



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 2807926 B1

NORWAY

(19) NO  
(51) Int Cl.  
*A01N 37/18 (2006.01)*  
*A61K 31/16 (2006.01)*  
*C07C 237/26 (2006.01)*

**Norwegian Industrial Property Office**

---

|      |                                                                            |                                                                                                                                                                                 |
|------|----------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| (45) | Translation Published                                                      | 2021.03.01                                                                                                                                                                      |
| (80) | Date of The European<br>Patent Office Publication of<br>the Granted Patent | 2020.10.07                                                                                                                                                                      |
| (86) | European Application Nr.                                                   | 14156670.3                                                                                                                                                                      |
| (86) | European Filing Date                                                       | 2009.05.26                                                                                                                                                                      |
| (87) | The European Application's<br>Publication Date                             | 2014.12.03                                                                                                                                                                      |
| (30) | Priority                                                                   | 2008.05.23, US, 128712 P                                                                                                                                                        |
| (84) | Designated Contracting<br>States:                                          | AT ; BE ; BG ; CH ; CY ; CZ ; DE ; DK ; EE ; ES ; FI ; FR ; GB ; GR ; HR ; HU ; IE ;<br>IS ; IT ; LI ; LT ; LU ; LV ; MC ; MK ; MT ; NL ; NO ; PL ; PT ; RO ; SE ; SI ; SK ; TR |
| (62) | Divided application                                                        | EP2296464, 2009.05.26                                                                                                                                                           |
| (73) | Proprietor                                                                 | Paratek Pharmaceuticals, Inc., 75 Kneeland Street, Boston, MA 02111, USA                                                                                                        |
| (72) | Inventor                                                                   | Cvestovich, Raymond, 4 Beacon Way, apt. 1408, Jersey CityNew Jersey 07304,<br>USA<br>Warchol, Tadeusz, 177 South Street, NorthboroughMassachusetts 01532, USA                   |
| (74) | Agent or Attorney                                                          | BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge                                                                                                                              |

---

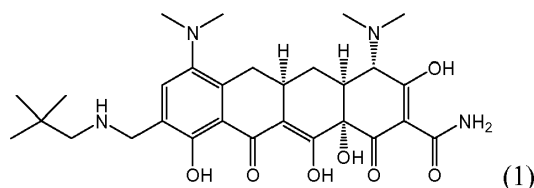
(54) Title                   **Salts and polymorphs of a tetracycline compound**

(56) References  
Cited: WO-A1-2009/120389  
J.Y.L. CHUNG ET AL: "Synthesis development of an aminomethylcycline antibiotic via an electronically tuned acyliminium Freidel-Crafts reaction", TETRAHEDRON LETTERS., vol. 49, 2008, pages 6095-6100, XP002632233, NLELSEVIER, AMSTERDAM. ISSN: 0040-4039  
R. O'SHEA ET AL: "Physicochemical properties of antibacterial compounds: implications for drug discovery", JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY., vol. 51, no. 10, 22 May 2008 (2008-05-22), pages 2871-2878, XP002730614, USAMERICAN CHEMICAL SOCIETY. WASHINGTON. ISSN: 0022-2623

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. Krystallinsk form av tosylatsaltet ifølge forbindelse 1:



for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av en bakteriell infeksjon hos et individ.

2. Krystallinsk form av tosylatsaltet ifølge forbindelse 1 for anvendelse ifølge krav 1, hvor den krystallinske formen er en polymorf av den krystallinske formen av tosylatsaltet ifølge forbindelse 1.

3. Krystallinsk form av tosylatsaltet ifølge forbindelse 1 for anvendelse ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, hvor den bakterielle infeksjonen er en grampositiv eller gramnegativ bakteriell infeksjon, eller hvor den bakterielle infeksjonen er valgt fra *K. pneumonia*, *Salmonella*, *E. hirae*, *A. baumannii*, *B. catarrhalis*, *H. influenza*, *P. aeruginosa*, *E. faecium*, *E. coli*, *S. aureus* eller *E. Faecalis*.

4. Farmasøytisk sammensetning omfattende en krystallinsk form av tosylatsaltet ifølge forbindelse 1 og et farmasøytisk akseptabelt fortynningsmiddel, eksipiens eller bæremiddel, for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av en bakteriell infeksjon hos et individ.

5. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 4, hvor den krystallinske formen er en polymorf av den krystallinske formen av tosylatsaltet ifølge forbindelse 1.

6. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 4-5, hvor den bakterielle infeksjonen er en grampositiv eller gramnegativ bakteriell infeksjon, eller hvor den bakterielle infeksjonen er valgt fra *K. pneumonia*, *Salmonella*, *E. hirae*, *A. baumannii*, *B. catarrhalis*, *H. influenza*, *P. aeruginosa*, *E. faecium*, *E. coli*, *S. aureus* eller *E. Faecalis*.

7. Krystallinsk form av tosylatsaltet ifølge forbindelse 1 for anvendelse ifølge krav 2, eller den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 4, hvor

polymorfen er en form 1 polymorf av tosylatsaltet ifølge forbindelse 1 og

**karakterisert ved:**

- (i) et røntgenpulverdiffraksjonsmønster inkludert topper ved omtrent 8,06, 13,02 og 18,83 °2θ ved anvendelse av Cu-Kα-stråling, eller
- 5 (ii) et røntgenpulverdiffraksjonsmønster inkludert topper ved omtrent 8,06, 11,41, 13,02, 18,83, 20,54 og 24,53 °2θ ved anvendelse av Cu-Kα-stråling, eller
- (iii) et røntgenpulverdiffraksjonsmønster inkludert topper ved omtrent 5,60, 8,06, 8,57, 11,41, 13,02, 15,58, 18,83, 20,54 og 24,53 °2θ ved anvendelse av
- 10 Cu-Kα-stråling.

8. Krystallinsk form av tosylatsaltet ifølge forbindelse 1 for anvendelse ifølge krav 2, eller den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 4, hvor polymorfen er en form 2 polymorf av tosylatsaltet ifølge forbindelse 1 og

15 **karakterisert ved:**

- (i) et røntgenpulverdiffraksjonsmønster inkludert topper ved 7,82 og 16,12 °2θ ved anvendelse av Cu-Kα-stråling, eller
- (ii) et røntgenpulverdiffraksjonsmønster inkludert topper ved 7,82, 11,88, 16,12 og 21,46 °2θ ved anvendelse av Cu-Kα-stråling, eller
- 20 (iii) et røntgenpulverdiffraksjonsmønster inkludert topper ved 7,82, 11,88, 12,68, 16,12, 18,63, 21,46 og 23,74 °2θ ved anvendelse av Cu-Kα-stråling.

9. Krystallinsk form av tosylatsaltet ifølge forbindelse 1 for anvendelse ifølge krav 2, eller den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 4, hvor

25 polymorfen er en form 3 polymorf av tosylatsaltet ifølge forbindelse 1 og

**karakterisert ved:**

- (i) et røntgenpulverdiffraksjonsmønster inkludert topper ved omtrent 5,11 og 15,60 °2θ ved anvendelse av Cu-Kα-stråling, eller
- (ii) et røntgenpulverdiffraksjonsmønster inkludert topper ved omtrent 5,11, 8,89, 10,34, 11,76 og 15,60 °2θ ved anvendelse av Cu-Kα-stråling, eller
- 30 (iii) et røntgenpulverdiffraksjonsmønster inkludert topper ved omtrent 5,11, 8,89, 10,34, 11,76, 13,70, 14,81 og 15,60 °2θ ved anvendelse av Cu-Kα-stråling.