



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3661937 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 473/34 (2006.01)
A61K 31/5365 (2006.01)
A61K 31/5377 (2006.01)
A61K 31/635 (2006.01)
A61K 31/675 (2006.01)
A61P 31/18 (2006.01)
C07D 417/12 (2006.01)
C07D 493/04 (2006.01)
C07D 498/14 (2006.01)
C07H 19/16 (2006.01)
C07H 19/20 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

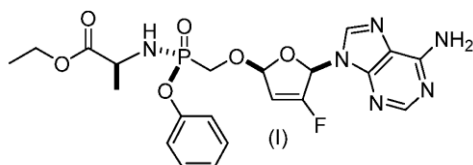
(45)	Translation Published	2021.10.18
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.07.28
(86)	European Application Nr.	18755368.0
(86)	European Filing Date	2018.07.30
(87)	The European Application's Publication Date	2020.06.10
(30)	Priority	2017.08.01, US, 201762539822 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
(73)	Proprietor	Gilead Sciences, Inc., 333 Lakeside Drive, Foster City, CA 94404, USA
(72)	Inventor	LAPINA, Olga Viktorovna, c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside Drive, Foster CityCA 94404, USA SHI, Bing, c/o Gilead Sciences Inc.333 Lakeside Drive, Foster CityCA 94404, USA WANG, Silas, 715 Somerset Lane, Foster City,CA 94404, USA
(74)	Agent or Attorney	OSLO PATENTKONTOR AS, Hoffsvæien 1A, 0275 OSLO, Norge

(54)	Title	CRYSTALLINE FORMS OF ETHYL ((S)-((((2R,5R)-5-(6-AMINO-9H-PURIN-9-YL)-4-FLUORO-2,5-DIHYDROFURAN-2-YL)OXY)METHYL)(PHENOXY)PHOSPHORYL)-L-ALANINATE (GS-9131) FOR TREATING VIRAL INFECTIONS
(56)	References Cited:	WO-A1-2010/005986

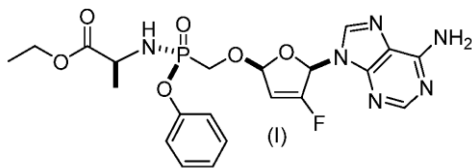
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters 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 form av etyl((S)-(((2R,5R)-5-(6-amino-9H-purin-9-yl)-4-fluor-2,5-dihydrofuran-2-yl)oksy)metyl(fenoksy)fosforyl)-L-alanin (Formel I)



- 5 hvor den krystallinske formen er Formel I Form I,
karakterisert ved et røntgenstråle pulver diffraksjonsmønster med topper ved $7,7^\circ$, $11,2^\circ$ og $15,2^\circ$ $2\theta \pm 0,2^\circ$ 2θ .
2. Krystallinsk form ifølge krav 1, hvor røntgenstråle pulverdiffraksjonsmønsteret har ytterligere topper ved $18,5^\circ$, $20,3^\circ$ og $21,4^\circ$ $2\theta \pm 0,2^\circ$ 2θ .
- 10 3. Krystallinsk form ifølge krav 1 eller 2, hvor røntgenstråle pulverdiffraksjonsmønsteret har en ytterligere topp ved $24,6^\circ$ $2\theta \pm 0,2^\circ$ 2θ .
- 15 4. Krystallinsk form ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, ytterligere **karakterisert ved**:
- a) et røntgenstråle pulverdiffraksjonsmønster som vis i Figur 1;
 - b) et differensial skanning kalorimetri-termogram som vist i Figur 2;
 - c) et termogravimetrisk analyse-termogram som vist i Figur 3 og
 - 20 d) en dynamisk damporspsjon-isoterm som vist i Figur 4.
5. Krystallinsk form av etyl((S)-(((2R,5R)-5-(6-amino-9H-purin-9-yl)-4-fluor-2,5-dihydrofuran-2-yl)oksy)metyl(fenoksy)fosforyl)-L-alanin (Formel I)



hvor den krystallinske form er Formel I Form II,

karakterisert ved et røntgenstråle pulverdiffraksjonsmønster med topper ved $5,6^\circ$, $13,1^\circ$ og $22,4^\circ$ $2\theta \pm 0,2^\circ$ 2θ .

5 6. Krystallinsk form ifølge krav 5, hvor røntgenstråle pulverdiffraksjonsmønsteret har ytterligere topper ved $11,2^\circ$, $18,1^\circ$ og $20,7^\circ$ $2\theta \pm 0,2^\circ$ 2θ .

10 7. Krystallinsk form ifølge krav 5 eller 6, hvor røntgenstråle pulverdiffraksjonsmønsteret har en ytterligere topp ved $22,9^\circ$ $2\theta \pm 0,2^\circ$ 2θ .

8. Krystallinsk form ifølge et hvilket som helst av kravene 5 til 7, ytterligere **karakterisert ved**:

- a) et røntgenstråle pulverdiffraksjonsmønster som vist i Figur 5;
- b) et differensial skanning kalorimetri-termogram som vist i Figur 6;
- 15 c) et termogravimetrisk analyse-termogram som vist i Figur 7 og
- d) en dynamisk damporspsjon-isoterm som vist i Figur 8.

9. Farmasøytisk sammensetning omfattende en terapeutisk effektiv mengde av en form ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8 og en farmasøytisk akseptabel eksipient.

20

10. Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 9, ytterligere omfattende et til tre ytterligere terapeutiske midler; for eksempel hvor minst et av de ytterligere terapeutiske midler er aktivt mot HIV.

25 11. Farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 9 eller 10, hvor den farmasøytiske sammensetningen er i enhetsdoseform; for eksempel hvor enhetsdoseformen er en tablett.

12. Form ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8 for anvendelse i en metode for behandling av en HIV-infeksjon.
13. Fast doseringsform av den krystallinske form ifølge et hvilket som helst av
5 kravene 1 til 8 for anvendelse i en metode for å behandle en infeksjon forårsaket av HIV, eventuelt hvor den faste doseringsformen ytterligere omfatter en farmasøytisk akseptabel eksipient.
14. Fast oral doseringsform ifølge krav 13, hvor doseringsformen er en tablett;
10 eventuelt hvor tablettene er formulert for dosering en gang daglig.
15. Tablett ifølge krav 14, hvor tablettene er:
- (a) en enkeltlagstablett;
 - (b) en flerlagstablett eller
 - 15 (c) en tolagstablett.