



(12) Translation of
european patent specification

(11) NO/EP 2358379 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/70 (2006.01)
A61K 31/7048 (2006.01)
A61K 31/7052 (2006.01)
A61P 31/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

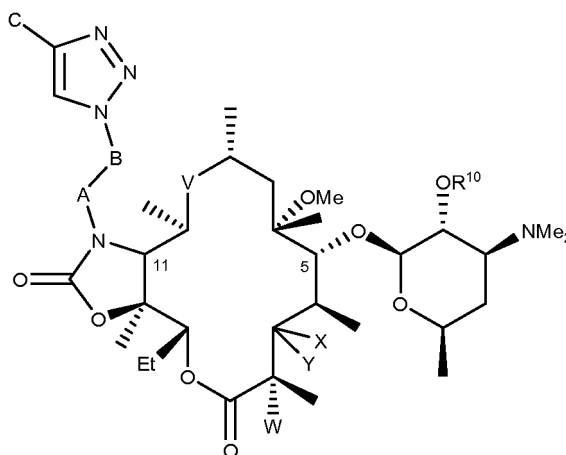
(21)	Translation Published	2016.04.18
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2015.12.16
(86)	European Application Nr.	09822828.1
(86)	European Filing Date	2009.10.24
(87)	The European Application's Publication Date	2011.08.24
(30)	Priority	2008.10.24, US, 108110 P 2008.10.24, US, 108112 P 2008.10.24, US, 108134 P 2008.10.24, US, 108137 P 2008.10.24, US, 108168 P 2009.03.20, US, 162109 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 SM TR
(73)	Proprietor	Cempra Pharmaceuticals, Inc., 6320 Quadrangle Drive, Suite 360, Chapel Hill, NC 27517, US-USA
(72)	Inventor	FERNANDES, Prabhavathi, B., 114 Milton Avenue, Chapel Hill, NC 27514, US-USA
(74)	Agent or Attorney	Orsnes Patent ApS, Forskerparken 10, DK-5230 ODENSE, Danmark

(54)	Title	BIODEFENSES USING TRIAZOLE-CONTAINING MACROLIDES
(56)	References Cited:	US-A1- 2003 176 327 US-A1- 2006 100 164 LIANG C H ET AL: "Synthesis and biological activity of new 5-O-sugar modified ketolide and 2- fluoro-ketolide antibiotics", BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS, PERGAMON, ELSEVIER SCIENCE, GB, vol. 15, no. 5, 1 March 2005 (2005-03-01), pages 1307-1310, XP025314537, ISSN: 0960-894X, DOI: 10.1016/J.BMCL.2005.01.027 [retrieved on 2005-03-01]

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 for anvendelse i behandlingen av en sykdom forårsaket minst delvis av en organisme valgt fra gruppen som består av *Bacillus anthracis*, *Yersinia pestis*, *Francisella tularensis* og *Burkholderia mallei*, og kombinasjoner derav; hvor forbindelsen har formelen



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori:

R^{10} er hydrogen eller acyl;

X er H; og Y er OR^7 ; hvor R^7 er et monosakkarid eller disakkarid, alkyl, aryl, heteroaryl, acyl eller $C(O)NR_8R_9$, hvor R_8 og R_9 hver er uavhengig valgt fra gruppen som består av hydrogen, hydroksy, alkyl, aralkyl, alkylaryl, heteroalkyl, aryl, heteroaryl, alkoksy, dimetylaminoalkyl, acyl, sulfonyl, ureido og karbamoyl; eller X og Y er tatt sammen med det tilknyttede karbonet for å danne karbonyl;

V er $C(O)$, $C(=NR^{11})$, $CH(NR^{12}, R^{13})$, eller $N(R^{14})CH_2$, hvor $N(R^{14})$ er festet til C-10-karbonet; hvori R^{11} er hydroksy eller alkoksy, R^{12} og R^{13} er hver uavhengig valgt fra gruppen som består av hydrogen, hydroksy, alkyl, aralkyl, alkylaryl, alkoksy, heteroalkyl, aryl, heteroaryl, dimetylaminoalkyl, acyl, sulfonyl, ureido og karbamoyl; R^{14} er hydrogen, hydroksy, alkyl, aralkyl, alkylaryl, alkoksy, heteroalkyl, aryl, heteroaryl, dimetylaminoalkyl, acyl, sulfonyl, ureido eller karbamoyl;

W er H, F, Cl, Br, I eller OH;

A er CH_2 , $C(O)$, $C(O)O$, $C(O)NH$, $S(O)_2$, $S(O)_2NH$, $C(O)NHS(O)_2$;

B er $(CH_2)_n$ hvor n er et heltall i området fra 0-10, eller B er en umettet karbonkjede på 2-10 karboner;

og

C er hydrogen, hydroksy, alkyl, aralkyl, alkylaryl, alkoksy, heteroalkyl, eventuelt substituert aryl, eventuelt substituert heteroaryl, aminoaryl, alkylaminoaryl, acyl, acyloksy, sulfonyl, ureido eller karbamoyl.

2. Forbindelsen for anvendelsen ifølge krav 1, hvori X og Y er tatt sammen med det tilknyttede karbonet for å danne karbonyl
3. Forbindelsen for anvendelsen ifølge krav 1, hvori X er H og Y er OR^7 , hvor R^7 er kladosyl.
4. Forbindelsen for anvendelsen ifølge krav 1, hvori A og B er tatt sammen for å danne propylen, butylen eller pentylen.
5. Forbindelsen for anvendelsen ifølge krav 1, hvori A og B er tatt sammen for å danne butylen.
6. Forbindelsen for anvendelsen ifølge krav 1, hvori C er eventuelt substituert aryl eller eventuelt substituert heteroaryl.
7. Forbindelsen for anvendelsen av hvilket som helst av kravene 1 til 6, hvori V er $-C(O)-$.
8. Forbindelsen for anvendelsen av hvilket som helst av kravene 1 til 7, hvori W er H eller F.

9. Forbindelsen for anvendelsen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 8 hvori A er CH_2 , B er $(\text{CH}_2)_n$, og n er et helt tall fra 2-4.
10. Forbindelsen for anvendelsen av hvilket som helst av kravene 1 til 9, hvori C er 3-aminofenyl eller 3-pyridinyl.
11. Forbindelsen for anvendelsen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 10 hvori R^{10} er hydrogen.
12. Forbindelsen for anvendelsen ifølge krav 8, hvori W er F.
13. Forbindelsen for anvendelsen ifølge krav 10, hvori C er 3-aminofenyl.
14. Forbindelsen for anvendelsen ifølge krav 1, hvori R^{10} er hydrogen, X og Y er tatt sammen med det tilknyttede karbonet for å danne $\text{C}(\text{O})$, V er $\text{C}(\text{O})$, W er F, A er CH_2 , B er $(\text{CH}_2)_n$, n er 3, og C er 3-aminofenyl.
15. Forbindelsen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 14 for anvendelse i den akutte eksponeringsbehandlingen av en pasient som er utsatt for en eller flere organismer valgt fra gruppen som består av *Bacillus anthracis*, *Yersinia pestis*, *Francisella tularensis*, og *Burkholderia mallei*, og kombinasjoner derav.