



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 2968446 B1

NORWAY

(19) NO  
(51) Int Cl.  
**A61K 38/14 (2006.01)**  
**A61K 31/545 (2006.01)**  
**C07D 501/00 (2006.01)**  
**C07K 9/00 (2006.01)**

**Norwegian Industrial Property Office**

---

|      |  |  |
|------|--|--|
| (21) | Translation Published  | 2017.09.18   |
| (80) | Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent | 2017.05.03   |
| (86) | European Application Nr.   | 14717248.0   |
| (86) | European Filing Date   | 2014.03.06   |
| (87) | The European Application's Publication Date                          | 2016.01.20   |
| (30) | Priority   | 2013.03.13, US, 201361779065 P   |
| (84) | Designated Contracting States:                                       | AL AT BE BG CH CY CZ DE DK EE ES FI FR GB<br>GR HR HU IE IS IT LI LT LU LV MC MK MT NL NO<br>PL PT RO RS SE SI SK SM TR  |
|      | Designated Extension States:   | BA ME  |
| (73) | Proprietor   | Theravance Biopharma Antibiotics IP, LLC, 901, Gateway Boulevard, South San Francisco, CA 94080, US-USA  |
| (72) | Inventor   | ZHANG, Weijiang, 1282 North Montecito Drive, Concord, California 94521, US-USA<br>CHEUNG, Ronnie, 111 Windlea Lane, Redwood City, California 94065, US-USA<br>FILIPOV, Dimitar, 6 Megan Drive, San Francisco, California 94134, US-USA<br>GREEN, Jack, 10 Eddystone Court, Redwood City, California 94065, US-USA<br>LEE, Junning, 822 San Carlos Avenue, El Granada, California 94018, US-USA |
| (74) | Agent or Attorney  | Håmsø Patentbyrå AS, Postboks 171, 4301 SANDNES, Norge   |

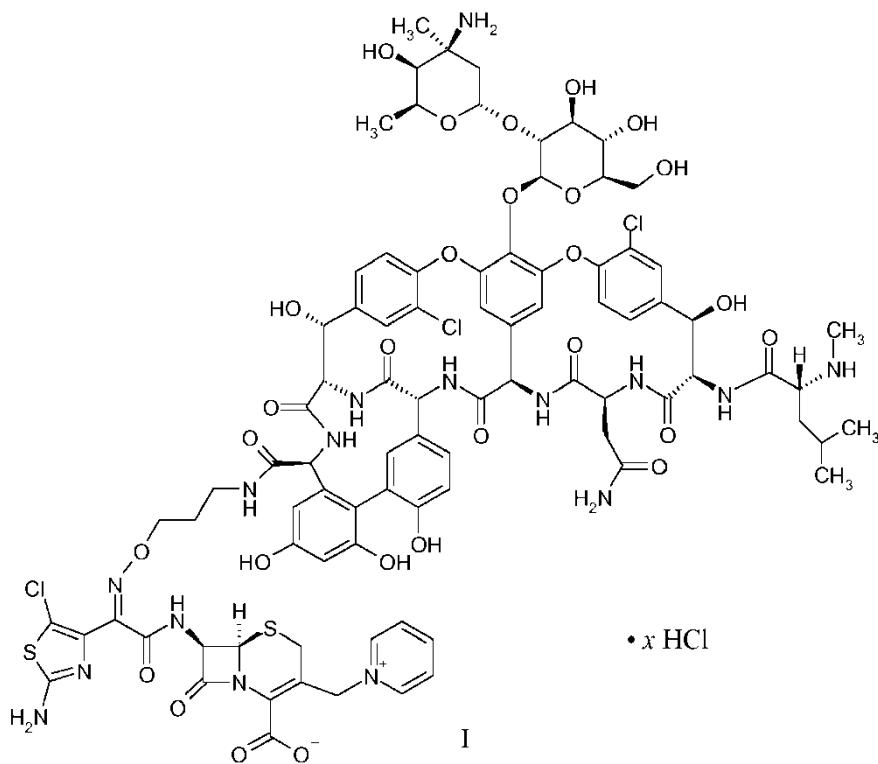
---

|      |                   |  |
|------|-------------------|--|
| (54) | Title             | <b>HYDROCHLORIDE SALTS OF AN ANTIBIOTIC COMPOUND</b>   |
| (56) | References Cited: | WO-A2-2004/092183<br>WO-A2-2005/042568<br>US-A1- 2008 194 464<br>DATABASE MEDLINE [Online] US NATIONAL LIBRARY OF MEDICINE (NLM), BETHESSDA, MD, US; October 2008 (2008-10), LONG DANIEL D ET AL: "A multivalent approach to drug discovery for novel antibiotics.", XP055120347, Database accession no. NLM19168973 cited in the application & THE JOURNAL OF ANTIBIOTICS OCT 2008, vol. 61, no. 10, October 2008 (2008-10), pages 595-602, ISSN: 0021-8820 |

