



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2401272 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 417/04 (2006.01)
A61K 9/14 (2006.01)
A61K 31/47 (2006.01)
A61K 31/4725 (2006.01)
A61P 31/14 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2017.04.10
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2017.01.11
(86)	European Application Nr.	10706539.3
(86)	European Filing Date	2010.02.26
(87)	The European Application's Publication Date	2012.01.04
(30)	Priority	2009.02.27, EP, 09153964
(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 MK MT NL NO PL PT RO SE SI SK SM TR
(73)	Proprietor	Janssen Pharmaceuticals, Inc., 1125 Trenton-Harbourton Road, Titusville, NJ 08560, US-USA
(72)	Inventor	VAN REMOORTERE, Peter, Jozef, Maria, 44 Western Way, NJ 08540 Princeton, US-USA VANDECRUYS, Roger, Petrus, Gerebern, Langstraat 108, B-2260 Westerlo, BE- Belgia DE KOCK, Herman, Wolfseind 10, B-2370 Arendonk, BE-Belgia
(74)	Agent or Attorney	Tandbergs Patentkontor AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

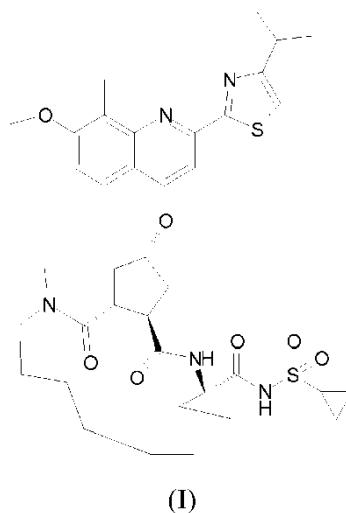
(54)	Title	AMORPHOUS SALT OF A MACROCYCLIC INHIBITOR OF HCV
(56)	References Cited:	WO-A-2007/014926 WO-A-2008/092954 GOULD P L: "SALT SELECTION FOR BASIC DRUGS" INTERNATIONAL JOURNAL OF PHARMACEUTICS, ELSEVIER BV, NL, vol. 33, no. 1/03, 1 January 1986 (1986-01-01), pages 201-217, XP002074725 ISSN: 0378-5173 BERGE S M ET AL: "PHARMACEUTICALS SALTS" JOURNAL OF PHARMACEUTICAL SCIENCE, AMERICAN PHARMACEUTICAL ASSOCIATION, WASHINGTON, US, vol. 66, no. 1, 1 January 1977 (1977-01-01), pages 1-19, XP000562636 ISSN: 0022-3549

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. Natriumsaltet av forbindelsen med formel I:

5



i fast amorf form.

10 **2.** En fremgangsmåte for fremstilling av saltet ifølge krav 1, omfattende:

- (a) fremstilling av en blanding av forbindelsen med formel I i et ikke-vandig løsningsmiddel og vandig natriumhydroksid; og
- (b) spraytørking av en blanding av (a) i et spraytørkeapparat.

15

3. Fremgangsmåte ifølge krav 2, hvor trinn a) omfatter blanding av en natriumhydroksid-løsning i vann, med det nevnte løsningsmiddel og deretter tilsetning av forbindelsen med formel I.

20 **4.** Fremgangsmåte ifølge krav 3, hvor i trinn a) forbindelsen med formel I får danne en løsning.

5. Fremgangsmåte ifølge hvilket som helst av kravene 2 til 4, hvor løsningsmidlet er et halogenert hydrokarbon.

25

6. Fremgangsmåte ifølge krav 2, hvor løsningsmidlet er diklormetan, og det vandige natriumhydroksid er fra ca. 7,5 N til ca. 12,5 N natriumhydroksidløsning i vann.

7. Et farmasøytisk preparat omfattende natriumsaltet av forbindelsen med formel I i amorf form, som definert i krav 1, og en farmasøytisk akseptabel bærer.

8. Forbindelse som definert i krav 1, for anvendelse som en medisin.

5

9. Forbindelse som definert i krav 1, for anvendelse som en HCV-inhibitor.

10. Anvendelse av forbindelsen som definert i krav 1, for fremstilling av et medikament for behandling av HCV.

10

11. En kombinasjon som omfatter: (a) forbindelsen som definert i krav 1; og (b) en annen antiviral forbindelse, som et kombinert preparat for samtidig, separat eller sekvensiell anvendelse.

12. Kombinasjon som angitt i krav 11, hvor den antivirale forbindelsen er en anti-HCV-forbindelse.

13. Kombinasjon ifølge krav 12, hvor anti-HCV-forbindelsen er en HCV-polymerase-inhibitor, en HCV-proteaseinhibitor, en inhibitor av andre mål i HCV-livssyklusen, et immunmodulerende middel, eller kombinasjoner derav.

20

14. En kombinasjon som omfatter: (a) forbindelsen som definert i krav 1; og (b) ritonavir, som et kombinert preparat for samtidig, separat eller sekvensiell anvendelse.

25