



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2751094 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 401/12 (2006.01)
A61K 31/4545 (2006.01)
A61P 25/28 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2018.10.22
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.06.20
(86)	European Application Nr.	12756693.3
(86)	European Filing Date	2012.08.31
(87)	The European Application's Publication Date	2014.07.09
(30)	Priority	2011.09.01, US, 201161530104 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	Glaxo Group Limited, 980 Great West Road, Brentford, Middlesex TW8 9GS, Storbritannia
(72)	Inventor	LEE, Mei-yin, GlaxoSmithKlineGunnels Wood Road, StevenageHertfordshire SG1 2NY, Storbritannia
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

(54)	Title	NOVEL CRYSTAL FORM
(56)	References Cited:	WO-A1-02/30904

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. Krystallinsk rilapladib **karakterisert ved** én eller flere av følgende egenskaper:

a) et røntgenpulverdiffraksjonsmønster omfattende diffraksjonsvinkler (2 theta)

minst i posisjon 6,2, 7,6, 9,1, 11,2 og 14,3, hver $\pm 0,1$ grader; eller

b) et Raman-spektrum omfattende topper minst ved posisjon 103, 276, 752, 1155, 1336, 1623 og 3075, hver $\pm 1 \text{ cm}^{-1}$; eller

(c) et smeltepunkt fra 165 °C til 185 °C; eller

d) et ATR-IR-absorpsjonsspektrum omfattende topper minst ved bølgelengdenummer 2931, 1652, 1621, 1595, 1528, 1494, 1478 1423, 1403, 1327, 1317, 1286, 1237, 1204, 1187, 1166, 1140, 1109, 1066, 1024, 992, 969, 932, 865, 859, 813, 795, 767, 751, 708 og 693, hver ± 1 bølgenummer.

2. Krystallinsk rilapladib ifølge krav 1, som er **karakterisert ved** røntgenpulverdiffraksjonsmønsteret som definert i krav 1.

3. Krystallinsk rilapladib ifølge krav 2, ytterligere **karakterisert ved** minst én egenskap valgt fra Raman-spekteret, smeltepunktet og ATR-IR-absorpsjonsspekteret som definert i krav 1.

4. Krystallinske rilapladib ifølge krav 2 eller krav 3, hvori røntgenpulverdiffraksjonsmønsteret ytterligere omfatter diffraksjonsvinkler (2 theta) minst ved posisjon 11,7, 12,4, 13,1, 14,0, 14,9, 15,3, 16,5, 16,8, 17,5, 17,8, 18,5, 18,9, 19,3, 20,0, 20,6, 21,1 and 22,1, hver $\pm 0,1$ grader.

5. Krystallinske rilapladib ifølge hvilke som helst av kravene 1, 3 eller 4, hvori Raman-spekteret ytterligere omfatter topper minst ved posisjonene 159, 186, 519, 524, 613, 628, 694, 736, 766, 776, 808, 820, 1038, 1179, 1288, 1467, 1528, 1576, 1611, 2933 og 2952, hver $\pm 1 \text{ cm}^{-1}$.

6. Krystallinsk rilapladib ifølge krav 1, som er **karakterisert ved** røntgenpulverdiffraksjonsmønsteret som definert i krav 1 eller krav 5.

7. Krystallinsk rilapladib ifølge krav 1, som er **karakterisert ved** smeltepunktet som definert i krav 1.

8. Krystallinsk rilapladib ifølge krav 1, som er **karakterisert ved** ATR-IR-absorbsjonsspekteret som definert i krav 1.

5 **9.** Krystallinsk rilapladib ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8, hvori den krystallinske rilapladiben er minst 90 % ren etter vekt.

10. Krystallinsk rilapladib ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8, hvori den krystallinske rilapladiben er minst 95 % ren etter vekt.

10 **11.** Krystallinsk rilapladib ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8, hvori den krystallinske rilapladiben er minst 97 % ren etter vekt.

12. Krystallinsk rilapladib ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8, hvori den krystallinske rilapladiben er minst 99 % ren etter vekt.

15

13. Farmasøytisk sammensetning omfattende krystallinsk rilapladib ifølge et hvilket som helst av kravene 1-12 og en farmasøytisk akseptabel bærer.

20 **14.** Krystallinsk rilapladib ifølge et hvilket som helst av kravene 1-12 for anvendelse i terapi.

15. Krystallinsk rilapladib ifølge et hvilket som helst av kravene 1-12 for behandling av en Lp-PLA₂-mediert sykdom eller lidelse.

25 **16.** Krystallinsk rilapladib ifølge et hvilket som helst av kravene 1-12 for behandling av Alzheimers sykdom.

17. Krystallinsk rilapladib ifølge et hvilket som helst av kravene 1-12 for behandling av vaskulær demens.