



(12) Translation of
european patent specification

(11) NO/EP 2547650 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07C 233/18 (2006.01)
A61K 31/165 (2006.01)
A61P 5/00 (2006.01)
A61P 25/00 (2006.01)
A61P 25/22 (2006.01)
A61P 25/24 (2006.01)
C07C 231/12 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

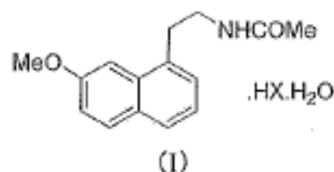
(21)	Translation Published	2016.03.14
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2015.11.04
(86)	European Application Nr.	11755680.3
(86)	European Filing Date	2011.03.17
(87)	The European Application's Publication Date	2013.01.23
(30)	Priority	2010.03.17, CN, 201010126263
(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
	Designated Extension States:	BA ME
(73)	Proprietor	Les Laboratoires Servier, 35, rue de Verdun, 92284 Suresnes Cedex, FR-Frankrike
(72)	Inventor	SHAN, Hanbin, No. 24, Dongfangxincun, Gaoan, Jiangxi 330800, CN-Kina YUAN, Zhedong, Room 201, No. 14, Lane 58, Aomen Road, Shanghai 200060, CN-Kina ZHU, Xueyan, Room 602, No. 78, lane 283, Yangcheng Road, Zhabei District, Shanghai 200436, CN-Kina ZHANG, Peng, No. 826, Zhangheng Road Pudong New Area, Shanghai 201203, CN-Kina PAN, Hongjuan, Room 801, No. 21, lane 150, Qingshan Road, Minhang District, Shanghai 201103, CN-Kina YU, Xiong, Room 107, No. 32, Duolun Road, Hongkou District, Shanghai 200081, CN-Kina
(74)	Agent or Attorney	Oslo Patentkontor AS, Postboks 7007 Majorstua , 0306 OSLO, Norge

(54)	Title	AGOMELATINE HYDROBROMIDE HYDRATE AND PREPARATION THEREOF
(56)	References Cited:	CN-A- 101 481 321 CN-A- 101 585 779

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.** Agomelatinhydrobromidhydrat med formel I:



5 hvor X er Br.

- 2.** Agomelatinhydrobromidhydrat med formel I ifølge krav 1 i form av krystallinsk form, som oppviser følgende krystallparametre: romgruppe $P2_1/c$, gitterparameter $a=7,5943$ (7), $b=23,4046$ (19), $c=9,6438$ (8) Å, $\beta=1613,9$ (2)°.
- 3.** Fremgangsmåte for fremstilling av agomelatinhydrobromidhydrat ifølge krav 1 eller 2, hvor agomelatin omsettes med HBr i et vandig organisk løsemiddel for å fremstille agomelatinhydrobromidhydrat.
- 4.** Fremgangsmåte for fremstilling av agomelatinhydrobromidhydrat ifølge krav 3, hvor agomelatin løses opp i et organisk løsemiddel før vandig HBr-løsning tilsettes for å felle ut krystallet av produktet.
- 5.** Fremgangsmåte for fremstilling av agomelatinhydrobromidhydrat ifølge krav 4, hvor nevnte vandige HBr-løsning tilsettes dråpevis.
- 6.** Fremgangsmåte for fremstilling av agomelatinhydrobromidhydrat ifølge krav 3, hvor agomelatin tilsettes til et vandig organisk løsemiddel inneholdende HBr for å felle ut krystallet av produktet.
- 7.** Fremgangsmåte for fremstilling av agomelatinhydrobromidhydrat ifølge krav 4 eller 6, ytterligere omfattende å skylle og tørke det faste stoff etter krystallisering.
- 8.** Fremgangsmåte for fremstilling av agomelatinhydrobromidhydrat ifølge krav 4 eller 6, hvor reaksjonstemperaturen er 0-20°C.

- 9.** Fremgangsmåte for fremstilling av agomelatinhydrobromidhydrat ifølge krav 4 eller 6, hvor nevnte organiske løsemiddel er etylacetat, metylacetat, n-butylacetat, aceton eller acetonitril.
- 10.** Fremgangsmåte for fremstilling av agomelatinhydrobromidhydrat ifølge krav 5 9, hvor nevnte organiske løsemiddel er etylacetat.
- 11.** Farmasøytisk kapsel omfattende agomelatinhydrobromidhydrat ifølge krav 1 eller 2 i assosiasjon med farmasøytisk akseptable hjelpestoffer eller eksipienser.
- 12.** Anvendelse av agomelatinhydrobromidhydrat ifølge krav 1 eller 2 for
10 behandling av forstyrrelser i det melatoninergiske system, søvnforstyrrelser, stress, angst, årstidsavhengige affektive forstyrrelser, dype depresjoner, kardiovaskulære sykdommer, sykdommer i fordøyelsessystemet, søvnløshet og tretthet som følge av jet lag, schizofreni, fobier eller depresjonsforstyrrelser.