



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3094637 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/675 (2006.01)
C07F 9/6561 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

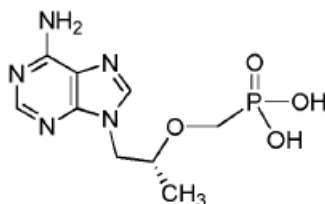
(21)	Translation Published	2020.01.27
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.10.16
(86)	European Application Nr.	15701877.1
(86)	European Filing Date	2015.01.09
(87)	The European Application's Publication Date	2016.11.23
(30)	Priority	2014.01.15, US, 201461927617 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	Gilead Sciences, Inc., 333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, USA
(72)	Inventor	HURLEY, Paul, Bernard, c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, USA LAPINA, Olga, Viktorovna, c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, USA SHI, Bing, c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, USA WANG, Fang, c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, USA WANG, Zhi, Xian, c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, USA WOO, Jacqueline, Ching-see, c/o Gilead Sciences Inc., Foster City, CA 94404, USA
(74)	Agent or Attorney	OSLO PATENTKONTOR AS, Hoffsvæien 1A, 0275 OSLO, Norge

(54)	Title	SOLID FORMS OF TENOFOVIR
(56)	References Cited:	US-A- 5 977 089

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/>

Krav

1. Krystallform, form VI, av en forbindelse:



- 5 som er **karakterisert ved** et røntgenpulverdiffraksjon (XRPD) -mønster omfattende topper uttrykt i grader ($\pm 0,2$ grad) av to theta-vinkler på 6,0, 12,0, 24,0, 24,5 og 37,6 oppnådd ved anvendelse av $\text{CuK}\alpha_1$ røntgenstråle (bølgelengde = 1,5406 Ångstrøm).
2. Krystallform ifølge krav 1, som har en XRPD hovedsakelig som vist i figur 3.
- 10 3. Krystallform ifølge krav 1, som har en XRPD hovedsakelig som vist i tabell 2.
4. Sammensetning omfattende krystallform, form VI, ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, og videre omfattende form I, hvor form I er **karakterisert ved**
- 15 et røntgenpulverdiffraksjon (XRPD) -mønster omfattende topper uttrykt i grader ($\pm 0,2$ grad) med to theta-vinkler på 7,5, 15,0, 22,5 og 24,8 oppnådd ved anvendelse av $\text{CuK}\alpha_1$ røntgenstråle (bølgelengde = 1,5406 Ångstrøm).
5. Sammensetning omfattende krystallform, form VI, ifølge et hvilket som helst
- 20 av kravene 1 til 3, og videre omfattende form IV, hvor form IV er **karakterisert ved** et røntgenpulverdiffraksjon (XRPD) -mønster omfattende topper uttrykt i grader ($\pm 0,2$ grad) med to theta-vinkler på 6,2, 12,4, 18,6, 24,9 og 37,7 oppnådd ved anvendelse av $\text{CuK}\alpha_1$ røntgenstråle (bølgelengde = 1,5406 Ångstrøm).
- 25 6. Sammensetning omfattende krystallform, form VI, ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, og videre omfattende form IX, hvor form IX er **karakterisert ved** et røntgenpulverdiffraksjon (XRPD) -mønster omfattende topper uttrykt i grader ($\pm 0,2$ grad) med to theta-vinkler på 5,9, 11,3, 16,5, 21,5, 26,1 og 26,8 oppnådd ved anvendelse av $\text{CuK}\alpha_1$ røntgenstråle (bølgelengde = 1,5406 Ångstrøm).
- 30 7. Fremgangsmåte for fremstilling av tenofovirdisoproksil (TD), omfattende omdannelse av krystallformen ifølge et av kravene 1 til 3 til TD.

8. Fremgangsmåte ifølge krav 7, videre omfattende trinnet å kontakte TD med fumarsyre for å danne tenofovirdisoproksilfumarat (TDF).
9. Fremgangsmåte for fremstilling av tenofovir alafenamid (TAF), omfattende
5 omdannelse av krystallformen ifølge et av kravene 1 til 3 til TAF.
10. Farmasøytisk sammensetning som omfatter krystallformen ifølge et hvilket
som helst av kravene 1 til 3, som eventuelt videre omfatter en farmasøytisk
akseptabel bærer eller eksipiens.
- 10
11. Krystallform ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3 for anvendelse i en
fremgangsmåte for å behandle eller forhindre en virusinfeksjon.
12. Krystallform for anvendelse ifølge krav 11, hvor virusinfeksjonen er humant
15 immunsviktvirus (HIV).
13. Krystallform for anvendelse ifølge krav 11, hvori virusinfeksjonen er hepatitt
B-virus (HBV).