



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3139932 B1

NORWAY

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

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2018.12.17
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.08.01
(86)	European Application Nr.	15731245.5
(86)	European Filing Date	2015.05.11
(87)	The European Application's Publication Date	2017.03.15
(30)	Priority	2014.05.09, EP, 14075031
(84)	Designated Contracting States:	AL ; 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 ; RS ; SE ; SI ; SK ; SM ; TR
	Designated Extension States:	BA; ME
	Designated Validation States:	MA
(73)	Proprietor	Astellas Pharma Europe Ltd., 2000 Hillswood Drive, Chertsey, Surrey KT16 0RS, Storbritannia
(72)	Inventor	KARAS, Andreas Johannis, c/o Astellas BVSylviusweg 62, NL-2333 BE Leiden, Nederland LONGSHAW, Christopher Mark, c/o Astellas BVSylviusweg 62, NL-2333 BE Leiden, Nederland
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

(54)	Title	TREATMENT REGIMEN FOR TIACUMICIN COMPOUND
(56)	References Cited:	WO-A1-2013/138748, "Efficacy of tapered fidaxomicin dosing regimens to treat simulated Clostridium difficile infection (CDI) in an in vitro gut model", , 14 May 2014 (2014-05-14), XP055182784, Retrieved from the Internet: URL: http://www.researchgate.net/profile/Chris_Longshaw/publication/262292381_Efficacy_of_tapered_fidaxomicin_dosing_regimens_to_treat_simulated_Clostridium_difficile_infection_(CDI)_in_an_in_vitro_gut_model/links/02e7e53737f70bb807000000.pdf?origin=publication_detail [retrieved on 2015-04-14], WO-A2-2005/112990, C. H. CHILTON ET AL: "Efficacy of alternative fidaxomicin dosing regimens for treatment of simulated Clostridium difficile infection in an in vitro human gut model", JOURNAL OF ANTIMICROBIAL CHEMOTHERAPY, 14 June 2015 (2015-06-14), XP055205152, ISSN:

0305-7453, DOI: 10.1093/jac/dkv156, WO-A1-2014/111254, Soriano et al.: "Abstract: The use of a fidaxomicin chaser as effective salvage therapy for vancomycin-refractory, recurrent Clostridium difficile infections (IDWeek 2013)", , 5 October 2013 (2013-10-05), XP055182724, Retrieved from the Internet: URL:<https://idsa.confex.com/idsa/2013/webprogram/Paper42591.html> [retrieved on 2015-04-14] cited in the application -& Melinda M Soriano ET AL: "The Use of a Fidaxomicin Taper/Pulsed Chaser as Effective Salvage Therapy for Vancomycin-Refractory, Recurrent Clostridium difficile Infections", , 5 October 2013 (2013-10-05), XP055182720, Retrieved from the Internet: URL:<https://idsa.confex.com/idsa/2013/webprogram/Paper42591.html> [retrieved on 2015-04-14], G. W. TANNOCK ET AL: "A new macrocyclic antibiotic, fidaxomicin (OPT-80), causes less alteration to the bowel microbiota of Clostridium difficile-infected patients than does vancomycin", MICROBIOLOGY, vol. 156, no. 11, 19 August 2010 (2010-08-19), pages 3354-3359, XP055182699, ISSN: 1350-0872, DOI: 10.1099/mic.0.042010-0, Ther Adv: "Therapeutic Advances in Gastroenterology Review", , 2012, pages 395-402, XP055182638, Retrieved from the Internet: URL:http://www.ncbi.nlm.nih.gov/pmc/articles/PMC3491684/pdf/10.1177_1756283X12461294.pdf, M. M. SORIANO ET AL: "Novel Fidaxomicin Treatment Regimens for Patients With Multiple Clostridium difficile Infection Recurrences That Are Refractory to Standard Therapies", OPEN FORUM INFECTIOUS DISEASES, vol. 1, no. 2, 1 August 2014 (2014-08-01), pages ofu069-ofu069, XP055182559, DOI: 10.1093/ofid/ofu069, T. J. LOUIE ET AL: "Fidaxomicin Preserves the Intestinal Microbiome During and After Treatment of Clostridium difficile Infection (CDI) and Reduces Both Toxin Reexpression and Recurrence of CDI", CLINICAL INFECTIOUS DISEASES, vol. 55, no. suppl 2, 2 July 2012 (2012-07-02), pages S132-S142, XP055205254, ISSN: 1058-4838, DOI: 10.1093/cid/cis338, C. Chilton ET AL: "2013: K-336. Comparison of Extended Duration Fidaxomicin Dosing Regimens for Treatment of Clostridium difficile Infection (CDI) in an in vitro Gut Model", , September 2013 (2013-09), XP055182841, Retrieved from the Internet: URL:http://www.icaaonline.com/php/icaac2013abstracts/data/papers/2013/K/2013_K-336.htm [retrieved on 2015-04-14] cited in the application, S. JOHNSON ET AL: "Fidaxomicin "Chaser" Regimen Following Vancomycin for Patients With Multiple Clostridium difficile Recurrences", CLINICAL INFECTIOUS DISEASES, vol. 56, no. 2, 28 September 2012 (2012-09-28), pages 309-310, XP055182579, ISSN: 1058-4838, DOI: 10.1093/cid/cis833, C. H. CHILTON ET AL: "Successful treatment of simulated Clostridium difficile infection in a human gut model by fidaxomicin first line and after vancomycin or metronidazole failure", JOURNAL OF ANTIMICROBIAL CHEMOTHERAPY, vol. 69, no. 2, 3 September 2013 (2013-09-03), pages 451-462, XP055182651, ISSN: 0305-7453, DOI: 10.1093/jac/dkt347 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.** Tiacumicinforbindelse, en stereoisomer derav, en polymer derav eller et farmasøytisk akseptabelt solvat derav for anvendelse i oral behandling av *Clostridium difficile*-infeksjoner (CDI) eller *Clostridium difficile*-assosiert diaré eller sykdom (CDAD) hos en pasient ifølge et doseringsregime valgt fra gruppen bestående av:

