



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 3157510 B1

NORWAY

(19) NO  
(51) Int Cl.  
*A61K 31/4709 (2006.01)*  
*A61K 9/00 (2006.01)*  
*A61K 9/20 (2006.01)*  
*A61K 9/46 (2006.01)*  
*A61K 31/133 (2006.01)*  
*A61P 31/04 (2006.01)*

Norwegian Industrial Property Office

---

|      |                                                                            |                                                                                                                                                                                                   |
|------|----------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| (21) | Translation Published                                                      | 2019.08.05                                                                                                                                                                                        |
| (80) | Date of The European<br>Patent Office Publication of<br>the Granted Patent | 2019.03.27                                                                                                                                                                                        |
| (86) | European Application Nr.                                                   | 15810507.2                                                                                                                                                                                        |
| (86) | European Filing Date                                                       | 2015.06.19                                                                                                                                                                                        |
| (87) | The European Application's<br>Publication Date                             | 2017.04.26                                                                                                                                                                                        |
| (30) | Priority                                                                   | 2014.06.20, US, 201462014786 P                                                                                                                                                                    |
| (84) | Designated Contracting<br>States:                                          | AL ; AT ; BE ; BG ; CH ; CY ; CZ ; DE ; DK ; EE ; ES ; FI ; FR ; GB ; GR ; HR ; HU ;<br>IE ; IS ; IT ; LI ; LT ; LU ; LV ; MC ; MK ; MT ; NL ; NO ; PL ; PT ; RO ; RS ; SE ; SI ;<br>SK ; SM ; TR |
| (73) | Proprietor                                                                 | Melinta Subsidiary Corp., 300 George Street, Suite 301, New Haven, CT 06511,<br>USA                                                                                                               |
| (72) | Inventor                                                                   | LI, Danping, 4 Colonial Court, Middlebury, CT 06762, USA                                                                                                                                          |
| (74) | Agent or Attorney                                                          | PLOUGMANN VINGTOFT, Postboks 1003 Sentrum, 0104 OSLO, Norge                                                                                                                                       |

---

|      |                      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |
|------|----------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| (54) | Title                | <b>ANTIMICROBIAL COMPOSITIONS WITH EFFERVESCENT AGENTS</b>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |
| (56) | References<br>Cited: | CA-A1- 2 824 197, US-A1- 2012 065 186, US-A- 5 223 264, US-A- 5 194 617,<br>US-A1- 2012 149 690, WO-A1-2012/097273, WO-A1-2013/090891, WO-A2-2010/096551,<br>US-B1- 6 350 470, WO-A1-2012/069856, US-A1- 2008 171 203<br>HARRISON, C.: 'A Point-Focusing Camera for Single-Crystal Diffraction.' J. APPL. CRYST.,<br>[Online] vol. 1, no. 2, 1968, pages 84 - 90, XP055245282 Retrieved from the Internet:<br><URL: <a href="http://crystal.med.harvard.edu/lib-sch/HarrisonS-68-AppliedCrys-1-84.pdf">http://crystal.med.harvard.edu/lib-sch/HarrisonS-68-AppliedCrys-1-84.pdf</a> > [retrieved on<br>2015-08-17]<br>Robert E. Lee: "Effervescent tablets", Amerilab Technologies, 2012, pages 1-4, XP055440338,<br>Retrieved from the Internet: URL: <a href="https://www.amerilabtech.com/wp-content/uploads/2012/01/EffervescentTabletsKeyFacts.pdf">https://www.amerilabtech.com/wp-content<br/>t/uploads/2012/01/EffervescentTabletsKeyFacts.pdf</a> [retrieved on 2018-01-12] |

