



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3247711 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 405/14 (2006.01)
A61K 31/4439 (2006.01)
A61P 31/10 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

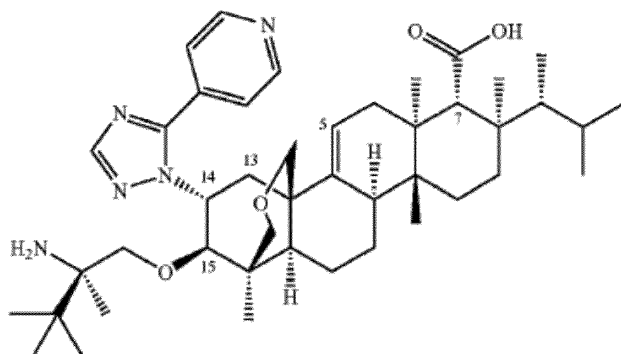
(45)	Translation Published	2022.06.27
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2022.03.09
(86)	European Application Nr.	16703009.7
(86)	European Filing Date	2016.01.14
(87)	The European Application's Publication Date	2017.11.29
(30)	Priority	2015.01.19, WO, PCT/CN15/070967
(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	Scynexis, Inc., Post Office Box 12878, Research Triangle Park, NC 27709-2878, USA
(72)	Inventor	ZHANG, Yi, c/o Crystal Pharmatech Co. Ltd.B4-101 Biobay 218 Xinghu Street Suzhou Industrial Park, Suzhou Jiangsu 215123, Kina
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54)	Title	NOVEL SALTS AND POLYMORPHS OF SCY-078
(56)	References Cited:	WO-A1-2010/019203

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. Sitratsalt av forbindelse 1:



5 2. Sitratsaltet ifølge krav 1, hvori sitratsaltet av forbindelse 1 omfatter

Type A-sitratrikrystallform, hvori Type A-sitratrikrystallformen har et XRPD-mønster omfattende én eller flere topper ved d-avstander på 11,86, 7,70, 7,09, 6,71, 5,90 og 5,29 Å og/eller et XRPD-mønster omfattende én eller flere topper ved grader 2 theta på 7,45, 11,49, 12,49, 13,19, 15,02 og 16,75; eller

10 Type B-sitratrikrystallform, hvori Type B-sitratrikrystallformen har et XRPD-mønster omfattende én eller flere topper ved d-avstander på 15,89, 12,77, 7,54, 5,82, og 5,27 Å og/eller et XRPD-mønster omfattende én eller flere topper ved grader 2 theta på 5,56, 6,92, 11,73, 15,23 og 16,81; eller

15 Type E-sitratrikrystallform, hvori Type E-sitratrikrystallformen har et XRPD-mønster omfattende én eller flere topper ved d-avstander på 12,18, 7,74, 6,27, 5,62 og 5,43 Å og/eller et XRPD-mønster omfattende én eller flere topper ved grader 2 theta på 7,26, 11,44, 14,14, 15,76 og 16,33; eller

20 Type F-sitratrikrystallform, hvori Type F-sitratrikrystallformen har et XRPD-mønster omfattende én eller flere topper ved d-avstander på 24,32 og 5,00 Å og/eller et XRPD-mønster omfattende én eller flere topper ved grader 2 theta på 3,63 og 17,74; eller

Type M-sitratrikrystallform, hvori Type M-sitratrikrystallformen har et XRPD-mønster omfattende én eller flere topper ved d-avstander på 12,04, 7,69, 6,25, 5,61 og 5,41 Å og/eller et XRPD-mønster omfattende én eller flere topper ved grader 2 theta på 7,34, 11,51, 14,17, 15,80 og 16,37; eller

25 Type N-sitratrikrystallform, hvori Type N-sitratrikrystallformen har et XRPD-mønster omfattende én eller flere topper ved d-avstander på 12,51, 7,77, 6,85, 6,27, 5,84, 5,45 og 4,79 Å og/eller et XRPD-mønster omfattende én eller flere topper ved grader 2 theta på 7,07, 11,38, 12,92, 14,13, 15,16, 16,26 og 18,51; eller

Type O-sitratkrystallform, hvori Type O-sitratkrystallformen har et XRPD-mønster omfattende én eller flere topper ved d-avstander på 12,48, 7,43 og 5,29 Å og/eller et XRPD-mønster omfattende én eller flere topper ved grader 2 theta på 7,08, 11,91 og 16,76; eller

5 Type Q-sitratkrystallform, hvori Type Q-sitratkrystallformen har et XRPD-mønster omfattende én eller flere topper ved d-avstander på 14,03, 12,83, 7,81, 7,54 og 5,21 Å og/eller et XRPD-mønster omfattende én eller flere topper ved grader 2 theta på 6,30, 6,89, 11,33, 11,73 og 17,01; eller

10 Type R-sitratkrystallform, hvori Type R-sitratformen har et XRPD-mønster omfattende én eller flere topper ved d-avstander på 14,39, 6,05, 5,40 og 5,00 Å og/eller et XRPD-mønster omfattende én eller flere topper ved grader 2 theta på 6,14, 14,64, 16,41 og 17,74; eller

Type S-sitratkrystallform, hvori Type S-sitratkrystallformen har et XRPD-mønster omfattende én eller flere topper ved d-avstander på 16,03, 12,12, 7,37 og 5,27 Å og/eller et XRPD-mønster omfattende én eller flere topper ved grader 2 theta på 5,51, 7,30, 12,00 og 16,81.

