



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3221308 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 403/14 (2006.01)
A01N 43/60 (2006.01)
A61K 31/506 (2006.01)
A61P 31/10 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21) Translation Published 2019.02.04
(80) Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent 2018.09.19
(86) European Application Nr. 15800925.8
(86) European Filing Date 2015.11.20
(87) The European Application's Publication Date 2017.09.27
(30) Priority 2014.11.21, GB, 201420743
2015.04.07, GB, 201505891
(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
(73) Proprietor F2G Limited, P O Box 1 Lankro Way Eccles, Manchester, Storbritannia
(72) Inventor SIBLEY, Graham Edward Morris, c/o F2G LIMITEDPO Box 1Lankro WayEccles, Manchester M30 0BH, Storbritannia
LAW, Derek, c/o F2G LimitedPO Box 1Lankro WayEccles, Manchester M30 0BH, Storbritannia
OLIVER, Jason David, c/o F2G LimitedPO Box 1Lankro WayEccles, Manchester M30 0BH, Storbritannia
BIRCH, Michael, c/o F2G LimitedPO Box 1Lankro WayEccles, Manchester M30 0BH, Storbritannia
(74) Agent or Attorney ZACCO NORWAY AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

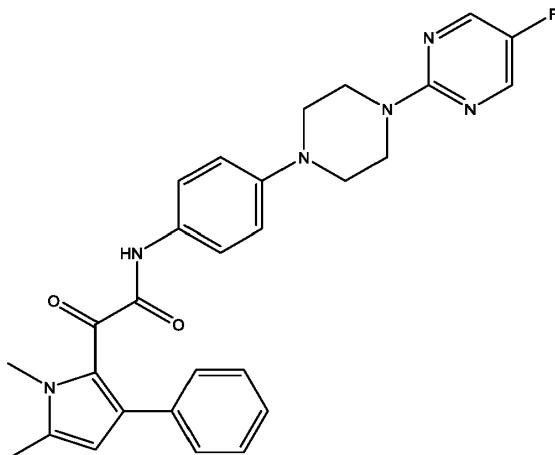
(54) Title **ANTIFUNGAL AGENTS**

(56) References Cited: WO-A1-2008/145963, WO-A1-2006/123145, WO-A1-2009/144473, WO-A1-2009/130481

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. Forbindelse, der forbindelsen er:



2-(1,5-dimethyl-3-fenyl-1H-pyrrol-2-yl)-N-(4-(4-(5-fluorpyrimidin-2-yl)piperazin-1-yl)fenyl)-2-oksoacetamid, eller
5 et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

2. Farmasøytisk sammensetning som omfatter en forbindelse som definert i krav 1 sammen med én eller flere farmasøytisk akseptable bærere og/eller eksipienser.

3. Farmasøytisk kombinasjon som omfatter:

- 10 (i) en forbindelse som definert i krav 1; og
 (ii) et andre soppdrepende middel.

4. Farmasøytisk kombinasjon ifølge krav 3, hvori forbindelsen (i) og det andre soppdrepende midlet (ii) formuleres for separat, samtidig eller påfølgende administrering.

- 15 **5.** Farmasøytisk kombinasjon ifølge krav 3 eller 4, hvori det andre soppdrepende midlet er valgt blant gruppen som består av azoler, polyener, purin-nukleotidinhibitorer, pyrimidin-nukleotidinhibitorer, mannaninhibitorer, proteinforlengelsesfaktorinhibitorer, ekinokandiner, allylaminer, anti-HSP90-antistoffer, bakteriedrepende/permeabilitetsfremkallende proteinprodukter eller
 20 polyoksiner, eller én av forbindelsene 5-fluor-1,3-dihydro-1-hydroksy-2,1-benzoksaboral, 5-klor-1,3-dihydro-1-hydroksy-2,1-benzoksaboral, ikofungipen, VT116 eller SCY078.

- 6.** Farmasøytisk kombinasjon ifølge krav 5, hvori det andre soppdrepende midlet er
(a.i) et azol valgt blant klotrimazol, ekonazol, bifonazol, butokonazol, fentikonazol,
flukonazol, isokonazol, itrakonazol, ketokonazol, mikonazol, oksikonazol,
sertakonazol, sulfonazol, tiokonazol, isavukonazol, ravukonazol, posakonazol,
5 terkonazol og vorikonazol; (a.ii) et ekinokandin valgt blant anidulafungin,
kasprofungin og mikafungin; (a.iii) et allylamin valgt blant terbinafin, butenafin,
amorolfin og naftifin; (a.iv) et polyen valgt blant amfotericin B og nystatin; (a.v) en
purin- eller pyrimidinnukleotidinhibitor som er flucytosin; (a.vi) en mannaninhibitor
som er pradamicin; (a.vii) en proteinforlengelsesfaktorinhibitor valgt blant sordarin
10 og analoger derav; eller (a.viii) et polyoksin som er nikkomycin Z.
- 7.** Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 2 som omfatter (i) en forbindelse som
definert i krav 1, (ii) et andre soppdrepende middel som definert i et hvilket som helst
av kravene 3 til 6, og (iii) én eller flere farmasøytisk akseptable bærere og/eller
eksipenser.
- 15 **8.** Forbindelse ifølge krav 1, en sammensetning ifølge krav 2 eller 7 eller en
kombinasjon ifølge et hvilket som helst av kravene 3 til 6 for anvendelse i en
fremgangsmåte for behandling av menneske- eller dyrekroppen ved behandling.
9. Forbindelse ifølge krav 1, en sammensetning ifølge krav 2 eller 7 eller en
kombinasjon ifølge et hvilket som helst av kravene 3 til 6 for anvendelse ved
20 forebygging eller behandling av soppsykdom.
- 10.** Forbindelse, sammensetning eller en kombinasjon for anvendelse ifølge krav
9, hvori forbindelsen er for anvendelse for å forebygge eller behandle en
soppsykdom ved intravenøs administrering.
- 25 **11.** Forbindelse, sammensetning eller kombinasjon for anvendelse ifølge krav 8
eller krav 9, hvori sykdommen forårsakes av en Aspergillus-art.
- 12.** Forbindelse, sammensetning eller kombinasjon for anvendelse ifølge krav 8
eller krav 9, hvori sykdommen forårsakes av en soppdermatofytt, eller hvori
sykdommen er allergisk bronkopulmonal aspergillose (ABPA) eller astma.
- 30 **13.** Sett som omfatter, i blanding eller i separate beholdere, en forbindelse som
definert i krav 1 og et andre soppdrepende middel som definert i et hvilket som helst
av kravene 3 til 6.

14. Fremgangsmåte for å kontrollere en soppsykdom i en plante, der fremgangsmåten omfatter å påføre til lokuset av planten en forbindelse som er:

2-(1,5-dimetyl-3-fenyl-1H-pyrrol-2-yl)-N-(4-(4-(5-fluorpyrimidin-2-yl)piperazin-1-yl)fenyl)-2-oksoacetamid eller et agrikulturelt akseptabelt salt derav;

5 og eventuelt et andre soppdrepende middel.

15. Anvendelse av en forbindelse, der forbindelsen er:

2-(1,5-dimetyl-3-fenyl-1H-pyrrol-2-yl)-N-(4-(4-(5-fluorpyrimidin-2-yl)piperazin-1-yl)fenyl)-2-oksoacetamid eller et agrikulturelt akseptabelt salt derav;

eventuelt sammen med et andre soppdrepende middel, som et agrikulturelt
10 soppdrepende middel.