



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2125850 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 407/14 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

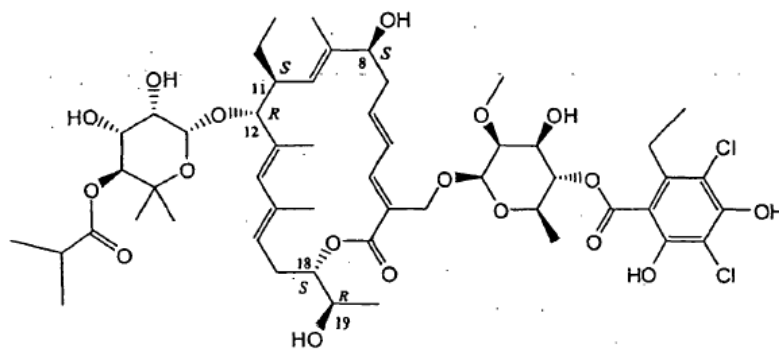
(21)	Translation Published	2018.10.01
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.05.30
(86)	European Application Nr.	08713185.0
(86)	European Filing Date	2008.01.22
(87)	The European Application's Publication Date	2009.12.02
(30)	Priority	2007.01.22, US, 881950 P 2007.07.31, US, 831886
(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 ; MT ; NL ; NO ; PL ; PT ; RO ; SE ; SI ; SK ; TR
(73)	Proprietor	Merck Sharp & Dohme Corp., 126 East Lincoln Avenue, Rahway, NJ 07065, US-USA
(72)	Inventor	CHIU, Yu-Hung, 10615 Dabney Dr. 20, San Diego, CA 92126, US-USA CHE, Tessie, Mary, 101 Hudson Street Suite 3501, Jersey City, NJ 07302, US-USA ROMERO, Alex, 2219 Howard Avenue, San Diego, CA 92104, US-USA ICHIKAWA, Yoshi, 101 Hudson Street Suite 3501, Jersey City, NJ 07302, US-USA SHUE, Youe-Kong, 7869 Via Teca, Carlsbad, CA 92009, US-USA
(74)	Agent or Attorney	TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

(54)	Title	MACROCYCLIC POLYMORPHS, COMPOSITIONS COMPRISING SUCH POLYMORPHS, METHODS OF MANUFACTURE AND USE THEREOF
(56)	References Cited:	WO-A2-2004/014295, GERBER MICHAEL ET AL: "OPT-80, a macrocyclic antimicrobial agent for the treatment of Clostridium difficile infections: a review." EXPERT OPINION ON INVESTIGATIONAL DRUGS APR 2008, vol. 17, no. 4, April 2008 (2008-04), pages 547-553, XP002479935 ISSN: 1744-7658, WO-A-2006/085838, US-A1- 2007 259 949, US-A- 3 978 211, CAIRA M R: "CRYSTALLINE POLYMORPHISM OF ORGANIC COMPOUNDS" TOPICS IN CURRENT CHEMISTRY, SPRINGER, BERLIN, DE, vol. 198, 1 January 1998 (1998-01-01), pages 163-208, XP001156954 ISSN: 0340-1022, ARNONE A ET AL: "STRUCTURE ELUCIDATION OF THE MACROCYCLIC ANTIBIOTIC LIPIARMYCIN" JOURNAL OF THE CHEMICAL SOCIETY, PERKIN TRANSACTIONS 1, CHEMICAL SOCIETY. LETCHWORTH, GB, 1 January 1987 (1987-01-01), pages 1353-1359, XP000578201 ISSN: 0300-922X, US-A- 5 583 115, HOCHLOWSKI J E ET AL: "TIACUMICINS A NOVEL COMPLEX OF 18-MEMBERED MACROLIDES II. ISOLATION AND STRUCTURE DETERMINATION" JOURNAL OF ANTIBIOTICS, JAPAN ANTIBIOTICS RESEARCH ASSOCIATION, TOKYO, JP, vol. XL, no. 5, 1 May 1987 (1987-05-01), pages 575-588, XP000995837 ISSN: 0021-8820 cited in the application

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

- 5 **1.** Krystallinsk polymorf som omfatter en forbindelse med formel I:

**Formel I**

- 10 **karakterisert ved** et pulverrøntgendiffraksjonsmønster med minst topper ved diffraksjonsvinkler 2θ på $7,7^\circ$, $15,0^\circ$ og $18,8^\circ \pm 0,2$.
- 2.** Den krystallinske polymorfen ifølge krav 1, **karakterisert ved** en DSC-endoterm i området fra 174 til 186°C .
- 15 **3.** Farmasøytisk sammensetning som omfatter den krystallinske polymorfen ifølge krav 1 eller krav 2.
- 4.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 3, hvori polymorfen av formel I er til stede fra 75 til $99,99\%$ av den totale vekten, og hvori den farmasøytiske sammensetningen er i en fast doseringsform.
- 20 **5.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 3, hvori polymorfen av formel I er til stede i minst 85% av totalvekten, og hvori den farmasøytiske sammensetningen er i en fast doseringsform.
- 25 **6.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 3, hvori polymorfen av formel I er til stede i minst 90% av totalvekten.
- 7.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 3, hvori polymorfen av formel I er til stede i minst 95% av totalvekten, og hvori den farmasøytiske sammensetningen er i en
- 30

fast doseringsform.

- 5 **8.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 3, hvori polymorfen av formel I er til stede i minst ca. 99 % av totalvekten, og hvori den farmasøytiske sammensetningen er i en fast doseringsform.

9. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 6, hvori den farmasøytiske sammensetningen er i en fast doseringsform.

- 10 **10.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge ett av kravene 3 til 9 som videre omfatter en farmasøytisk akseptabel bærer.

15 **11.** Farmasøytisk sammensetning ifølge ett av kravene 3 til 10 for anvendelse ved behandling eller forebygging av bakterielle infeksjoner i et pattedyr.

12. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 11, hvori pattedyret er menneske.

13. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 11 eller 12, hvori bakterieinfeksjonen er *Clostridium difficile*-infeksjon.

20

14. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 11 eller 13, hvori bakterieinfeksjonen er en gastrointestinal infeksjon.