



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2155200 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/497 (2006.01)
A61K 31/4965 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2017.04.10
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2016.12.07
(86)	European Application Nr.	08755214.7
(86)	European Filing Date	2008.05.09
(87)	The European Application's Publication Date	2010.02.24
(30)	Priority	2007.05.11, US, 917383 P
(84)	Designated Contracting States:	AT BE BG CH CY CZ DE DK EE ES FI FR GB GR HR HU IE IS IT LI LT LU LV MC MT NL NO PL PT RO SE SI SK TR
(73)	Proprietor	Richter Gedeon Nyrt., Gyömrői út 19-21, 1103 Budapest, HU-Ungarn
(72)	Inventor	LIAO, Xiangmin, 35 Harvard Lane, Commack, NY 11725, US-USA ZHU, Haijian, 8 Milleridge Lane, Smithtown, NY 11787, US-USA GRILL, Andreas, 5 June Street, Hauppauge, NY 11788, US-USA
(74)	Agent or Attorney	Zacco Norway AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

(54)	Title	CRYSTALLINE FORM OF A CARBAMOYL-CYCLOHEXANE DERIVATIVE
(56)	References Cited:	WO-A1-2005/012266 WO-A1-2007/033191 US-B2- 6 566 550 GUREVICH ET AL.: 'Mesolimbic dopamine D3 receptors and use of antipsychotics in patients with schizophrenia. A postmortem study' ARCHIVES OF GENERAL PSYCHIATRY vol. 54, 1997, pages 225 - 232, XP008134819

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.** Krystallinsk form av trans-1{4-[2-[4-(2,3-diklorfenyl)-piperazin-1-yl]-etyl]-sykloheksyl}-3,3-dimetyl-urea hydroklorid (form III) som har et røntgenpulverdiffraksjonsmønster (CuK α -stråling) omfattende karakteristiske topper ved 4,1; 12,3; 16,5 og 17,4 $\pm$ 0,2 grader 2 θ .

10 **2.** Den krystallinske formen ifølge krav 1 med et røntgenpulverdiffraksjonsmønster (CuK α -stråling) som vist i figur 5.

3. Den krystallinske formen ifølge krav 1 med en smeltende endoterm ved 260 °C som bestemt av DSC (oppvarmingshastighet på 10 °C/min).

15 **4.** Fremgangsmåte for å fremstille den krystallinske formen ifølge krav 1, omfattende:

- (i) tilsetning av trans-1{4-[2-[4-(2,3-diklorfenyl)-piperazin-1-yl]-etyl]-sykloheksyl}-3,3-dimetyl-urea hydroklorid til pyridin; og
- (ii) utfelling av krystallinformen fra løsningen.

20 **5.** Fremgangsmåten ifølge krav 4, hvori blandingen i trinn (i) varmes opp til en temperatur på 30 °C til 50 °C.

25 **6.** Fremgangsmåten ifølge krav 4, hvori trinn (i) omfatter danning av en mettet løsning.

7. Fremgangsmåten ifølge krav 4, videre omfattende (iii) innhenting av krystallinformen.

30 **8.** Fremgangsmåten ifølge krav 7, hvori trinn (iii) omfatter (a) filtrering av utfellingen dannet i trinn (ii) og (b) tørking av krystallinformen.

9. Farmasøytisk sammensetning, omfattende krystallinformen ifølge et hvilket som helst av krav 1–3.

35 **10.** Krystallinformen ifølge et hvilket som helst av krav 1-3 til anvendelse ved behandling og/eller forhindring av en tilstand valgt fra schizofreni,

schizoaffektive lidelser, kognitiv hemmelse i forbindelse med schizofreni, mild til moderat kognitiv svikt, demens, psykotiske tilstander assosiert med demens, psykotisk depresjon, mani, akutt mani, bipolar lidelse, paranoia og vrangforestillinger, dyskinetiske lidelser som Parkinsons lidelse, nevroleptisk induisert parkinsonisme, depresjon, angst og rusmisbruk.

5

11. Krystallinformen til anvendelse ifølge krav 10, hvori tilstanden er schizofreni.

12. Krystallinformen til anvendelse ifølge krav 10, hvori tilstanden er akutt mani.

10