



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3190115 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

C07D 501/46 (2006.01) A61P 31/04 (2006.01)
A61K 9/19 (2006.01) C07D 227/06 (2006.01)
A61K 31/185 (2006.01) C07D 501/16 (2006.01)
A61K 31/546 (2006.01) C07D 513/04 (2006.01)
A61K 47/02 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.10.25
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.08.25
(86)	European Application Nr.	15838484.2
(86)	European Filing Date	2015.09.03
(87)	The European Application's Publication Date	2017.07.12
(30)	Priority	2014.09.04, JP, 2014179853
(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	Shionogi & Co., Ltd., 1-8, Doshomachi 3-chome Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka 541-0045, Japan
(72)	Inventor	MATSUBARA, Fumihiko, c/o Shionogi & Co. Ltd. 1-1 Futabacho 3-chome, Toyonaka-shi Osaka 561-0825, Japan KURITA, Takanori, c/o Shionogi & Co. Ltd. 1-3 Kuise Terajima 2-chome, Amagasaki-shi Hyogo 660-0813, Japan NAGAMATSU, Daiki, c/o Shionogi & Co. Ltd. 1-1 Futabacho 3-chome, Toyonaka-shi Osaka 561-0825, Japan
(74)	Agent or Attorney	RWS, Europa House, Chiltern Park, Chiltern Hill, SL99FG CHALFONT ST PETER, Storbritannia

(54)	Title	SALT OF CEPHALOSPORIN DERIVATIVE, CRYSTALLINE SOLID FORM OF SAME AND METHOD FOR PRODUCING SAME
------	-------	---

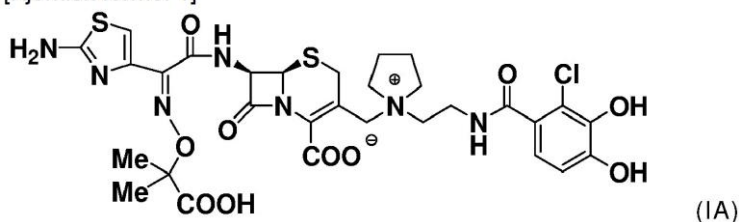
(56)	References	
	Cited:	WO-A1-2014/068388 US-A1- 2011 190 254 WO-A1-2011/125967 WO-A1-2010/050468

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. Syreaddisjonssalt av en forbindelse som betegnes med formelen (IA):

[Kjemisk formel 1]



- 5 eller dets hydrat; forutsatt at syren er 1) en syre som har en substituert eller usubstituert benzensulfonsyregruppe eller 2) en blandet syre som omfatter syren som har en substituert eller usubstituert benzensulfonsyregruppe og en uorganisk syre.
2. Syreaddisjonssalt eller dets hydrat ifølge krav 1, hvor saltet er 1) p-toluensulfonsyresalt, eller 2) et fra en kombinasjon av p-toluensulfonsyre og svovelsyre dannet salt.
- 10 3. Syreaddisjonssalt eller dets hydrat ifølge krav 2, omfattende 1,0 til 2,0 molekvivalenter p-toluensulfonsyre til forbindelsen (IA).
- 15 4. Syreaddisjonssalt eller dets hydrat ifølge krav 2, omfattende 1,0 til 1,8 molekvivalenter p-toluensulfonsyre og 0,1 til 0,5 molekvivalenter svovelsyre til forbindelsen (IA).
- 20 5. Syreaddisjonssalt eller dets hydrat ifølge et hvilket som helst av kravene 2 til 4, som er et krystallinsk fast stoff.
6. Syreaddisjonssalt eller dets hydrat ifølge krav 5, som er et enkeltfasekrystall eller et blandet krystall.
- 25 7. Hydrat ifølge et hvilket som helst av kravene 2 til 6, hvor vanninnholdet er 12 til 17%.
8. Krystallinsk fast stoff av hydratet ifølge et hvilket som helst av kravene 5 til 7, omfattende 20,2 til 23,2% p-toluensulfonsyre på en vannfri basis og 3,5 til 5,0% svovelsyre på en vannfri basis.
- 30 9. Krystallinsk fast stoff av syreaddisjonssaltet eller dets hydrat ifølge et hvilket som helst av kravene 5 til 8, hvor det krystallinske faste stoff har minst tre

diffraksjonstoppvinkler (2θ) valgt blant: $8,2^\circ \pm 0,2^\circ$, $10,1^\circ \pm 0,2^\circ$, $13,0^\circ \pm 0,2^\circ$ og $20,3^\circ \pm 0,2^\circ$ i et røntgenpulverdiffraksjonsspektrum.

