



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3468957 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 261/08 (2006.01)
A61K 31/42 (2006.01)
A61P 31/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2020.11.09
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.08.26
(86)	European Application Nr.	17739696.7
(86)	European Filing Date	2017.06.12
(87)	The European Application's Publication Date	2019.04.17
(30)	Priority	2016.06.14, WO, PCT/CN16/085694
(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
	Designated Extension States:	BA ; ME
	Designated Validation States:	MA; MD
(73)	Proprietor	NOVARTIS AG, Lichtstrasse 35, 4056 Basel, Sveits
(72)	Inventor	FU, Jiping, Novartis Institutes for BioMedical Research Inc.5300 Chiron Way, Emeryville, California 94608, USA JIANG, Siyi, Beijing Novartis Pharma Co. Ltd.4218 Jinke RoadZhangjiang Hi-Tech Park, Shanghai 201203, Kina KORDIKOWSKI, Andreas, Novartis Pharma AGPostfach, CH-4002 Basel, Sveits SWEENEY, Zachary Kevin, 143 King Street, Redwood City, California 94602, USA
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

(54)	Title	CRYSTALLINE FORM OF (R)-4-(5-(CYCLOPROPYLETHYNYL)ISOXAZOL-3-YL)-N-HYDROXY-2-METHYL-2-(METHYLSULFONYL)BUTANAMIDE AS AN ANTIBACTERIAL AGENT
(56)	References Cited:	WO-A1-2015/164458 WO-A1-2016/097995

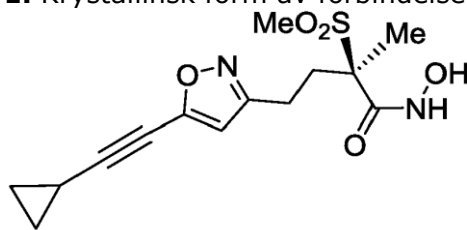
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters 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/>

[EP3468957]

1

Patentkrav

1. Krystallinsk form av forbindelsen ifølge formel (A):



(A).

2. Den krystallinske formen ifølge krav 1, som har lav hygroskopisitet, og som utviser en vektøkning på mindre enn 5 % når en tørr prøve utsettes for relativ fuktighet opptil 80 %.

3. Den krystallinske formen ifølge krav 1, som omfatter stavformede krystaller.

4. Den krystallinske formen ifølge krav 1, som utviser en endoterm ved differensialskanningskalometri mellom 75 °C og 90 °C.

5. Den krystallinske formen ifølge krav 1, **karakterisert ved** XRPD-topper ved diffraksjonsvinkler (2 Theta) på 18,4 og 14,0 grader.

6. Den krystallinske formen ifølge krav 5, ytterligere **karakterisert ved** én eller flere ytterligere XRPD-topper ved diffraksjonsvinkler (2 Theta) på 3,9 og 2,5 og 4,4 grader.

7. Den krystallinske formen ifølge hvilket som helst av kravene 5-6, ytterligere **karakterisert ved** én eller flere ytterligere XRPD-topper ved diffraksjonsvinkler (2 Theta) på 18,8 og/eller 5,3 grader og/eller 21,8 grader og/eller 22,1 grader og/eller 18,0 grader.

[EP3468957]

2

8. Den krystallinske formen ifølge et hvilket som helst av kravene 5-7, ytterligere **karakterisert ved** ytterligere XRPD-topper ved diffraksjonsvinkler (2 Theta) på 18,8 og 5,3 grader.

5 **9.** Den krystallinske formen ifølge krav 8, ytterligere **karakterisert ved** ytterligere XRPD-topper ved diffraksjonsvinkler (2 Theta) på 21,8 og 22,1 grader.

10 **10.** Farmasøytisk sammensetning, omfattende:
en antibakteriell effektiv mengde av den krystallinske formen ifølge hvilke som
helst av kravene 1-9,
og en farmasøytisk akseptabel bærer.

15 **11.** Farmasøytisk kombinasjon, omfattende:
en antibakteriell effektiv mengde av den krystallinske formen ifølge hvilke som
helst av kravene 1-9,
en antibakteriell effektiv mengde av et andre terapeutisk middel, og
en farmasøytisk akseptabel bærer.

20 **12.** Den farmasøytiske kombinasjonen ifølge krav 11, hvori det andre terapeutiske
middelet er valgt fra gruppen bestående av ampicillin, piperacillin, penicillin G,
ticarcillin, imipenem, meropenem, azitromycin, erytromycin, aztreonam, cefepim,
cefotaksim, ceftriaxon, ceftazidim, ciprofloksacin, levofloksacin, clindamycin,
doksycyclin, gentamycin, amikacin, tobramycin, tetracyclin, tigecyclin, rifampicin,
vancomycin og polymyxin.

25 **13.** Fremgangsmåte for å danne høykrystallinsk forbindelse (A) ifølge krav 1, av
ikke-krystallinsk forbindelse (A), som omfatter å oppløse ikke-krystallinsk
forbindelse (A) i et halogenert organisk løsemiddel for å danne en oppløsning, og
å bringe oppløsningen i kontakt med et hydrokarbonløsemiddel for å indusere
30 utfelling av krystallinsk forbindelse (A).

[EP3468957]

14. Den farmasøytiske kombinasjonen ifølge hvilke som helst av kravene 1-9 for anvendelse i behandling av en Gram-negativ bakteriell infeksjon hos et individ med behov for dette