i. administrering av 200 mg av tiacumicinforbindelsen BID i 5 dager etterfulgt av 5 dagers hvile og deretter 200 mg én gang daglig i ytterligere 10 dager og

10 ii. administrering av 200 mg av tiacumicinforbindelsen BID i 5 dager etterfulgt av én enkelt 200 mg-dose annenhver dag i 20 dager.

15 **2.** Tiacumicinforbindelsen for anvendelse ifølge krav 1, **karakterisert ved at** tiacumicinforbindelsen er valgt fra gruppen bestående av tiacumicin A, tiacumicin B og analoger derav, (dialkyltiacumiciner og bromotiacumiciner), tiacumicin C, tiacumicin D, tiacumicin E, tiacumicin F og lipiarmycin.

20 **3.** Tiacumicinforbindelsen for anvendelse ifølge hvert av kravene 1-2, **karakterisert ved at** tiacumicinforbindelsen er lipiarmycin eller tiacumicin B eller en stereoisomer derav.

25 **4.** Tiacumicinforbindelsen for anvendelse ifølge hvert av kravene 1-3, **karakterisert ved at** tiacumicinforbindelsen er tiacumicin B eller en polymorf derav.

30 **5.** Tiacumicinforbindelsen for anvendelse ifølge hvert av kravene 1-4, **karakterisert ved at** tiacumicinforbindelsen er R-tiacumicin B (fidaksomicin).

35 **6.** Tiacumicinforbindelsen for anvendelse ifølge hvert av kravene 1-5, **karakterisert ved at** det anvendes en tablett, en suspensjon, et tørt pulver for en vandig suspensjon, et tørt granulat for en vandig suspensjon, en filmebelagt tablett eller en dispergerbar tablett.

35 **7.** Tiacumicinforbindelsen for anvendelse ifølge hvert av kravene 1-6, **karakterisert ved at** det anvendes en filmebelagt tablett.

8. Farmasøytisk sammensetning omfattende en tiacumicinforbindelse, en stereoisomer derav, en polymer derav eller et farmasøytisk akseptabelt solvat derav for anvendelse i oral behandling av *Clostridium difficile*-infeksjoner (CDI) eller *Clostridium difficile*-assosiert diaré eller sykdom (CDAD) hos en pasient ifølge et doseringsregime valgt fra gruppen bestående av:

- i. administrering av 200 mg av tiacumicinforbindelsen BID i 5 dager etterfulgt av 5 dagers hvile og deretter 200 mg én gang daglig i ytterligere 10 dager og
- ii. administrering av 200 mg av tiacumicinforbindelsen BID i 5 dager etterfulgt av én enkelt 200 mg-dose annenhver dag i 20 dager.

9. Den farmasøytiske sammensetningen omfattende tiacumicinforbindelsen for anvendelse ifølge krav 8, **karakterisert ved at** tiacumicinforbindelsen er valgt fra gruppen bestående av tiacumicin A, tiacumicin B og analoger derav, (dialkyltiacumiciner og bromotiacumiciner), tiacumicin C, tiacumicin D, tiacumicin E, tiacumicin F og lipiarmycin.

10. Den farmasøytiske sammensetningen omfattende tiacumicinforbindelsen for anvendelse ifølge hvert av kravene 8-9, **karakterisert ved at** tiacumicinforbindelsen er lipiarmycin eller tiacumicin B eller en stereoisomer derav.

11. Den farmasøytiske sammensetningen omfattende tiacumicinforbindelsen for anvendelse ifølge hvert av kravene 8-10, **karakterisert ved at** tiacumicinforbindelsen er tiacumicin B eller en polymorf derav.

12. Den farmasøytiske sammensetningen omfattende tiacumicinforbindelsen for anvendelse ifølge hvert av kravene 8-11, **karakterisert ved at** tiacumicinforbindelsen er R-tiacumicin B (fidaksomicin).

13. den farmasøytiske sammensetningen omfattende tiacumicinforbindelsen for anvendelse ifølge hvert av kravene 8-12, **karakterisert ved at** sammensetningen er en tablett, en suspensjon, et tørt pulver for en vandig suspensjon, et tørt granulat for en vandig suspensjon, en filmebelagt tablett eller en dispergerbar tablett.

14. Den farmasøytiske sammensetningen omfattende tiacumicinforbindelsen for anvendelse ifølge hvert av kravene 8-13, **karakterisert ved at** sammensetningen er en filmbelagt tablett.