



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3102575 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

<i>A61P 19/00 (2006.01)</i>	<i>A61P 43/00 (2006.01)</i>
<i>A61K 31/541 (2006.01)</i>	<i>C07D 471/04 (2006.01)</i>
<i>A61P 19/02 (2006.01)</i>	<i>H04L 29/06 (2006.01)</i>
<i>A61P 29/00 (2006.01)</i>	<i>H04L 29/08 (2006.01)</i>
<i>A61P 35/00 (2006.01)</i>	<i>H04W 4/80 (2018.01)</i>
<i>A61P 37/00 (2006.01)</i>	<i>H04W 8/24 (2009.01)</i>
<i>A61P 37/06 (2006.01)</i>	<i>H04W 92/18 (2009.01)</i>
<i>A61P 37/08 (2006.01)</i>	

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.03.15
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.01.13
(86)	European Application Nr.	15704974.3
(86)	European Filing Date	2015.02.04
(87)	The European Application's Publication Date	2016.12.14
(30)	Priority	2014.02.07, GB, 201402071
(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	Galapagos NV, Generaal De Wittelaan L11/A3, 2800 Mechelen, Belgium
(72)	Inventor	SABOURAULT, Nicolas Luc, Galapagos SASU 102 Avenue Gaston Roussel, F-93230 Romainville, France DE FAVERI, Carla, Lundbeck Pharmaceuticals Italy SpA Quarta Strada 2, I-35129 Padova, Italia SHEIKH, Ahmad, AbbVie Inc.1 North Waukegan Road, North Chicago, IL 60064, USA
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

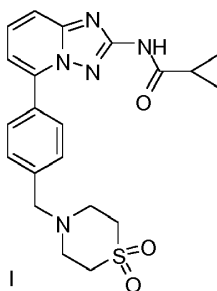
(54)	Title	NOVEL SALTS AND PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS THEREOF FOR THE TREATMENT OF INFLAMMATORY DISORDERS
------	-------	--

(56)	References Cited:	WO-A1-2013/189771, WO-A1-2010/149769
------	----------------------	--------------------------------------

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. Farmasøytisk akseptabelt salt av en forbindelse ifølge formel (I):



hvor saltet er en 1:1:3 fri base/HCl/H₂O-addukt.

5

2. Farmasøytisk akseptabelt salt eller farmasøytisk akseptabelt hydrat av et salt ifølge krav 1, hvor hydratet av saltet er i en krystallinsk form.

10

3. Farmasøytisk akseptabelt hydrat av et salt ifølge krav 2, hvor 1:1:3 fri base/HCl/H₂O-hydratet av saltet er karakterisert i det minste av en pulverrøntgendiffraksjonstopp ved en hvilken som helst av én eller flere av følgende stillinger: 7,25, 8,31, 8,78, 10,69, 11,96, 12,25, 13,17, 13,74, 16,23, 16,71, 19,26, 19,64, 20,15, 20,57, 20,95, 21,38, 21,69, 22,77, 23,37, 25,14, 25,71, 25,89, 27,66, 28,57, 28,81, 29,17, 29,58, 30,63, 30,94, 32,06, 32,63, 34,14, 36,22, 36,67, og 37,12° 2θ ± 0,2° 2θ.

15

4. Farmasøytisk akseptabelt hydrat av et salt ifølge krav 2, hvor 1:1:3 fri base/HCl/H₂O-hydratet av saltet er **karakterisert av** følgende diffraksjonsparametere:

Molekylær formel	C ₂₁ H ₂₄ N ₅ O ₃ S.Cl ₃ (H ₂ O)				
Molekylær vekt	516.02				
Krystallsystem	Monoklin				
Romgruppe	P2 ₁ / _n	a	13,1388(4) Å	α	102,089(2)°
		b	8,9437(3) Å	β	
		c	21,6376(9) Å	γ	
V	2486,24(15) Å ³				
Z	4				
DC	1,379 mg/m ³				
μ	0,284 mm ⁻¹				
Kilde	Mo-Kα, 0,71073 Å				
F(000)	1088				

T	120(2) K
Krystall	fargeløst prisme, 0,39 x 0,16 x 0,12 mm
θ -intervall for datainnsamling	2,982 – 27,483°
Fullstendighet	99,3%
Refleksjoner	21028
Unike refleksjoner	5649
R_{int}	0,0307

5. Fremgangsmåte for fremstilling av en [Forbindelse ifølge formel I:HCl:3H₂O]-addukt i fast krystallinsk form omfattende trinnene:

- i) å blande forbindelsen ifølge formel I suspendert i DCM, med MeOH ved 35°C,
- 5 ii) å tilsette vann under omrøring ved 35°C i minst 15 minutter,
- iii) å separere det organiske laget,
- iv) å tilsette en 10% vekt/vekt løsning av HCl i MeOH til det organiske laget tilveiebragt i det forrige trinnet iii),
- v) å separere det resulterende faste stoffet ved filtrering tilveiebragt i det
- 10 forrige trinnet iv),
- vi) å tørke det resulterende faste stoffet tilveiebragt i det forrige trinnet v),
- vii) å tilsette det faste stoffet tilveiebragt i det forrige trinnet vi) til en 1,6/0,4 maursyre/vann-løsning under omrøring ved 55°C
- viii) å tilsette vann til løsningen tilveiebragt i det forrige trinnet vii),
- 15 ix) å separere ved filtrering det resulterende faste stoffet tilveiebragt i det forrige trinnet viii), og å tørke det resulterende faste stoffet tilveiebragt i det forrige trinnet ix).