



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3912971 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

C07D 219/10 (2006.01)

A61K 31/473 (2006.01)

A61P 21/00 (2006.01)

A61P 21/04 (2006.01)

A61P 25/00 (2006.01)

A61P 25/18 (2006.01)

A61P 25/28 (2006.01)

C07C 51/43 (2006.01)

C07C 55/10 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2023.10.09
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.05.31
(86)	European Application Nr.	20748154.0
(86)	European Filing Date	2020.01.21
(87)	The European Application's Publication Date	2021.11.24
(30)	Priority	2019.01.31, CN, 201910100045
(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	Changchun Huayuan High-Science and Technology Co., Ltd, No. 1198 Silicon Valley Street High Tech Zone, Changchun, Jilin 130012, Kina Jiangsu Sheneryang High-Science and Technology Co., Ltd, No.1 Medine City Avenue, Taizhou, Jiangsu 225300, Kina
(72)	Inventor	WANG, Tonghui, No.1198 Silicon Valley Street, High Tech Zone, Changchun, Jilin 130012, Kina ZHANG, Ju, No.1198 Silicon Valley Street, High Tech Zone, Changchun, Jilin 130012, Kina WANG, Lihua, No.1198 Silicon Valley Street, High Tech Zone, Changchun, Jilin 130012, Kina WANG, Depu, No.1198 Silicon Valley Street, High Tech Zone, Changchun, Jilin 130012, Kina ZHANG, Yaxin, No.1198 Silicon Valley Street, High Tech Zone, Changchun, Jilin 130012, Kina YU, Qinghua, No.1198 Silicon Valley Street, High Tech Zone, Changchun, Jilin 130012, Kina ZHANG, Qi, No.1198 Silicon Valley Street, High Tech Zone, Changchun, Jilin 130012, Kina LI, Mingze, No.1198 Silicon Valley Street, High Tech Zone, Changchun, Jilin 130012, Kina
(74)	Agent or Attorney	Novagraaf Brevets, Bâtiment O2, 2 rue Sarah Bernhardt CS90017, 92665 ASNIÈRES-SUR-SEINE CEDEX, Frankrike

(54) Title **CHOLINESTERASE INHIBITOR POLYMORPH AND APPLICATION THEREOF**

(56) References

Cited:

WO-A1-02/079166, CN-A- 1 523 016, CN-A- 109 651 248, CN-A- 109 734 663,
CN-A- 109 796 405, CN-A- 110 683 987,
Xia Zhao, Yan Liang, Junyu Xu, Dongmei Zhang, Depu Wang, Jingkai Gu, Yimin Cui: "A single-
center, randomized, open-label, dose-escalation study to evaluate the pharmacokinetics of
tacrine analogue octahydrogenacridine succinate tablets in healthy Chinese subjects", Biological
& Pharmaceutical Bulletin, vol. 35, no. 9, 31 December 2012 (2012-12-31), pages 1502-1508,
XP055724299, ISSN: 0918-6158, DOI: 10.1248/bpb.b1200242

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 av oktahydroaminoakridinsuksinat, **karakterisert ved at** krystallformen er: Krystallform A, som har hovedkarakteristiske diffraksjonstopper ved de tilsvarende posisjonene til 2θ -verdier på $8,8^\circ \pm 0,2^\circ$, $16,4^\circ \pm 0,2^\circ$, $23,2^\circ \pm 0,2^\circ$ i
5 røntgenpulverdiffraksjonsmønsteret.
2. Krystallformen ifølge krav 1, **karakterisert ved at** krystallform A, som har sekundære karakteristiske diffraksjonstopper ved de tilsvarende posisjonene til 2θ -verdier på $17,0^\circ \pm 0,2^\circ$, $17,8^\circ \pm 0,2^\circ$, $23,8^\circ \pm 0,2^\circ$ i røntgenstrålepulverdiffraksjonsmønsteret.
- 10 3. Krystallformen ifølge krav 2, **karakterisert ved at** krystallform A, som har tertiære karakteristiske diffraksjonstopper ved de tilsvarende posisjonene til 2θ -verdier på $12,1^\circ \pm 0,2^\circ$, $8,2^\circ \pm 0,2^\circ$, $9,3^\circ \pm 0,2^\circ$ i røntgenstrålepulverdiffraksjonsmønsteret.
4. Krystallformen ifølge krav 3, **karakterisert ved at** krystallform A har et
15 røntgenpulverdiffraksjonsmønster som vist i figur 1.
5. Farmasøytisk sammensetning, **karakterisert ved at** den farmasøytiske sammensetningen inneholder en effektiv mengde av krystallform A ifølge et hvilket som helst av kravene 1–4.
6. Krystallform A ifølge et hvilket som helst av kravene 1–4, eller den
20 farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 5 for anvendelse ved fremstilling av et medikament for behandling av sykdommer forårsaket av overdreven aktivering av kolinesterase eller sykdommer relatert til redusert kolinfunksjon, hvori sykdommen forårsaket av overdreven aktivering av kolinesterase er Alzheimers sykdom, myasthenia gravis, myatrofi, poliomyelittfølgetilstander, cerebral parese i
25 barndommen, traumatisk sensorimotorisk lidelse, polynevritt og radikulitt, abdominal distensjon, urinretensjon, paroksysmal supraventrikulær takykardi, redning av ikke-depolariserende muskelavslappende forgiftning, glaukom, muskelavslappende antagonisme, betennelse, nyresykdom, fedme, fettlever, hypertyreose, schizofreni, hemolytisk anemi og megaloblastisk anemi; og
30 sykdommen relatert til nedsatt kolinfunksjon er søvnløshet, vaskulær demens,

hukommelsestap, oppmerksomhetsforstyrrelse og andre søvnforstyrrelser, og kolinutarmingsrelatert kognitiv svekkelsessykdom.
