092, USA DECKER, Andrea, Spalenring 11, 4055 Basel, Sveits LIU, Xiaofeng, 320 Meadowood Ln., Coppell, TX 75019, USA
(74)	Agent or Attorney	CURO AS, Vestre Rosten 81, 7075 TILLER, Norge

(54)	Title	2,2-DIFLUOROPROPIONAMIDE DERIVATIVE OF BARDOXOLONE METHYL, PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS AND POLYMORPHS THEREOF FOR USE IN TREATING CERTAIN CONDITIONS
(56)	References Cited:	WO-A1-2009/129546 WO-A1-2012/125488 WO-A1-2013/188818

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/>

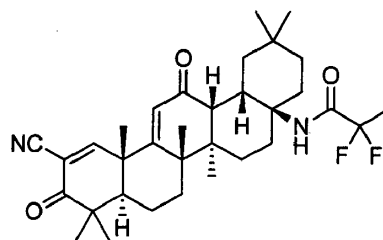
Patentkrav

1. Forbindelse med formelen:

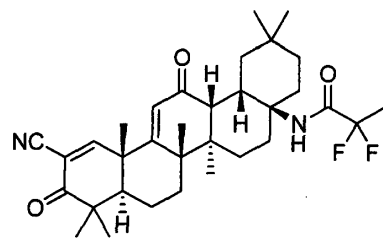


5 eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme, for anvendelse i behandling eller forebygging av kreft, hvori forbindelsen er arrangert til å til å administreres i kombinasjon med en immunterapi.

2. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, som er en forbindelse med formelen:



3. Polymorf form av en forbindelse som oppviser formelen:



10 for anvendelse i behandling eller forebygging av kreft, hvori den polymorfe formen er arrangert til å administreres i kombinasjon med en immunterapi; og

hvori den polymorfe formen har et røntgenpulverdiffraksjonsmønster (CuKα) som omfatter en halotopp ved omtrent 14 °2θ, eller

15 den polymorfe formen er en oppløsning som oppviser et røntgenpulverdiffraksjonsmønster (CuKα) med topper ved omtrent 5,6, 7,0, 10,6, 12,7, og 14,6 °2θ, eller

den polymorfe formen er en oppløsning som oppviser et røntgenpulverdiffraksjonsmønster (CuKα) med topper ved omtrent 7,0, 7,8, 8,6, 11,9, 13,9 (dobbel topp), 14,2, og 16,0 °2θ, eller

den polymorfe formen er et acetonitril hemisolvat med et røntgenpulverdiffraksjonsmønster (CuK α) som oppviser topper ved omtrent 7,5, 11,4, 15,6, og 16,6 °2 θ , eller

den polymorfe formen er en oppløsning som oppviser et røntgenpulverdiffraksjonsmønster (CuK α) med topper ved omtrent 6,8, 9,3, 9,5, 10,5, 13,6, og 15,6 °2 θ .

4. Farmasøytisk blanding for anvendelse i behandling eller forebygging av kreft, hvori den farmasøytiske blandingen omfatter:

en aktiv bestanddel bestående av en forbindelse som definert i krav 1 eller 2 eller en polymorf form som definert i krav 3; og

en farmasøytisk akseptabel bærer;

hvor den farmasøytiske blandingen er arrangert til å administreres i kombinasjon med en immunterapi.

5. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1 eller 2 eller den polymorfe formen for anvendelse ifølge krav 3 eller den farmasøytiske blandingen for anvendelse ifølge krav 4, hvori immunterapien er en kreft-mårettet immunterapi, en dendrittisk celle-basert immunterapi, eller en adoptiv T-celle-immunterapi.

6. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1 eller 2 eller den polymorfe formen for anvendelse ifølge krav 3 eller den farmasøytiske blandingen for anvendelse ifølge krav 4, hvori immunterapien er et kreft-mårettet antistoff som er valgt fra trastuzumab, alemtuzumab, bevacizumab, cetuximab, panitumumab, ibritumomab tiuxetan, tositumomab, brentuximab vedotin, ado-trastuzumab emtansin og denileukin-ditox.

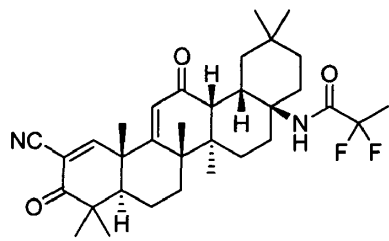
7. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 6 eller den polymorfe formen for anvendelse ifølge krav 6 eller den farmasøytiske blandingen for anvendelse ifølge krav 6, hvori kreftformen er karsinom, sarkom, lymfom, leukemi, melanom, mesoteliom, multippel myelom eller seminom.

8. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 7 eller den polymorfe formen for anvendelse ifølge krav 7 eller den farmasøytiske blandingen for anvendelse ifølge krav 7, hvori kreftformen er melanom.

9. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 6 eller den polymorfe formen for anvendelse ifølge krav 6 eller den farmasøytiske blandingen for anvendelse ifølge krav 6, hvori kreftformen er i blæren, blodet, knoklene, hjernen, brystet, sentralnervesystemet, cervix, kolon, endometrium, spiserøret, galleblæren, genitaliene, urogenital-kanalen, hodet, nyrene, strupehodet, leveren, lungene,

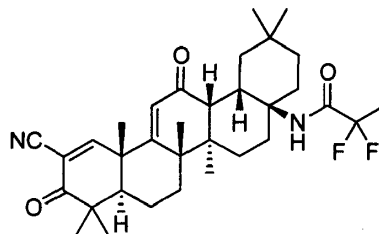
muskelvevet, halsen, de orale eller nasale slimhinnene, eggstokkene, pankreas, prostata, huden, milten, tynntarmen, tykktarmen, magen, testiklene eller skjoldbruskkjertelen.