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/>

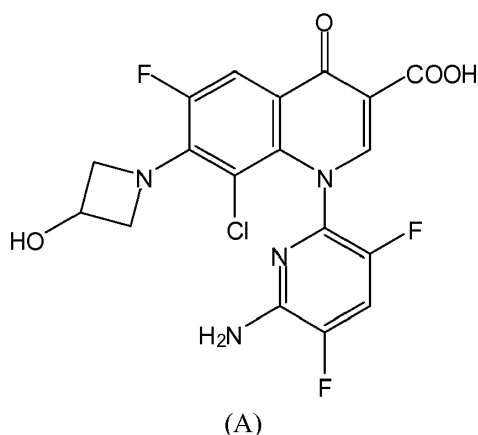
## Patentkrav

**1.** En farmasøytisk sammensetning for anvendelse ved behandling, forebygging eller reduksjon av risikoen for en bakteriell-infeksjon, hvor den farmasøytiske sammensetningen omfatter:

(a) et kinolonkarboksylsyrederivat eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ester derav; og

(b) et brusemiddel;

hvor nevnte kinolonkarboksylsyrederivat tilsvarer til den følgende forbindelsen (A),



eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ester derav; og

hvor nevnte brusemiddel omfatter en blanding av natriumbikarbonat, natrium-dihydrogenfosfat, og sitronsyre.

**2.** Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 1, hvor nevnte kinolonkarboksylsyre derivat er et D-glucitol, 1-deoksy-1-(metylamino)-, 1-(6-amino-3,5-difluor-2-pyridinyl)-8-klor-6-fluor-1,4-dihydro-7-(3-hydroksy-1-azetidiny)-4-okso-3-kinolinkarboksylat.

**3.** Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 2, hvor nevnte kinolonkarboksylsyre derivat er et krystallinsk D-glucitol, 1-deoksy-1-(metylamino)-, 1-(6-amino-3,5-difluor-2-pyridinyl)-8-klor-6-fluor-1,4-dihydro-7-(3-hydroksy-1-azetidiny)-4-okso-3-kinolinkarboksylat **karakterisert ved** et røntgenpulverdiffraksjonsmønster hovedsakelig i samsvar med det vist i FIG. 1, hvor mønsteret er oppnådd fra en kobberstrålingskilde (Cu-K $\alpha$  40 kV, 4 mA).

**4.** Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 3, hvor nevnte krystallinske form er **karakterisert ved** (i) et røntgenpulverdiffraksjonsmønster som har topper ved 6,35; 12,70; 19,10 og 20,50 grader 2 $\theta$ , hvor mønsteret er oppnådd fra en

kobberstrålingskilde (Cu-K $\alpha$ , 40 kV, 4 mA); (ii) et smeltepunkt på 168-171 °C; eller (iii) differensialskanningskalorimeter-termogrammet vist i FIG. 3.

- 5.** Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 2 som ytterligere omfatter en polyhydroksyamin forbindelse.
- 6.** Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 1 som omfatter:
  - (a) fra 100 mg til 750 mg av nevnte kinolonkarboksylsyre derivat, på en syreaktiv basis, hvor nevnte kinolonkarboksylsyre derivat er delafloksacin eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav; og
  - (b) fra 100 mg til 500 mg av nevnte brusemiddel.
- 7.** Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 1 som omfatter:
  - (a) 650 mg av nevnte kinolonkarboksylsyre derivat, hvor nevnte kinolonkarboksylsyre er delafloksacin meglumin; og
  - (b) 150 mg av nevnte brusemiddel.
- 8.** Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7 eller 11 i form av en tablett eller en kapsel.
- 9.** Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 8, hvor tablettene er en enkeltlagstablett eller en dobbeltlagstablett som omfatter et første lag og et andre lag.
- 10.** Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 9, hvor tablettene er en enkeltlagstablett.
- 11.** Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 5, hvor polyhydroksyamin forbindelsen er meglumin.
- 12.** Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 1, hvor den bakterielle infeksjonen er en hudinfeksjon.
- 13.** Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 1, hvor den bakterielle infeksjonen er en komplisert hud- og hudstrukturinfeksjon.
- 14.** Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 1, hvor den bakterielle infeksjonen er en ukomplisert hud- og hudstrukturinfeksjon.

**15.** Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 1, hvor den bakterielle infeksjonen er en meticillinresistent *Staphylococcus aureus* infeksjon.