



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2658846 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 249/12 (2006.01)
A61K 31/4196 (2006.01)
A61K 31/426 (2006.01)
A61K 31/522 (2006.01)
A61P 9/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

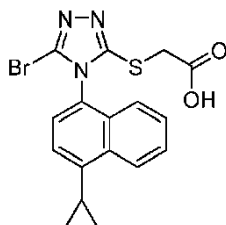
(21)	Translation Published	2017.04.03
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2016.12.14
(86)	European Application Nr.	11853861.0
(86)	European Filing Date	2011.12.28
(87)	The European Application's Publication Date	2013.11.06
(30)	Priority	2010.12.30, US, 201061428660 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
	Designated Extension States:	BA ME
(73)	Proprietor	Ardea Biosciences, Inc., 4939 Directors Place, San Diego, CA 92121, US-USA
(72)	Inventor	GALVIN, Gabriel, 13257 Via Santillana, San Diego, CA 92129, US-USA TREIBER, Laszlo, R., 16230 Nacido Court, San Diego, CA 92128, US-USA ZAMANSKY, Irina, 2539 Ivy Road, Oceanside, CA 92054, US-USA GIRARDET, Jean-Luc, 16763 Santa Corina Court, San Diego, CA 92127, US-USA
(74)	Agent or Attorney	Tandbergs Patentkontor AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

(54)	Title	POLYMORPHIC FORMS OF 2-(5-BROMO-4-(4-CYCLOPROPYLNAPHTHALEN-1-YL)-4H-1,2,4-TRIAZOL-3-YLTHIO) ACETIC ACID AND USES THEREOF
(56)	References Cited:	WO-A2-2009/070740 WO-A2-2011/085009 US-A1- 2009 197 825 US-A1- 2010 056 464 CAIRA M R: "CRYSTALLINE POLYMORPHISM OF ORGANIC COMPOUNDS", TOPICS IN CURRENT CHEMISTRY, SPRINGER, BERLIN, DE, vol. 198, 1 January 1998 (1998-01-01), pages 163-208, XP001156954, ISSN: 0340-1022, DOI: 10.1007/3-540-69178-2_5

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. En krystallinsk polymorf form 2 av 2-(5-brom-4-(4-syklopropylnaftalen-1-yl)-4H-1,2,4-triazol-3-yltio)eddiksyre:



a) **karakterisert ved** topper ved 10,46, 18,76, og 19,83 °2θ ± 0,1 °2θ;

b) **karakterisert ved** topper ved 10,46, 18,76, og 19,83 °2θ ± 0,1 °2θ, ytterligere **karakterisert ved** minst én ytterligere topp ved 18,21 eller 23,08 °2θ ± 0,1 °2θ; eller

c) som oppviser et røntgenpulver diffraksjonsmønster som vist i figur 5.

2. En krystallinsk polymorf ifølge krav 1, fremstilt ved en fremgangsmåte som omfatter trinnet med krystallisering av 2-(5-brom-4-(4-syklopropylnaftalen-1-yl)-4H-1,2,4-triazol-3-yltio)eddiksyre fra en blanding av vann og etylacetat.

3. En fast farmasøytisk sammensetning som omfatter:

en effektiv mengde av den krystallinske polymorfen ifølge krav 1 eller krav 2, som en aktiv ingrediens; og
minst én eksipiens eller bærer.

4. Den krystallinske polymorfen ifølge krav 1 eller krav 2, for anvendelse ved behandling eller forebygging av hyperurikemi, eller en sykdom forårsaket av forhøyede urinsyre nivåer.

5. Den krystallinske polymorfen ifølge krav 1 eller krav 2, for anvendelse ved behandling eller forebygging av urinsyre gikt.

6. En fremgangsmåte for fremstillingen av en krystallinsk polymorf av 2-(5-brom-4-(4-syklopropylnaftalen-1-yl)-4H-1,2,4-triazol-3-yltio)eddiksyre, fremgangsmåten omfatter:

løsning av natrium 2-(5-brom-4-(4-syklopropyl-naftalen-1-yl)-4*H*-1,2,4-triazol-3-yltio)acetat i vann som resulterer i en løsning;

tilsetning av en mineralsyre;

tilsetning av etylacetat;

5 separering av et organisk sjikt;

presipitering av den krystallinske polymorfen fra det organiske sjiktet;

hvor den krystallinske polymorfen er **karakterisert ved** topper ved 10,46, 18,76, og 19,83 °2θ ± 0,1 °2θ.

10

7. Fremgangsmåten ifølge krav 6, hvor fremgangsmåten er **karakterisert ved** én eller flere av det følgende:

mineralsyren omfatter hydrobromsyre;

15

mineralsyren tilsettes ved 1.05 ekvivalenter;

volumet av det organiske sjiktet er redusert for å presipitere den krystallinske polymorfen;

det organiske sjiktet er avkjølt for å presipitere den krystallinske polymorfen;

den krystallinske polymorfen er filtrert og vasket; og/eller

20

den krystallinske polymorfen er ytterligere **karakterisert ved** minst én ytterligere topp ved 18,21 eller 23,08 °2θ ± 0,1 °2θ.