



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3077390 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 403/14 (2006.01)
A61K 31/4192 (2006.01)
A61P 25/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2018.02.05
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2017.09.13
(86)	European Application Nr.	14824108.6
(86)	European Filing Date	2014.12.02
(87)	The European Application's Publication Date	2016.10.12
(30)	Priority	2013.12.03, WO, PCT/IB13/060595
(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	Idorsia Pharmaceuticals Ltd, Hegenheimermattweg 91, 4123 Allschwil, CH-Sveits
(72)	Inventor	BOSS, Christoph, c/o Actelion Pharmaceuticals LtdGewerbstrasse 16, CH-4123 Allschwil, CH-Sveits BROTSCHI, Christine, c/o Actelion Pharmaceuticals LtdGewerbstrasse 16, CH-4123 Allschwil, CH-Sveits GUDE, Markus, Grabenring 9, CH-4123 Allschwil, CH-Sveits HEIDMANN, Bibia, c/o Actelion Pharmaceuticals LtdGewerbstrasse 16, CH-4123 Allschwil, CH-Sveits SIFFERLEN, Thierry, c/o Actelion Pharmaceuticals LtdGewerbstrasse 16, CH-4123 Allschwil, CH-Sveits VON RAUMER, Markus, c/o Actelion Pharmaceuticals LtdGewerbstrasse 16, CH-4123 Allschwil, CH-Sveits WILLIAMS, Jodi T., c/o Actelion Pharmaceuticals LtdGewerbstrasse 16, CH-4123 Allschwil, CH-Sveits
(74)	Agent or Attorney	Plougmann Vingtoft, Postboks 1003 Sentrum, 0104 OSLO, Norge

(54)	Title	CRYSTALLINE SALT FORM OF (S)-(2-(6-CHLORO-7-METHYL-1H-BENZO[D]IMIDAZOL-2-YL)-2-METHYLPYRROLIDIN-1-YL)(5-METHOXY-2-(2H-1,2,3-TRIAZOL-2-YL)PHENYL)METHANONE AS OREXIN RECEPTOR ANTAGONIST
(56)	References Cited:	WO-A1-03/002561, WO-A1-2013/182972, WO-A1-2010/072722

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/>

P a t e n t k r a v

- 1.** Krystallin form av forbindelsen (S)-(2-(6-klor-7-metyl-1H-benzo[d]imidazol-2-yl)-2-metylpyrrolidin-1-yl)(5-metoksy-2-(2H-1,2,3-triazol-2-yl)fenyl)metanon; der forbindelsen er til stede i form av hydrogenkloridsyresalt; der den krystalline saltformen er **k a r a k t e r i s e r t v e d** tilstedeværelsen av topper i røntgen-pulverdiffraksjonsdiagrammet ved følgende avbøyningsvinkler 2θ : $11,0^\circ$, $24,1^\circ$ og $24,5^\circ$, der røntgen-pulverdiffraksjonsdiagrammet er tilveiebrakt ved anvendelse av kombinert Cu K α 1 og K α 2-stråling, uten K α 2-stripping; og 2θ -verdienes nøyaktighet er i intervallet $2\theta \pm 0,2^\circ$.
- 2.** Krystallin form av (S)-(2-(6-klor-7-metyl-1H-benzo[d]imidazol-2-yl)-2-metylpyrrolidin-1-yl)(5-metoksy-2-(2H-1,2,3-triazol-2-yl)fenyl)metanonhydroklorid ifølge krav 1, **k a r a k t e r i s e r t v e d** tilstedeværelsen av topper i røntgen-pulverdiffraksjonsdiagrammet ved følgende avbøyningsvinkler 2θ : $9,2^\circ$, $11,0^\circ$, $13,8^\circ$, $15,1^\circ$, $16,3^\circ$, $16,8^\circ$, $19,8^\circ$, $24,1^\circ$, $24,5^\circ$ og $27,3^\circ$, der røntgen-pulverdiffraksjonsdiagrammet er tilveiebrakt ved anvendelse av kombinert Cu K α 1 og K α 2-stråling, uten K α 2-stripping; og 2θ -verdienes nøyaktighet er i intervallet $2\theta \pm 0,2^\circ$.
- 3.** Krystallin form av (S)-(2-(6-klor-7-metyl-1H-benzo[d]imidazol-2-yl)-2-metylpyrrolidin-1-yl)(5-metoksy-2-(2H-1,2,3-triazol-2-yl)fenyl)metanonhydroklorid ifølge krav 1 eller 2, som vesentlig viser røntgen-pulverdiffraksjonsmønsteret som vist i figur 2.
- 4.** Farmasøytisk sammensetning som omfatter den krystalline form av (S)-(2-(6-klor-7-metyl-1H-benzo[d]imidazol-2-yl)-2-metylpyrrolidin-1-yl)(5-metoksy-2-(2H-1,2,3-triazol-2-yl)fenyl)metanonhydroklorid ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, og en farmasøytisk akseptabel bærer.
- 5.** Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 4, til bruk i behandling eller forebygging av en psykisk sykdom eller lidelse relatert til oreksinerg funksjonssvikt.

6. Krystallin form av (S)-(2-(6-klor-7-metyl-1H-benzo[d]imidazol-2-yl)-2-metylpyrrolidin-1-yl)(5-metoksy-2-(2H-1,2,3-triazol-2-yl)fenyl)metanonhydroklorid ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, til bruk som legemiddel.

5

7. Krystallin form av (S)-(2-(6-klor-7-metyl-1H-benzo[d]imidazol-2-yl)-2-metylpyrrolidin-1-yl)(5-metoksy-2-(2H-1,2,3-triazol-2-yl)fenyl)metanonhydroklorid ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, til bruk i behandling eller forebygging av en sykdom eller lidelse valgt fra gruppen som består av søvnforstyrrelser, angstlidelser, avhengighetslidelser, kognitiv funksjonssvikt, stemningslidelser og spiseforstyrrelser.

10

8. Krystallin form av (S)-(2-(6-klor-7-metyl-1H-benzo[d]imidazol-2-yl)-2-metylpyrrolidin-1-yl)(5-metoksy-2-(2H-1,2,3-triazol-2-yl)fenyl)metanonhydroklorid ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, til bruk i behandling eller forebygging av en sykdom eller lidelse valgt fra gruppen som består av dyssomnier, parasomnier, søvnforstyrrelser assosiert med en generell medisinsk tilstand og stoffinduserte søvnforstyrrelser; angstlidelser; og avhengighetslidelser.

20

9. Bruk av krystallin form av (S)-(2-(6-klor-7-metyl-1H-benzo[d]imidazol-2-yl)-2-metylpyrrolidin-1-yl)(5-metoksy-2-(2H-1,2,3-triazol-2-yl)fenyl)metanonhydroklorid ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, til preparering av et legemiddel til behandling eller forebygging av en sykdom eller lidelse valgt fra gruppen som består av søvnforstyrrelser, angstlidelser, avhengighetslidelser, kognitiv funksjonssvikt, stemningslidelser og spiseforstyrrelser.

25

30