



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3279202 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

C07D 487/04 (2006.01) A61P 43/00 (2006.01)

A61K 31/519 (2006.01) C30B 29/58 (2006.01)

A61P 35/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2020.10.12
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.06.24
(86)	European Application Nr.	16773207.2
(86)	European Filing Date	2016.03.31
(87)	The European Application's Publication Date	2018.02.07
(30)	Priority	2015.03.31, JP, 2015070927
(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
	Designated Validation States:	MA MD
(73)	Proprietor	Taiho Pharmaceutical Co., Ltd., 1-27 Kandanishiki-cho, Chiyoda-ku Tokyo 101- 8444, Japan
(72)	Inventor	EGAMI, Kosuke, c/o TAIHO PHARMACEUTICAL CO. LTD. 1-2-4 Uchikanda Chiyoda-ku, Tokyo 101-0047, Japan
(74)	Agent or Attorney	TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

(54)	Title	CRYSTAL OF 3,5-DISUBSTITUTED BENZENE ALKYNYL COMPOUND
(56)	References Cited:	EP-A1- 3 023 100, WO-A1-2015/008844, WO-A1-2013/108809, WO-A1-2015/008839 YUKI KAGOBUTSU KESSHO SAKUSEI HANDBOOK -GENRI TO KNOW-HOW 25 July 2008, pages 57 - 84, XP008183996 BAVIN M: 'Polymorphism in Process Development' CHEMISTRY & INDUSTRY 21 August 1989, pages 527 - 529, XP001180136 MITSURU HASHIDA: 'Keiko Toyo Seizai no Sekkei to Hyoka' KABUSHIKI KAISHA YAKUGYO JIHOSHA 10 February 1995, pages 76 - 79 , 171 TO 172, XP009506428 BYRN,STEPHEN ET AL.: 'Pharmaceutical Solids: A Strategic Approach to Regulatory Considerations' PHARMACEUTICAL RESEARCH vol. 12, no. 7, 1995, pages 945 - 954, XP000996386

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

5 **1.** En krystall av (S)-1-(3-(4-amino-3-((3,5-dimetoksyfenyl)-etynyl)-1H-pyrazolo[3,4-d]-pyrimidin-1-yl)-1-pyrrolidiny)-2-propen-1-on, hvor krystallen viser et røntgenpulverdiffraksjonsspektrum som inneholder minst tre karakteristiske topper ved diffraksjonsvinkler ($2\theta \pm 0.2^\circ$) valgt fra 9.5° , 14.3° , 16.7° , 19.1° , 20.8° , 21.9° , og 25.2° .

10 **2.** Krystallen i henhold til krav 1, som viser et røntgenpulverdiffraksjonsspektrum som inneholder minst fem karakteristiske topper ved diffraksjonsvinkler ($2\theta \pm 0.2^\circ$) valgt fra 9.5° , 14.3° , 16.7° , 19.1° , 20.8° , 21.9° , og 25.2° .

15 **3.** Krystallen i henhold til krav 1 eller 2, som viser et røntgenpulverdiffraksjonsspektrum som inneholder karakteristiske topper ved diffraksjonsvinkler ($2\theta \pm 0.2^\circ$) på 9.5° , 14.3° , 16.7° , 19.1° , 20.8° , 21.9° , og 25.2° .

4. Krystallen i henhold til et hvilket som helst av kravene 1 til 3, som har en kjemisk renhet på 99.0 % eller mer.

20 **5.** Krystallen i henhold til et hvilket som helst av kravene 1 til 4, som viser en endotermisk topp (den høyeste toppverdien) i nærheten av 166°C i differensiell skanning-kalorimetri måling.

25 **6.** En farmasøytisk sammensetning som omfatter krystallen i henhold til et hvilket som helst av kravene 1 til 5.

7. En farmasøytisk sammensetning for oral administrering, hvor sammensetningen omfatter krystallen i henhold til et hvilket som helst av kravene 1 til 5.