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/>

## P a t e n t k r a v

1. Forbindelse med formel I:



hvor x er i området fra 1 til 2.

- 5        2. Forbindelsen ifølge krav 1, hvor x er 1.
3. Forbindelsen ifølge krav 1, hvor x er 2.
4. Farmasøytisk sammensetning som omfatter en farmasøytisk akseptabel bærer og en forbindelse ifølge krav 1, 2 eller 3.
5. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 4, som omfatter (a) en forbindelse ifølge krav 1, 2 eller 3; (b) sukrose og (c) glysin eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.
- 10      6. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 5, hvor sammensetningen er en lyofilisert sammensetning.
7. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 5, som omfatter:  
           (a) en forbindelse ifølge krav 1, 2 eller 3;  
           (b) 0,5 til 2,0 vektdeler sukrose; og  
           (c) 0,5 til 2,0 vektdeler glysin (som den frie baseekvivalenten);  
           hvor vektdelene av sukrose og glysin er basert på vektdelen av forbindelsen ifølge krav 1, 2 eller 3 (som den frie baseekvivalenten).
- 15

8. Den farmasøytske sammensetningen ifølge krav 6, hvori sammensetningen omfatter 1,0 vektdel sukrose; og 1,5 vektdeler glysin.
9. Den farmasøytske sammensetningen ifølge krav 8, hvori renhetsforandring av forbindelsen ifølge krav 1, 2 eller 3 (som den frie baseekvivalenten) i den farmasøytske sammensetningen er mindre enn 10 % som målt ved høyttlesesvæskekromatografi etter lagring i 12 måneder ved en temperatur i området fra 18 til 25 °C.
10. Forbindelse ifølge krav 1, 2 eller 3 for anvendelse i terapi.
11. Forbindelse ifølge krav 10 for anvendelse i behandlingen av en bakteriell infeksjon.
12. Prosess for fremstilling av en forbindelse ifølge krav 1, idet prosessen omfatter trinnene:
  - (a) å danne en veldig sammensetning som omfatter 26-[[(3-[(Z)-[1-(2-amino-5-klor-4-tiazolyl)-2-[(6R,7R)-2-karboksy-8-okso-3-(pyridiniometyl)-5-tia-1-azabisyklo[4.2.0]okt-2-en-7-yl]amino]-2-oksoetyliden]amino]oksy]propyl]amino]-karbonyl]-26-dekarboksyvankomycin og saltsyre i et molforhold på 1:1 til 1:2;
  - (b) å lyofilisere den vandige sammensetningen for å tilveiebringe en forbindelse ifølge krav 1.
13. Prosessen ifølge krav 12, hvori molforholdet er 1:1.
14. Prosessen ifølge krav 12, hvori molforholdet er 1:2.
15. Fremgangsmåte for å redusere nedbrytningen av 26-[[(3-[(Z)-[1-(2-amino-5-klor-4-tiazolyl)-2-[(6R,7R)-2-karboksy-8-okso-3-(pyridiniometyl)-5-tia-1-azabisyklo[4.2.0]okt-2-en-7-yl]amino]-2-oksoetyliden]amino]oksy]propyl]amino]-karbonyl]-26-dekarboksyvankomycin under lagring, idet fremgangsmåten omfatter (a) å danne en forbindelse ifølge krav 1, 2 eller 3 og (b) å lagre forbindelsen ifølge krav 1, 2 eller 3 ved en temperatur i området fra -25 °C til 25 °C; eller idet fremgangsmåten omfatter (a) å danne en farmasøytsk sammensetning ifølge krav 8 og (b) å lagre den farmasøytske sammensetningen ved en temperatur i området fra -25 °C til 25 °C.
16. Fremgangsmåten ifølge krav 15, hvori temperaturen er i området fra 2 til 8 °C.