



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3749673 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 498/22 (2006.01)
A61K 31/537 (2006.01)
A61P 31/18 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2022.07.25
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2022.03.16
(86)	European Application Nr.	19701843.5
(86)	European Filing Date	2019.01.25
(87)	The European Application's Publication Date	2020.12.16
(30)	Priority	2018.02.09, EP, 18156094 2018.09.13, EP, 18194234
(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	Sandoz AG, Lichtstrasse 35, 4056 Basel, Sveits
(72)	Inventor	LENGAUER, Hannes, c/o Sandoz GmbH Biochemiestr. 10, 6250 Kundl, Østerrike PICHLER, Arthur, c/o Sandoz GmbH Biochemiestr. 10, 6250 Kundl, Østerrike MARGREITER, Renate, c/o Sandoz GmbH Biochemiestr. 10, 6250 Kundl, Østerrike
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54) Title **CRYSTALLINE FORM OF BICTEGRAVIR SODIUM**

(56) References
Cited: US-A1- 2015 366 872
WO-A1-2015/196116
CAIRA ED - MONTCHAMP JEAN-LUC: "Crystalline Polymorphism of Organic Compounds",
TOPICS IN CURRENT CHEMISTRY; [TOPICS IN CURRENT CHEMISTRY], SPRINGER,
BERLIN, DE, vol. 198, 1 January 1998 (1998-01-01), pages 163-208, XP008166276, ISSN:
0340-1022

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/>

EP3749673

1

Patentkrav

- 5 **1.** Krystallinsk form av bictegravirnatrียม (form II) **karakterisert ved at** den har et røntgenpulverdiffraktogram omfattende refleksjoner ved 2-Theta-vinkler på $(6,5 \pm 0,2)^\circ$, $(7,5 \pm 0,2)^\circ$ og $(18,8 \pm 0,2)^\circ$, målt ved en temperatur i området fra 20 til 30 °C med Cu-Kalpha_{1,2}-stråling med en bølgelengde på 0,15419 nm.
- 10 **2.** Den krystallinske formen ifølge krav 1 **karakterisert ved** at den har et røntgenpulverdiffraktogram omfattende ytterligere refleksjoner ved 2-Theta-vinkler på $(19,4 \pm 0,2)^\circ$ og $(20,9 \pm 0,2)^\circ$, målt ved en temperatur i området fra 20 til 30 °C med Cu-Kalpha_{1,2}-stråling med en bølgelengde på 0,15419 nm.
- 15 **3.** Den krystallinske formen ifølge krav 1 eller 2 **karakterisert ved at** den har et røntgenpulverdiffraktogram omfattende ingen refleksjon i området $(5,5 \pm 0,2)^\circ$ 2-Theta, målt ved en temperatur i området fra 20 til 30 °C med Cu-Kalpha_{1,2}-stråling med en bølgelengde på 0,15419 nm.
- 20 **4.** Den krystallinske formen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene **karakterisert ved at** den har et infrarødt fouriertransformspektrum omfattende topper ved bølgetall på (3055 ± 2) cm⁻¹, (2964 ± 2) cm⁻¹ og (1614 ± 2) cm⁻¹, målt ved en temperatur i området fra 20 til 30 °C med en diamantdempet totalrefleksjonscelle.
- 25 **5.** Den krystallinske formen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene **karakterisert ved** at den har et Raman-spektrum omfattende topper ved bølgetall på (1641 ± 4) cm⁻¹, (1436 ± 4) cm⁻¹ og (680 ± 4) cm⁻¹, målt ved en temperatur i området fra 20 til 30 °C og en bølgelengde på 785 nm.
- 30 **6.** Sammensetning omfattende den krystallinske formen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene og høyst 5 vekt-% av en hvilken som helst annen fysisk form av bictegravirnatrียม, basert på sammensetningens vekt.

EP3749673

2

5 **7.** Sammensetningen ifølge krav 6, hvori den andre fysiske formen av bictegravirnatrียม er form I **karakterisert ved** at den har et røntgenpulverdiffraktogram omfattende refleksjoner ved 2-Theta-vinkler på $(5,5 \pm 0,3)^\circ$, $(16,1 \pm 0,3)^\circ$, $(22,1 \pm 0,3)^\circ$, $(23,3 \pm 0,3)^\circ$ og $(28,5 \pm 0,3)^\circ$, målt ved en temperatur i området fra 20 til 30 °C med Cu- $K\alpha_{1,2}$ -stråling med en bølgelengde på 0,15419 nm.

10 **8.** Sammensetningen ifølge krav 6, **karakterisert ved** at den har et røntgenpulverdiffraktogram omfattende ingen refleksjon i området $(5,5 \pm 0,2)^\circ$ 2-Theta, målt ved en temperatur i området fra 20 til 30 °C med Cu- $K\alpha_{1,2}$ -stråling med en bølgelengde på 0,15419 nm.

15 **9.** Anvendelse av den krystallinske formen som definert i et hvilket som helst av kravene 1 til 5 eller sammensetningen som definert i et hvilket som helst av kravene 6 til 8 for fremstilling av en farmasøytisk sammensetning.

20 **10.** Farmasøytisk sammensetning omfattende den krystallinske formen som definert i et hvilket som helst av kravene 1 til 5 eller sammensetningen som definert i et hvilket som helst av kravene 6 til 8 og minst én farmasøytisk akseptabel eksipient.

11. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 10, ytterligere omfattende én eller flere ytterligere aktive farmasøytiske ingrediens(er).

25 **12.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 11, hvori de ytterligere farmasøytiske ingrediensene er emtricitabin og tenofoviralfenamidhemifumarat.

13. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 10 til 12 for anvendelse i behandling og/eller profylakse av HIV-1 infeksjoner.

30

14. 2,2,2-trifluoretanolsolvatet av bictegravirnatrียม.