10. Krystallinsk fast stoff ifølge et hvilket som helst av kravene 5 til 8, hvor det
5 krystallinske faste stoff har minst tre diffraksjonstoppvinkler (2θ) valgt blant: $8,2^\circ \pm 0,2^\circ$, $8,9^\circ \pm 0,2^\circ$, $10,1^\circ \pm 0,2^\circ$, $11,4^\circ \pm 0,2^\circ$, $13,0^\circ \pm 0,2^\circ$, $19,9^\circ \pm 0,2^\circ$, $20,3^\circ \pm 0,2^\circ$, $21,5^\circ \pm 0,2^\circ$ og $26,2^\circ \pm 0,2^\circ$ i et røntgenpulverdiffraksjonsspektrum.

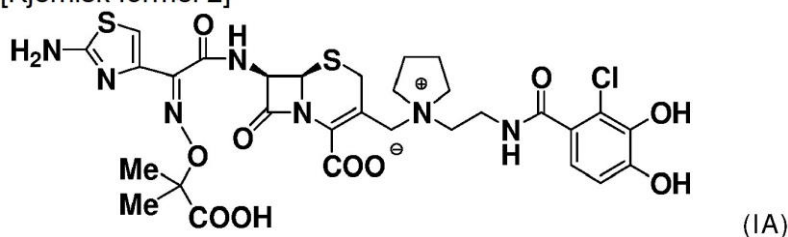
11. Farmasøytisk sammensetning som omfatter syreaddisjonssaltet, dets hydrat eller
10 det krystallinske faste stoff derav ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 10.

12. Fremgangsmåte for fremstilling av det krystallinske faste stoff av
syreaddisjonssaltet eller dets hydrat ifølge et hvilket som helst av kravene 5 til 8,
15 karakterisert ved tilsetning av p-toluensulfonsyre og svovelsyre til en løsning som
inneholder forbindelsen (IA).

13. Fremgangsmåte for fremstilling av det krystallinske faste stoff ifølge krav 12,
karakterisert ved tilsetning av 2,2 til 2,5 vekt-% p-toluensulfonsyremonohydrat og 5 til 6
vekt-% svovelsyre til søyleeluatet som inneholder forbindelsen (IA).

14. Fremgangsmåte for fremstilling av en lyofilisert formulering som omfatter et
natriumsalt av forbindelsen (IA):

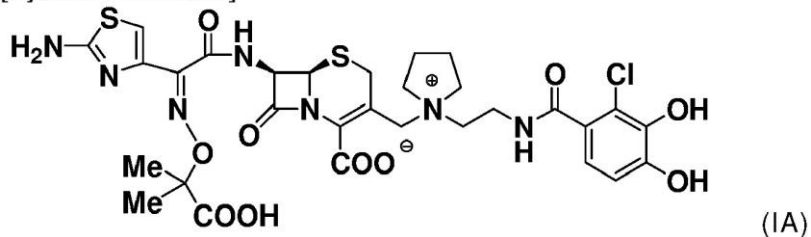
[Kjemisk formel 2]



eller dets hydrat, karakterisert ved å anvende syreaddisjonssaltet, dets hydrat eller det
25 krystallinske faste stoff derav ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 10 som
utgangsmateriale.

15. Farmasøytisk sammensetning som inneholder forbindelsen (IA):

[Kjemisk formel 3]

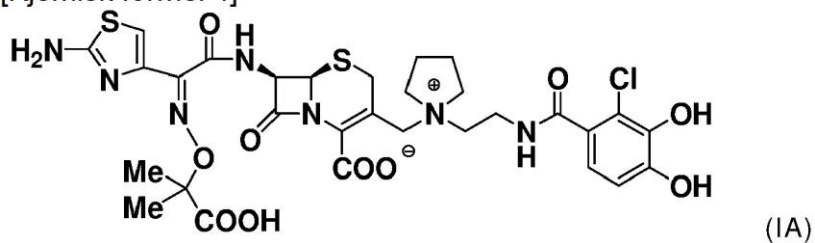


dens farmasøytisk akseptable salt eller et hydrat derav, og videre natrium-p-toluensulfonat og/eller natriumsulfat omfattende syreaddisjonssaltet, dets hydrat eller det krystallinske faste stoff derav ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 10.

5

16. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 15, som inneholder et natriumsalt av forbindelsen (IA):

[Kjemisk formel 4]



eller dets hydrat, og videre natrium-p-toluensulfonat og/eller natriumsulfat.