



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3365323 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07C 237/26 (2006.01)
A61L 27/54 (2006.01)
C07C 231/12 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2020.05.04
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.01.01
(86)	European Application Nr.	16805888.1
(86)	European Filing Date	2016.11.24
(87)	The European Application's Publication Date	2018.08.29
(30)	Priority	2015.11.24, PT, 2015108978
(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	Hovione Scientia Limited, Loughbeg, Ringaskiddy, Co.Cork, Irland
(72)	Inventor	SOBRAL, Luis, Av. Diogo cão 24, 7B, 2670-327 Loures, Portugal SANTANA DE ARRUDA, Livia, Rua Bento Lisboa 106Bloco 2, Apt. 1600Catete, Rio de Janeiro, Brasil FIGUEIREDO, Margarida, Rua Marquês de Pombal nº 513º Dto, 2955-209 Pinhal Novo, Portugal ANTUNES, Rafael, Rua Eng. Henrique Cabeçadas 313º Dto, 2900-005 Setubal, Portugal FILIPE, Ana Paula, Rua Cidade da Horta nº61º Esq, 2670-425 Loures, Portugal
(74)	Agent or Attorney	CURO AS, Vestre Rosten 81, 7075 TILLER, Norge

(54)	Title	SALTS OF TETRACYCLINES
(56)	References Cited:	DE-B- 1 045 398 US-A1- 2012 064 372 DE-A1- 1 593 015 FR-E- 92 088 US-A- 2 929 837 BE-A1- 615 425 US-A1- 2009 099 376 SHIGE HARU INOUE ET AL: "Molecular Complexes of Tetracycline Acid Salts", AGRICULTURAL AND BIOLOGICAL CHEMISTRY, vol. 25, no. 4, 1 January 1961 (1961-01-01), pages 333-339, XP055335985, JP ISSN: 0002-1369, DOI: 10.1271/bbb1961.25.333

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. Et tetrasyklinsalt omfattende tetrasyklin og en organisk syre, idet den organiske syre er oksalsyre eller maleinsyre og tetrasyklinet er doxysyklin, minosyklin, sansyklin, lymesyklin eller demeclosyklin.
2. Salt i samsvar med patentkrav 1, idet saltet er doxysyklinmaleat, minosyklinoksalat, demeclosyklinmaleat, demeclosyklinoksalat, sansyklinmaleat, lymesyklinmaleat eller lymesyklinoksalat.
3. Salt i samsvar med patentkrav 1 eller 2, karakterisert ved en pH i vandig løsning lik eller høyere enn 3.
4. Salt i samsvar med et hvilket som helst av patentkravene 1 til 3, karakterisert ved minst én av følgende:
 - (i) at det er litt bittert eller smakløst i vandig løsning på en bitterhets standardskala basert på quinin-hydroklorid;
 - (ii) at det har lavere løselighet i vandig løsning enn den tilsvarende hydrokloridsalt eller hyklatsalt, og
 - (iii) at det har lysere farge i henhold til Munsell klassifikasjon enn et tilsvarende uorganisk salt, spesielt det tilsvarende hydrokloridsalt eller hyklatsalt.
5. Farmasøytisk sammensetning omfattende et tetrasyklinsalt i samsvar med et hvilket som helst av patentkravene 1 til 4 og én eller flere farmasøytisk akseptable bæreremidler.
6. Farmasøytisk sammensetning i samsvar med patentkrav 5, idet sammensetningen er minst én av følgende:
 - en oral-, øye- eller topisk sammensetning,
 - en sammensetning med forsinket eller forlenget frigivelse.
7. Medisinsk anordning med et påført belegg av et salt i samsvar med et hvilket som helst av patentkravene 1 til 4, eller en farmasøytisk sammensetning i samsvar med patentkrav 5 eller 6.
8. Salt i samsvar med et hvilket som helst av patentkravene 1 til 4, eller en farmasøytisk sammensetning i samsvar med patentkrav 5 eller 6 for bruk som et medikament.
9. Et salt for bruk som en farmasøytisk sammensetning for bruk i samsvar med patentkrav 8, til bruk ved behandling eller forhindring av en betennelse og/ eller en infeksjon, eventuelt at infeksjonen og/ eller betennelsen er en infeksjon eller en betennelse av et øye.
10. Et salt for bruk, eller en farmasøytisk sammensetning for bruk i samsvar med patentkrav 9, idet saltet eller sammensetningen er belagt på en medisinsk anordning.
11. Et salt for bruk, eller en farmasøytisk sammensetning for bruk i samsvar med patentkrav 10, eller en medisinsk anordning i samsvar med patentkrav 7, idet den medisinske anordning er et implantat, eventuelt at implantatet er et kateter eller en endoprotease.

12. Fremgangsmåte for å tilberede et tetrasyklinsalt, hvilken fremgangsmåte omfatter å reagere en tetrasyklinbase med et overskudd av organisk syre i et løsningsmiddel, idet tetrasyklinsaltet er i samsvar med et hvilket som helst av patentkravene 1 til 4 og idet den organiske syre eventuelt er oksalsyre eller maleinsyre.
- 5 13. Fremgangsmåte i samsvar med patentkrav 12, idet overskuddet av den organiske syre er: (i) mer enn én molarekvivalent i forhold til tetrasyklinet eller (ii) 5 eller flere molarekvivalenter i forhold til tetrasyklinet.
14. Fremgangsmåte i samsvar med patentkrav 12 eller 13, idet løsningsmidlet er ett av følgende:
- 10 - en alkohol eller en blanding av alkohol med et amid-løsningsmiddel;
- metanol eller en blanding av metanol og dimetylformamid.
15. Fremgangsmåte i samsvar med et hvilket som helst av patentkravene 12 til 14, idet tetrasyklinbasen er fullstendig oppløst i løsningsmidlet forut for krystallisasjon av saltet.