10. Forbindelse med formelen:

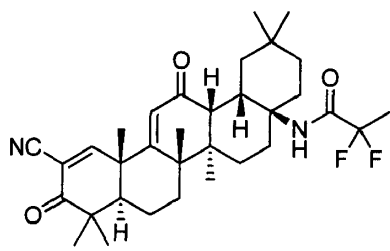


- 5 eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme, for anvendelse i behandling eller forebygging av en tilstand forbundet med oksidativt stress forårsaket av mitokondriell dysfunksjon.

11. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 10, som er en forbindelse med formelen:



12. Polymorf form av en forbindelse med formelen:



10

for anvendelse i behandling eller forebygging av en tilstand forbundet med oksidativt stress forårsaket av mitokondriell dysfunksjon;

hvor den polymorfe formen har et røntgenpulverdiffraksjonsmønster (CuK α) med en halotopp ved omtrent 14 °2 θ , eller

- 15 den polymorfe formen er en oppløsning som oppviser et røntgenpulverdiffraksjonsmønster (CuK α) med topper ved omtrent 5,6, 7,0, 10,6, 12,7, og 14,6 °2 θ , eller

den polymorfe formen er en oppløsning som oppviser et røntgenpulverdiffraksjonsmønster (CuK α) med topper ved omtrent 7,0, 7,8, 8,6, 11,9, 13,9 (dobbel topp), 14,2, og 16,0 °2 θ , eller

den polymorfe formen er et acetonitril-hemisolvat som oppviser et røntgenpulverdiffraksjonsmønster (CuK α) med topper ved omtrent 7,5, 11,4, 15,6, og 16,6 °2 θ , eller

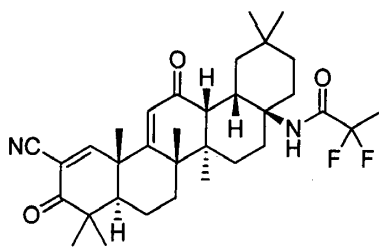
den polymorfe formen er en oppløsning som oppviser et røntgenpulverdiffraksjonsmønster (CuK α) med topper ved omtrent 6,8, 9,3, 9,5, 10,5, 13,6, og 15,6 °2 θ .

13. Farmasøytisk blanding for anvendelse i behandling eller forebygging av en tilstand forbundet med oksidativt stress forårsaket av mitokondriell dysfunksjon, hvori den farmasøytiske blandingen omfatter:

en aktiv bestanddel bestående av en forbindelse som definert i krav 10 eller 11 eller en polymorf form som definert i krav 12; og

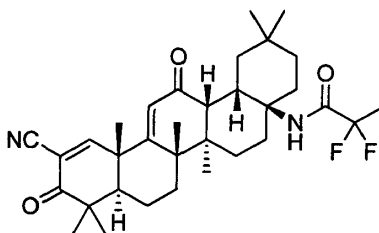
en farmasøytisk akseptabel bærer.

14. Forbindelse med formelen:

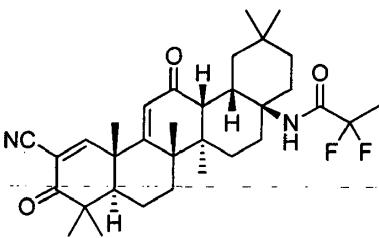


eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme, for anvendelse i behandling eller forebygging av en slaglidelse.

15. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 14, som er en forbindelse med formelen:



16. Polymorf form av en forbindelse med formelen:



for anvendelse i behandling eller forebygging en slaglidelse;

hvor den polymorfe formen har et røntgenpulverdiffraksjonsmønster (CuK α) som omfatter en halotopp ved omtrent 14 °2 θ , eller

5 den polymorfe formen er en oppløsning med et røntgenpulverdiffraksjonsmønster (CuK α) som omfatter topper ved omtrent 5,6, 7,0, 10,6, 12,7 og 14,6 °2 θ , eller

den polymorfe formen er en oppløsning som oppviser et røntgenpulverdiffraksjonsmønster (CuK α) med topper ved omtrent 7,0, 7,8, 8,6, 11,9, 13,9 (dobbel topp), 14,2, og 16,0 °2 θ , eller

10 den polymorfe formen er et acetonitril-hemisolvat som oppviser et røntgenpulverdiffraksjonsmønster (CuK α) med topper ved omtrent 7,5, 11,4, 15,6, og 16,6 °2 θ , eller

den polymorfe formen er en oppløsning som oppviser et røntgenpulverdiffraksjonsmønster (CuK α) med topper ved omtrent 6,8, 9,3, 9,5, 10,5, 13,6, og 15,6 °2 θ .

15 17. Farmasøytisk blanding for anvendelse i behandling eller forebygging av en slaglidelse, hvor den farmasøytiske blandingen omfatter:

en aktiv bestanddel bestående av en forbindelse som definert i krav 14 eller 15 eller en polymorf form som definert i krav 16; og

en farmasøytisk akseptabel bærer.

20 18. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 14 eller 15 eller den polymorfe formen for anvendelse ifølge krav 16 eller den farmasøytiske blandingen for anvendelse ifølge krav 17, hvor slaglidelsen er epilepsi.