



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3298006 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 405/06 (2006.01)
A61K 31/496 (2006.01)
A61P 31/10 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2020.05.18
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.01.01
(86)	European Application Nr.	16724958.0
(86)	European Filing Date	2016.05.20
(87)	The European Application's Publication Date	2018.03.28
(30)	Priority	2015.05.21, EP, 15168637
(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	Pulmocide Limited, Covington&Burling LLP 265 Strand, London WC2R 1BH, Storbritannia
(72)	Inventor	COLLEY, Thomas Christopher, c/o Pulmocide LimitedCovington&Burling LLP265 Strand, London WC2R 1BH, Storbritannia ITO, Kazuhiro, c/o Pulmocide LimitedCovington&Burling LLP265 Strand, London WC2R 1BH, Storbritannia STRONG, Peter, c/o Pulmocide LimitedCovington&Burling LLP265 Strand, London WC2R 1BH, Storbritannia SUNOSE, Mihiro, c/o Sygnature Discovery LtdBiocity NottinghamPennyfoot Street, NottinghamNottinghamshire NG1 1GF, Storbritannia McCONVILLE, Matthew, c/o Sygnature Discovery LtdBiocity NottinghamPennyfoot Street, NottinghamNottinghamshire NG1 1GF, Storbritannia
(74)	Agent or Attorney	Budde Schou A/S, Dronningens Tværgade 30, 1302 KØBENHAVN K, Danmark

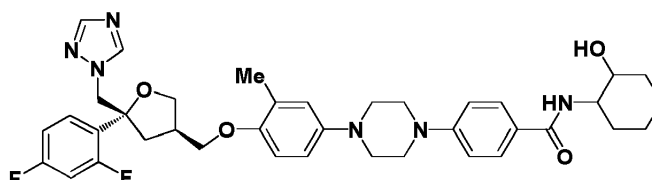
(54) Title **ANTIFUNGAL 4-(4-(4-(((3R,5R)-5-((1 H -1,2,4-TRIAZOL-1-YL)METHYL)-5-(2,4-DIFLUOROPHENYL)TETRAHYDROFURAN-3-YL)METHOXY)-3-METHYLPHENYL)PIPERAZIN-1-YL)-N -(2-HYDROXYCYCLOHEXYL)BENZAMIDE, OR A PHARMACEUTICALLY ACCEPTABLE SALT THEREOF**

(56) References
Cited: EP-A1- 0 957 101
 US-A- 5 039 676
 WO-A1-2013/036866
 WO-A1-95/17407

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 med formel (I):



Forbindelse (I)

som er:

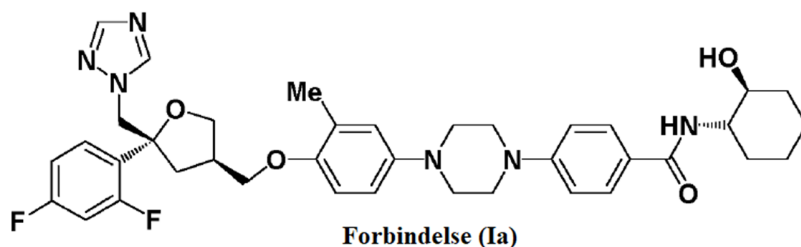
4-(4-(4-(((3*R*,5*R*)-5-((1*H*-1,2,4-triazol-1-yl)metyl)-5-(2,4-difluorfenyl)tetrahydrofuran-3-yl)metoksy)-3-metylfenyl)piperazin-1-yl)-*N*-(2-hydroksysykloheksyl)benzamid
eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

2. Forbindelse ifølge krav 1 i form av en stereoisomer valgt fra forbindelsene (Ia) og (Ib):

	R	Forbindelse
		(Ia)
		(Ib)

eller et farmasøytisk akseptabelt salt ifølge et hvilket som helst derav.

3. Forbindelse ifølge krav 2 som er forbindelse (Ia):



som er:

4-(4-(4-(((3R,5R)-5-((1H-1,2,4-triazol-1-yl)metyl)-5-(2,4-difluorfenyl)tetrahydrofuran-3-yl)metoksy)-3-metylfenyl)piperazin-1-yl)-N-((1S,2S)-2-hydroksysykloheksyl)benzamid, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

4. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3 tilveiebrakt som en enkeltstående stereoisomer.

5. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4 for anvendelse som et legemiddel.

6. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4 for anvendelse ved behandling av mykoser eller for anvendelse ved forebygging eller behandling av sykdom assosiert med mykoser.

7. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 6, hvori mykosen forårsakes av *Aspergillus* spp., så som *Aspergillus fumigatus* eller *Aspergillus flavus*, særlig *Aspergillus fumigatus*.

8. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 6, hvori mykosen forårsakes av *Aureobasidium pullulans*, *Rhizopus oryzae*, *Cryptococcus neoformans*, *Chaetomium globosum*, *Penicillium chrysogenum*, *Fusarium graminearum*, *Cladosporium herbarum*, *Trichophyton rubrum* eller *Candida* spp., f.eks. *Candida albicans*, *Candida glabrata* eller *Candida krusei*.

9. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 6, hvori mykosen er en azolmotstandsdygtig mykose.

10. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4 for anvendelse som et legemiddel i kombinasjon med en andre eller ytterligere aktiv bestanddel.

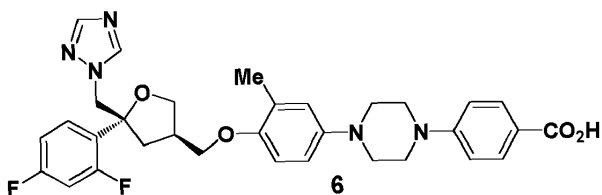
11. Farmasøytisk sammensetning omfattende en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, eventuelt i kombinasjon med ett eller flere farmasøytisk akseptable fortynningsmidler eller bærere.

12. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 11 som omfatter en andre eller ytterligere aktiv bestanddel.

13. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 10 eller en farmasøytisk sammensetning ifølge krav 12, hvori den andre eller ytterligere aktive bestanddelen velges fra anti-soppmidler, som inkluderer azolbaserte anti-soppmidler (så som vorikonazol, posakonazol, itraconazol eller isavuconazol), amfotericin B, et ekinokandin (så som kaspofungin) og en inhibitor av 3-hydroksy-3-metyl-glutaryl-CoA-reduktase (så som lovastatin, pravastatin eller fluvastatin).

14. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 10 eller en farmasøytisk sammensætning ifølge krav 12, hvori den andre eller ytterligere aktive bestanddelen velges fra vorikonazol, posakonazol, itrakonazol og kaspofungin.

15. Fremgangsmåte for fremstilling av forbindelsen ifølge krav 1 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, som omfatter å reagere en forbindelse med formel (6):



eller et salt derav;

med 2-aminosykloheksanol eller et hydroklorsalt derav.