



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3330264 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 401/14 (2006.01)
A61K 31/496 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

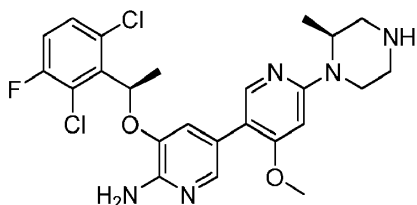
(45)	Translation Published	2020.07.27
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.05.06
(86)	European Application Nr.	16829879.2
(86)	European Filing Date	2016.07.29
(87)	The European Application's Publication Date	2018.06.06
(30)	Priority	2015.07.30, CN, 201510458524
(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
(73)	Proprietor	Chia Tai Tianqing Pharmaceutical Group Co., Ltd., No. 369 Yuzhou South Road Haizhou District, Lianyungang, Jiangsu 222062, Kina Lianyungang Runzhong Pharmaceutical Co., Ltd., No. 16 Jinqiao Road Dapu Industry Park Lianyungang Economy and Technology Development Zone, Lianyungang, Jiangsu 222069, Kina Centaurus BioPharma Co., Ltd., Building 15 Yuquan Wisdom Vale Minzhuang Road 3 Haidian District, Beijing 100195, Kina
(72)	Inventor	GONG, Feng, No.369 Yuzhou South RoadHaizhou District, LianyungangJiangsu 222062, Kina LI, Xinlu, No.369 Yuzhou South RoadHaizhou District, LianyungangJiangsu 222062, Kina ZHAO, Rui, No.369 Yuzhou South RoadHaizhou District, LianyungangJiangsu 222062, Kina ZHANG, Xiquan, No.369 Yuzhou South RoadHaizhou District, LianyungangJiangsu 222062, Kina XU, Xinhe, Building 15Yuquan Wisdom Vale3 Minzhuang RoadHaidian District, Beijing 100195, Kina LIU, Xijie, Building 15Yuquan Wisdom Vale3 Minzhuang RoadHaidian District, Beijing 100195, Kina XIAO, Dengming, Building 15Yuquan Wisdom Vale3 Minzhuang RoadHaidian District, Beijing 100195, Kina HAN, Yongxin, Building 15Yuquan Wisdom Vale3 Minzhuang RoadHaidian District, Beijing 100195, Kina
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54)	Title	PYRIDINE SUBSTITUTED 2-AMINOPYRIDINE PROTEIN KINASE INHIBITOR CRYSTAL
(56)	References Cited:	WO-A1-2014/117718 CN-A- 103 965 161 WO-A1-2006/021886 BYRN STEPHEN ET AL: "Pharmaceutical solids: a strategic approach to regulatory consideration", PHARMACEUTICAL RESEARCH, vol. 12, no. 7, 1 January 1995 (1995-01-01), pages 945-954, XP055395840,

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/>

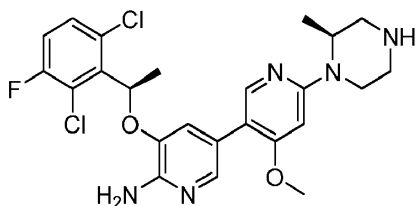
PATENTKRAV

1. Krystallform A av sitratsalt av en forbindelse med formel I, **karakterisert ved at**, i et røntgenpulverdiffraksjonsmønster med Cu K α -stråling, er karakteristiske topper tilstede i 2 θ vinkler på 12,78, 14,61, 17,63, 18,98, 21,42 og 23,47 grader, hvor
- 5 forbindelse med formel I har følgende struktur,



Formel I.

