



(12) Translation of  
european patent specification

(11) NO/EP 2682387 B1

NORWAY

(19) NO  
(51) Int Cl.  
*C07D 207/10 (2006.01)*  
*A61K 31/4025 (2006.01)*  
*A61P 31/04 (2006.01)*

Norwegian Industrial Property Office

---

|      |                                                                      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |
|------|----------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| (21) | Translation Published                                                | 2016.02.22                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |
| (80) | Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent | 2015.10.07                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |
| (86) | European Application Nr.                                             | 13172357.9                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |
| (86) | European Filing Date                                                 | 2009.08.07                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |
| (87) | The European Application's Publication Date                          | 2014.01.08                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |
| (30) | Priority                                                             | 2008.08.08, US, 188307 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                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |
|      | Designated Extension States:                                         | AL BA RS                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |
| (62) | Divided application                                                  | EP2323972, filing date 2009.08.07                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |
| (73) | Proprietor                                                           | Tetraphase Pharmaceuticals, Inc., 480 Arsenal Street, Suite 110, Watertown, MA 02472, US-USA                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |
| (72) | Inventor                                                             | Zahler, Robert, B., 5 East Welling Avenue, Pennington, New Jersey 08534, US-USA<br>Clark, Roger, B., 20 Richard Road, Lexington, Massachusetts 02421, US-USA<br>Hunt, Diana, Katharine, 252 Pearl Street 2, Cambridge, Massachusetts 02139, US-USA<br>Plamondon, Louis, 275 Armand-Frappier, Quebec H7V 4A7, CA-Canada<br>Xiao, Xiao-Yi, 15 Stimson Ave., Lexington, Massachusetts, 02421, US-USA<br>Zhou, Jingye, 75 Carl Street, Newton, Massachusetts 02461, US-USA |
| (74) | Agent or Attorney                                                    | Zacco Norway AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |

---

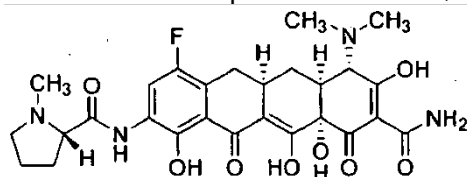
|      |       |                                                     |
|------|-------|-----------------------------------------------------|
| (54) | Title | <b>C7-fluoro substituted tetracycline compounds</b> |
|------|-------|-----------------------------------------------------|

|      |                   |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |
|------|-------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| (56) | References Cited: | EP-A- 0 582 789<br>GB-A- 935 384<br>SATO, F. ET AL: "Structure-activity relationship investigation of some new tetracyclines by electronic index methodology", LOS ALAMOS NATIONAL LABORATORY, PREPRINT ARCHIVE, QUANTITATIVE BIOLOGY 1-18, ARXIV:0708.2931V1 [Q-BIO.BM], 21 AUG 2007 CODEN: LANLCJ URL: <a href="http://arxiv.org/ps_cache/arxiv/pdf/0708/0708.2931v1.pdf">HTTP://ARXIV.ORG/PS_CACHE/ARXIV/PDF/0708/0708.2931V1.PDF</a> , 2007, XP002548287, |
|------|-------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|

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 representert ved følgende strukturelle formel:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

5

2. Farmasøytisk sammensetning omfattende en forbindelse som definert i krav 1, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, en farmasøytisk akseptabel bærer eller tynner og eventuelt ett eller flere ytterligere terapeutiske midler.

10

3. Forbindelse som definert i krav 1, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse i behandling eller forebygging av infeksjoner forårsaket av bakterier.

15

4. Anvendelsen av en forbindelse som definert i krav 1, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for fremstilling av et medikament for behandling eller forebygging av infeksjoner forårsaket av bakterier.

20

5. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 3 eller anvendelse ifølge krav 4, hvori infeksjonen er forårsaket av en Gram-positiv bakterie valgt fra *Staphylococcus spp.*, *Streptococcus spp.*, *Propionibacterium spp.*, *Enterococcus spp.*, *Bacillus spp.*, *Corynebacterium spp.*, *Nocardia spp.*, *Clostridium spp.*, *Actinobacteria spp.* og *Listeria spp.*.

25

6. Anvendelse eller forbindelse for anvendelse ifølge krav 5, hvori bakterien er *Bacillus anthracis*.

30

7. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 3 eller anvendelse ifølge krav 4, hvori infeksjonen er forårsaket av en Gram-negative bakterie valgt fra *Enterobacteriaceae*, *Bacteroidaceae*, *Vibrionaceae*, *Pasteurellae*, *Pseudomonadaceae*, *Neisseriaceae*, *Rickettsiae*, *Moraxellaceae*, hvilke som helst arter av *Proteeae*, *Acinetobacter spp.*, *Helicobacter spp.* og *Campylobacter spp.*.

8. Anvendelse eller forbindelse for anvendelse ifølge krav 7, hvori bakterien er *E. coli*, *Klebsiella pneumonia*, *Yersinia pestis* eller *Francisella tularensis*.
- 5 9. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 3 eller anvendelse ifølge krav 4, hvori infeksjonen er forårsaket av *K. pneumoniae*, *Salmonella*, *E. hirae*, *A. baumannii*, *M. catarrhalis*, *H. influenzae*, *P. aeruginosa*, *E. faecium*, *E. coli*, *S. aureus* eller *E. faecalis*.
- 10 10. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 3 eller anvendelse ifølge krav 4, hvori infeksjonen er forårsaket av rickettsia, klamydia, *Legionella spp.* eller *Mycoplasma spp.*.
- 15 11. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 3 eller anvendelse ifølge krav 4, hvori infeksjonen er en hudinfeksjon, en luftveisinfeksjon, en sykehusinfeksjon, en intraabdominal infeksjon eller en urinveisinfeksjon.
- 20 12. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 3 eller anvendelse ifølge krav 4, hvori forbindelsen som definert i krav 1, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, administreres alene.
- 25 13. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 3 eller anvendelse ifølge krav 4, hvori forbindelsen som definert i krav 1, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, administreres i kombinasjon med ett eller flere ytterligere terapeutiske midler.
14. Fremgangsmåte for å danne en sammensetning som definert i krav 2, hvilken fremgangsmåte omfatter å blande forbindelsen som definert i krav 1, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og en farmasøytisk akseptabel bærer eller tynner.