



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 2872488 B1

NORWAY

(19) NO  
(51) Int Cl.  
**C07D 217/26 (2006.01)**  
**A61K 31/47 (2006.01)**

**Norwegian Industrial Property Office**

---

- (21) Translation Published 2018.11.26
- (80) Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent 2018.08.22
- (86) European Application Nr. 13740185.7
- (86) European Filing Date 2013.07.15
- (87) The European Application's Publication Date 2015.05.20
- (30) Priority 2012.07.16, US, 201261672191 P  
2013.02.22, US, 201361768297 P  
2013.06.07, US, 201361832566 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 Fibrogen, Inc., 409 Illinois Street, San Francisco, CA 94158, USA
- (72) Inventor WITSCHI, Claudia, c/o FibroGen, Inc.409 Illinois St., San Francisco, California 94158, USA  
PARK, Jung Min, c/o FibroGen, Inc.409 Illinois St., San Francisco, California 94158, USA  
THOMPSON, Michael, D., c/o FibroGen, Inc.409 Illinois St., San Francisco, California 94158, USA  
MARTINELLI, Michael, John, c/o FibroGen, Inc.409 Illinois St., San Francisco, California 94158, USA  
YEOWELL, David, A., c/o FibroGen, Inc.409 Illinois St., San Francisco, California 94158, USA  
AREND, Michael, P., c/o FibroGen, Inc.409 Illinois St., San Francisco, California 94158, USA
- (74) Agent or Attorney OSLO PATENTKONTOR AS, Postboks 7007 M, 0306 OSLO, Norge
- 
- (54) Title **CRYSTALLINE FORMS OF A PROLYL HYDROXYLASE INHIBITOR**
- (56) References Cited: US-A1- 2004 254 215, WO-A1-2013/013609

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 [(4-hydroksy-1-metyl-7-fenoksy-isoquinolin-3-karbonyl)-amino]-eddiksyre (Forbindelse A Form A), **karakterisert ved** et røntgenstråle pulver-diffraktogram omfattende de følgende topper: 8,5, 12,8, 16,2, 21,6, 22,9 og 27,4 °2θ ± 0,2 °2θ når målt ved å anvende Cu Kα-stråling.  
5
2. Forbindelse A Form A ifølge krav 1, hvor diffraktogrammet er i hovedsak som vist i Figur 1.
3. Forbindelse A Form A ifølge krav 1, **karakterisert ved** en differensial skanning kalorimetri-kurve (DSC) som omfatter en endoterm ved omkring 223 °C.
- 10 4. Forbindelse A Form A ifølge krav 3, hvor DSC-kurven er i hovedsak som vist i Figur 2.
5. Farmasøytisk sammensetning omfattende Forbindelse A Form A ifølge krav 1 samt en farmasøytisk akseptabel eksipient.
6. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 5, hvor minst omkring 85%, minst 15 omkring 90%, minst omkring 95%, minst omkring 99%, minst omkring 99,5%, minst omkring 99,9% eller minst omkring 99,99% av Forbindelse A i sammensetningen er i Form A.
7. Forbindelse A Form A ifølge krav 1, for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling, forbehandling eller forsinkelse av inntreden eller progresjon av en 20 tilstand mediert minst delvis av hypoksia-induserbar faktor (HIF).
8. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 7, hvor tilstanden mediert i det minste delvis av HIF er vevsskade assosiert med ischemi eller hypoksia.
9. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 8, hvor ischemien er assosiert med en akutt hendelse valgt fra gruppen bestående av myokardialt infarkt, pulmonar 25 emboli, intestinalt infarkt, kronisk nyresvikt, ischemisk slag og renal ischemisk-reperfusjonsskade.
10. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 8, hvor ischemien er assosiert med en kronisk hendelse valgt fra gruppen bestående av hjerte-cirrhose, transient

ischemisk angrep, makular-nedbrytning, perifer arteriesykdom og kongestiv hjertesvikt.

**11.** Forbindelse A Form A ifølge krav 1, for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling, forbehandling eller forsinkelse av angrep eller progresjon av en tilstand  
5 mediert i det minste delvis av erythropoietin (EPO).

**12.** Forbindelse A Form A ifølge krav 1, for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling, forbehandling eller forsinkelse av angrep eller progresjon av anemi.

**13.** Forbindelse for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 7 til 12, hvor:  
10 minst omkring 85%, minst omkring 90%, minst omkring 95%, minst omkring 99%, minst omkring 99,5%, minst omkring 99,9% eller minst omkring 99,99% av forbindelsen anvendt i fremgangsmåten er Forbindelse A Form A.