



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3271347 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 401/06 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2022.09.26
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2022.06.22
(86)	European Application Nr.	16765738.6
(86)	European Filing Date	2016.03.17
(87)	The European Application's Publication Date	2018.01.24
(30)	Priority	2015.03.19, US, 201562135682 P
(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	Mycovia Pharmaceuticals, Inc., 4721 Emperor Boulevard Suite 220, Durham 27703, USA
(72)	Inventor	HOEKSTRA, William, J., 7 Treviso Place, Durham, NC 27707, USA WIRTH, David, Dale, 5906 Tarleton Drive, Oak Ridge, NC 27310, USA EHIWE, Tracy, Johnson Matthey Plc. Pharmorphix Fine Chemicals Division 250 Cambridge Science Park Milton Road, Cambridge CB4 0WE, Storbritannia BONNAUD, Thierry, Johnson Matthey Plc. Pharmorphix Fine Chemicals Division 250 Cambridge Science Park Milton Road, Cambridge CB4 0WE, Storbritannia
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54) Title **ANTIFUNGAL COMPOUNDS AND PROCESSES FOR MAKING**

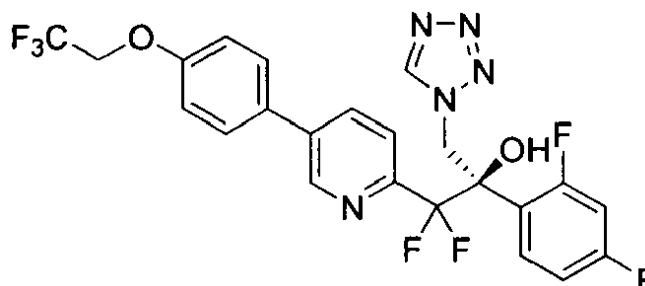
(56) References
Cited:

WO-A1-2007/052943
KR-B1- 101 128 370
WO-A1-2013/110002
WO-A1-2015/143172
WO-A2-2014/009921
WO-A1-2013/109998
GARVEY, E. P. ET AL.: 'VT-1161 dosed once daily or once weekly exhibits po tent efficacy in
treatment of dermatophytosis in a guinea pig model' ANTIMICROBIAL AGENTS AND
CHEMOTHERAPY vol. 59, no. 4, April 2015, pages 1992 - 1997, XP055311835
HOEKSTRA, W. J. ET AL.: 'Design and optimization of highly-selective fungal CYP51 inhibitors'
BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS vol. 24, no. 15, pages 3455 - 3458,
XP028864117

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. Vannfri polymorf av en forbindelse med formel 1,



5 **karakterisert ved:**

- (i) et pulverrøntgendiffraksjonsmønster med topper uttrykt i grader 2-theta $\pm 0,2^\circ$ på 8,4, 11,2, 17,8, 19,1 og 22,3; eller
- (ii) et DSC-termogram som viser en endoterm ved 101-108 °C.

10 **2.** Forbindelse ifølge krav 1, **karakterisert ved** et smeltepunkt på 101-108 °C.

3. Forbindelse ifølge krav 1, som inneholder mindre enn 0,5 % vann.

15 **4.** Fremgangsmåte for fremstilling av den vannfrie polymorfen ifølge krav 1, omfattende å suspendere eller ta en løsning av en forbindelse med formel **1** i et løsningsmiddel og isolere ethvert fast materiale, hvori løsningsmidlet er en løsningsmiddelblanding som omfatter to eller flere løsningsmidler valgt fra et C₃-C₁₀ alkoholløsningsmiddel og et hydrokarbonløsningsmiddel.

20 **5.** Fremgangsmåte ifølge krav 4, hvori forbindelsen suspendert i løsningsmiddelblanding er i én av en amorf, solvat- eller hydratform.

25 **6.** Fremgangsmåte ifølge krav 4, hvori C₃-C₁₀ alkohol løsningsmidlet er *n*-propanol, *i*-propanol, *n*-butanol, *i*-butanol, *s*-butanol og *t*-butanol, eller en blanding derav.

7. Fremgangsmåte ifølge krav 4, hvori C₃-C₁₀ alkohol løsningsmiddel er *n*-propanol, *i*-propanol, *n*-butanol, *i*-butanol, *s*-butanol, eller *t*-butanol.

30 **8.** Fremgangsmåte ifølge krav 4, hvori hydrokarbonløsningsmidlet er *n*-pentan, *n*-heptan eller *n*-heksan, cykloheksan eller metylcykloheksan.

9. Fremgangsmåte ifølge krav 4, hvori ett løsningsmiddel er *i*-propanol og ett løsningsmiddel er *n*-heptan.

5 **10.** Fremgangsmåte ifølge krav 4, hvori det isolerte faste materialet tørkes ved en temperatur på 30°C eller høyere.

11. Vannfri polymorf ifølge krav 1, hvori polymorfen er oppnådd ved fremgangsmåten ifølge hvilket som helst av kravene 4-10.