2. Krystall ifølge krav 1, **karakterisert ved at** de karakteristiske toppene er til stede i
- 10 2 θ vinkler på 5,73, 7,05, 9,48, 12,78, 13,76, 14,31, 14,61, 15,66, 17,63, 18,98, 21,42, 21,82, 23,47 og 25,68 grader.
3. Krystall ifølge krav 1, **karakterisert ved at** de karakteristiske toppene er til stede i
- 15 2 θ vinkler på 5,73, 7,05, 8,60, 9,48, 12,78, 13,76, 13,99, 14,31, 14,61, 15,66, 17,63, 18,98, 20,25, 20,82, 21,42, 21,82, 22,26, 22,49, 23,47, 25,68, 26,64 og 30,19 grader.
4. Krystall ifølge krav 1, **karakterisert ved at** de karakteristiske toppene er til stede i
- 20 2 θ vinkler på 5,73, 7,05, 8,60, 9,48, 12,78, 13,76, 13,99, 14,31, 14,61, 15,66, 16,68, 17,13, 17,63, 18,98, 20,25, 20,82, 21,42, 21,82, 22,26, 22,49, 23,47, 24,86, 25,68, 26,00, 26,64, 27,25, 28,04, 28,76, 29,64, 30,19, 31,33, 31,70, 32,64, 33,47, 33,74, 34,60, 35,72 og 38,44 grader.
5. Krystall ifølge krav 1, **karakterisert ved at** den differensielle skanningskalorimetri-
- 25 kurven har en absorpsjonstopp ved 195,9°C.
6. Krystallform B av sitratsalt av en forbindelse med formel I, **karakterisert ved at**, i et røntgenpulverdiffraksjonsmønster med Cu K α -stråling, er karakteristiske topper tilstede i 2 θ vinkler på 6,74, 12,62, 18,42, 22,96 og 25,22 grader, hvor forbindelsen
- 30 med formel I har følgende struktur,



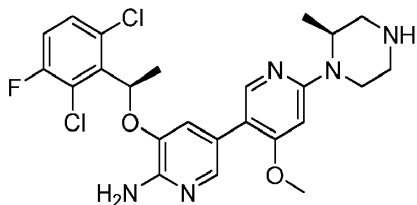
Formel I.

7. Krystall ifølge krav 6, **karakterisert ved at**, de karakteristiske toppene er tilstede i 2θ vinkler på 6,74, 7,19, 12,16, 12,62, 13,12, 13,77, 14,14, 16,42, 18,42, 22,02, 22,65, 22,96, 24,08, 25,22 og 27,45 grader.

8. Krystall ifølge krav 6, **karakterisert ved at**, de karakteristiske toppene er tilstede i 2θ vinkler på 6,14, 6,74, 7,19, 10,50, 11,47, 12,16, 12,62, 13,12, 13,77, 14,14, 15,20, 16,42, 17,15, 18,42, 20,13, 21,18, 21,40, 22,02, 22,65, 22,96, 24,08, 25,22, 25,88, 27,45, 28,35, 30,45, 32,09, 32,79, 33,27, 33,88 og 34,92 grader.

9. Krystall ifølge krav 6, **karakterisert ved at** den differensielle skanningskalorimetri-kurven har en absorpsjonstopp ved 194,3°C.

10. Krystallform C av sitratsalt av en forbindelse med formel I, **karakterisert ved at**, i et røntgenpulverdiffraksjonsmønster med Cu Kα-stråling, er karakteristiske topper tilstede i 2θ vinkler på 7,00, 12,78, 13,66, 15,64, 18,14 og 23,43 grader, hvor forbindelsen med formel I har følgende struktur,



Formel I.

11. Krystall ifølge krav 10, **karakterisert ved at** de karakteristiske toppene er tilstede i 2θ vinkler på 7,00, 12,78, 13,66, 14,01, 14,56, 15,64, 17,58, 18,14, 18,89, 21,37 og 23,43 grader.

12. Krystall ifølge krav 10, **karakterisert ved at** de karakteristiske toppene er tilstede i 2θ vinkler på 5,71, 6,43, 7,00, 8,54, 9,48, 11,22, 12,19, 12,78, 13,66, 14,01, 14,56, 15,64, 16,66, 16,99, 17,58, 18,14, 18,89, 19,84, 20,21, 20,83, 21,37, 21,76, 22,47, 23,43, 23,66, 24,23, 24,87, 25,61, 25,91, 26,55, 27,21, 28,00, 28,76, 30,16, 31,26, 31,69, 33,41, 33,71, 34,52 og 35,70 grader.

13. Krystall ifølge et av kravene 1-12, **karakterisert ved at** molforholdet mellom forbindelse med formel I og sitronsyre i krystallen er 1:1.
- 5 14. Farmasøytisk sammensetning som omfatter en terapeutisk effektiv mengde av en krystall ifølge et hvilket som helst av kravene 1-13.
- 10 15. Krystall av sitratsalt av en forbindelse med formel I ifølge hvilket som helst av kravene 1-13, eller den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 14, for anvendelse i behandling av en ALK-mediert sykdom valgt fra en gruppe bestående av ALK-positiv ikke-liten celle lungekreft, anaplastisk storcellelymfom, inflammatorisk myofibroblastisk tumor, nasofaryngal karsinom, brystkreft, kolorektal kreft, diffus stor β -cellelymfom, systemisk histiocytose og nevroblastom.