15 **3.** Sitratsaltet ifølge krav 1, hvori sitratsaltet av forbindelse 1 omfatter

Type A-sitratkrystallform, hvori Type A-sitratkrystallformen har et XRPD-mønster omfattende én eller flere topper ved d-avstander på 11,86, 7,70, 7,09, 6,71, 5,90 og 5,29 Å og/eller et XRPD-mønster omfattende én eller flere topper ved grader 2 theta på 7,45, 11,49, 12,49, 13,19, 15,02 og 16,75.

20

4. Sitratsaltet ifølge krav 1, hvori sitratsaltet av forbindelse 1 består hovedsakelig av Type A-sitratkrystallform; eller omfatter minst 98 % Type A-sitratkrystallform; eller omfatter minst 99 % Type A-sitratkrystallform;

25 hvori Type A-sitratkrystallformen har et XRPD-mønster omfattende én eller flere topper ved d-avstander på 11,86, 7,70, 7,09, 6,71, 5,90 og 5,29 Å og/eller et XRPD-mønster omfattende én eller flere topper ved grader 2 theta på 7,45, 11,49, 12,49, 13,19, 15,02 og 16,75.

5. Sitratsaltet ifølge krav 3 eller krav 4, hvori Type A-sitratkrystallformen er stabil i minst 30 1 uke når den lagres ved 60 °C, ved 25 °C og 60 % relativ fuktighet, eller ved 40 °C og 75 % relativ fuktighet;

eller hvori Type A-sitratkrystallformen har en likevektløselighet på 38 mg/ml i ikke-bufret vann ved romtemperatur;

eller hvori Type A-sitratkrystallformen har en omtrentlig løselighet på fra 40 mg/ml til 42 mg/ml ved romtemperatur i minst et løsningsmiddel valgt fra metanol, isopropylalkohol, eddiksyre, tetrahydrofuran, 2-metyl-tetrahydrofuran, 1,4-dioksan, n-metyl-2-pyrrolidon, dimetylsulfoksid og dimetylacetamid;

- 5 eller hvori Type A-sitratkrystallformen har en kinetisk løselighet på minst én av følgende:
4 mg/ml etter 4 timer i dektrosebuffer ved pH 5,5,
8 mg/ml etter 24 timer i dektrosebuffer ved pH 5,5,
5 mg/ml etter 4 timer i fosfatbuffer ved pH 6,0,
8 mg/ml etter 24 timer i fosfatbuffer ved pH 6,0,
10 21 mg/ml etter 1 time i SGF-medium,
4 mg/ml etter 24 timer i FeSSIF-medium,
10 mg/ml etter 1 time i FaSSIF-medium eller
21 mg/ml etter 4 timer i FaSSIF-medium;
eller hvori Type A-sitratkrystallformen har en vannsorpsjon på 6 % ved 25 °C og 80 %
15 relativ fuktighet som bestemt av DVS.

6. Farmasøytisk sammensetning omfattende sitratsaltet ifølge krav 1 og en farmasøytisk akseptabel bærer.

- 20 7. Fremgangsmåte for fremstilling av en farmasøytisk sammensetning for injeksjon, omfattende å løse opp sitratsaltet ifølge krav 1 i en farmasøytisk akseptabel bærer.

8. Fremgangsmåten ifølge krav 7, hvori sitratsaltet løses opp i den farmasøytisk akseptable bæreren innen 24 timer.

- 25 9. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 6 fremstilt ved å løse opp sitratsaltet ifølge krav 1 i en farmasøytisk akseptabel bærer, hvori den farmasøytiske sammensetningen er egnet for injeksjon i et menneske, eller for intravenøs injeksjon i et menneske.

- 30 10. Sitratsaltet ifølge krav 1 for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av en soppinfeksjon hos en pasient med behov derav, omfattende administrering til pasienten av en farmasøytisk sammensetning omfattende en effektiv mengde av sitratsaltet ifølge krav 1.

11. Sitratsaltet ifølge krav 1 for anvendelse ifølge krav 10, hvori den farmasøytiske sammensetningen er egnet for injeksjon i et menneske eller for intravenøs injeksjon i et menneske.