



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3231801 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 403/14 (2006.01)
A61K 31/4155 (2006.01)
A61P 29/00 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)
A61P 37/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2019.07.01
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.02.13
(86)	European Application Nr.	17158350.3
(86)	European Filing Date	2014.05.16
(87)	The European Application's Publication Date	2017.10.18
(30)	Priority	2013.05.17, US, 201361824683 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
(62)	Divided application	EP2997023, 2014.05.16
(73)	Proprietor	Incyte Corporation, 1801 Augustine Cut-Off, Wilmington, DE 19803, USA
(72)	Inventor	LI, Yun-Long, 1 Pin Oak Drive, Chadds Ford, PA Pennsylvania 19317, USA ZHUO, Jincong, 17 Forwood Drive, Garnet Valley, PA Pennsylvania 19060, USA QIAN, Ding-Quan, 10 Donald Preston Drive, Newark, DE Delaware 19702, USA MEI, Song, 151 Monet Circle, Wilmington, DE Delaware 19808, USA CAO, Ganfeng, 10 Shadow Lane, Chadds Ford, PA Pennsylvania 19317, USA PAN, Yongchun, 11 Emsley Drive, Wilmington, DE Delaware 19810, USA LI, Qun, 10 Crompton Court, Newark, DE Delaware 19702, USA JIA, Zhongjiang, 516 Silver Fox Road, Kennett Square, PA Pennsylvania 19348, USA
(74)	Agent or Attorney	OSLO PATENTKONTOR AS, Postboks 7007 M, 0306 OSLO, Norge

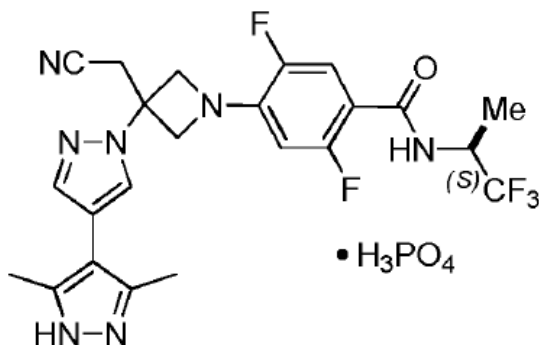
(54) Title **BIPYRAZOLE SALT AS JAK INHIBITOR**

(56) References
Cited: WO-A1-2012/177606

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. Salt som er 4-[3-(cyanometyl)-3-(3',5'-dimetyl-1H,1'H-4,4'-bipyrazol-1-yl)azetidin-1-yl]-2,5-difluor-N-[(1S)-2,2,2-trifluor-1-metyletyl]benzamid-fosfat (Forbindelse 1-fosfat) med formelen:



5

2. Salt ifølge krav 1 som har et støkiometrisk forhold på 1:1 mellom 4-[3-(cyanometyl)-3-(3',5'-dimetyl-1H, 1'H-4,4'-bipyrazol-1-yl)azetidin-1-yl]-2,5-difluor-N-[(1S)-2,2,2-trifluor-1-metyletyl]benzamid (Forbindelse 1) og fosforsyre.
3. Salt ifølge krav 1 eller 2 som er isolert.
4. Fast form av salt ifølge krav 1-3, hvor den faste form er krystallinsk.
5. Fast form ifølge krav 4 som har en XRPD-topp, i form av 2-theta, ved $6,8 \pm 0,2$ grader.
6. Fast form ifølge krav 4 som har minst en XRPD-topp, i form av 2-theta, valgt fra $6,8 \pm 0,2$; $16,5 \pm 0,2$; $20,7 \pm 0,2$ og $23,6 \pm 0,2$ grader.
7. Fast form ifølge krav 4 som har minst to XRPD-topper, i form av 2-theta, valgt fra $6,8 \pm 0,2$; $16,5 \pm 0,2$; $20,7 \pm 0,2$ og $23,6 \pm 0,2$ grader.
8. Fast form ifølge krav 4 som har minst tre XRPD-topper, i form av 2-theta, valgt fra $6,8 \pm 0,2$; $16,5 \pm 0,2$; $20,7 \pm 0,2$ og $23,6 \pm 0,2$ grader.
9. Fast form ifølge et hvilket som helst av kravene 5-8 som videre har minst en XRPD-topp, i form av 2-theta, valgt fra $11,7 \pm 0,2$; $13,5 \pm 0,2$; $15,9 \pm 0,2$; $18,4 \pm 0,2$ og $19,8 \pm 0,2$ grader.

25

10. Fast form ifølge et hvilket som helst av kravene 5-8 som videre har minst to XRPD-topper, i form av 2-theta, valgt fra $11,7 \pm 0,2$; $13,5 \pm 0,2$; $15,9 \pm 0,2$; $18,4 \pm 0,2$ og $19,8 \pm 0,2$ grader.
- 5 11. Fast form ifølge et hvilket som helst av kravene 5-8 som videre har minst fire XRPD-topper, i form av 2-theta, valgt fra $11,7 \pm 0,2$; $13,5 \pm 0,2$; $15,9 \pm 0,2$; $18,4 \pm 0,2$ og $19,8 \pm 0,2$ grader.
- 10 12. Fast form ifølge et hvilket som helst av kravene 5-8 som videre har minst tre XRPD-topper, i form av 2-theta, valgt fra $11,7 \pm 0,2$; $13,5 \pm 0,2$; $15,9 \pm 0,2$; $18,4 \pm 0,2$ og $19,8 \pm 0,2$ grader.
- 15 13. Fast form ifølge et hvilket som helst av kravene 4-12 som har et XRPD-mønster som vist i figur 4C.
14. Fast form ifølge krav 4, karakterisert ved et DSC-termogram med en endoterm hendelse ved 228 ± 3 °C.
- 20 15. Fast form ifølge krav 14, hvor den endoterme hendelsen er satt ved 224 ± 3 °C.
16. Fast form ifølge krav 4 som har et DSC-termogram som vist i figur 4A.
17. Fast form ifølge krav 4 som har et TGA-termogram som vist i figur 4B.