



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3248967 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 405/12 (2006.01)
A61K 31/4184 (2006.01)
A61P 1/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2020.10.26
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.06.24
(86)	European Application Nr.	15879068.3
(86)	European Filing Date	2015.11.18
(87)	The European Application's Publication Date	2017.11.29
(30)	Priority	2015.01.20, KR, 20150009326
(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	HK inno.N Corporation, 6F, 7F, 8F, 100, Eulji-ro Jung-Gu, Seoul 04551, Sør-Korea
(72)	Inventor	KIM, Young Ju, 4201-1003 11 Dongbaek 2-ro Giheung-gu, Yongin-si Gyeonggi-do 17010, Sør-Korea KIM, Eun Sun, 247-1001 16 Bongyeong-ro 1744beon-gil Yeongtong-gu, Suwon-si Gyeonggi-do 16711, Sør-Korea LEE, Ji Yun, 101-706 426-17 Heungan-daero Dongan-gu, Anyang-si Gyeonggi-do 14063, Sør-Korea LEE, Hyuk Woo, 234-701 10 Dongtansibeomhanbit-gil, Hwaseong-si Gyeonggi-do 18437, Sør-Korea KWEON, Jae Hong, 116-1302 4-27 Yeongtong-ro 90beon-gil Yeongtong-gu, Suwon-si Gyeonggi-do 16692, Sør-Korea LEE, Sung Ah, 8 Wonsutaek-ro 52beon-gil, Guri-si Gyeonggi-do 11932, Sør-Korea CHOI, Kwang Do, 10-709 280 Dongan-ro Dongan-gu, Anyang-si Gyeonggi-do 13919, Sør-Korea KO, Dong Hyun, 103-405 128 Gwanmun-ro, Gwacheon-si Gyeonggi-do 13804, Sør- Korea HEO, Seung Pyeong, 102-804 391 Gajwa-ro Eunpyeong-gu, Seoul 03434, Sør- Korea
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

(54)	Title	CRYSTALLINE FORM OF A BENZIMIDAZOLE DERIVATIVE AND A PREPARATION METHOD THEREOF
(56)	References Cited:	KR-A- 20120 052 269, US-A1- 2006 194 969, KR-A- 20110 038 011, US-A1- 2008 214 519, KR-B1- 101 088 247, US-A1- 2007 142 448 BYRN, S. ET AL.: "Pharmaceutical solids: a strategic approach to regulatory consideration", PHARMACEUTICAL RESEARCH, vol. 12, no. 7, 1995, pages 945-954, XP055395840

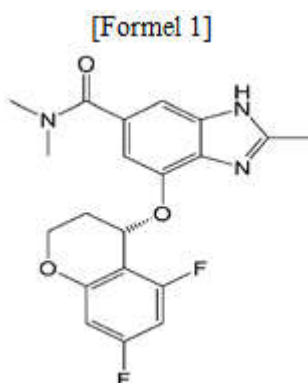
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters 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/>

EP 3248967

1

Patentkrav

- 5 **1.** Krystallinsk form A av en forbindelse representert ved følgende formel 1, som har et røntgenpulverdiffraksjonsmønster ved anvendelse av Cu-K α -stråling med topper ved diffraksjonsvinkel 8,1 °, 10,0 °, 12,6 °, 14,9 °, 15,6 °, 16,5 °, 17,2 °, 19,6 °, 23,1 °, 24,2 °, 28,1 °, 30,2 ° og 31,6 ° ($2\theta \pm 0,2^\circ$):



10

- 2.** Den krystallinske formen A ifølge krav 1, hvori den krystallinske formen A har en endoterm topp ved en temperatur mellom 220 °C og 225 °C i differensiell skannings-kalorimetri.

15

- 3.** Den krystallinske formen A ifølge krav 1, hvori den krystallinske formen A har et IR-spektrum med karakteristiske absorpsjonstopper ved 832 cm⁻¹, 1071 cm⁻¹, 1127 cm⁻¹, 1326 cm⁻¹, 1403 cm⁻¹, 1440 cm⁻¹, 1598 cm⁻¹, 2934 cm⁻¹, 3062 cm⁻¹ og 3124 cm⁻¹.

20

- 4.** Fremgangsmåte for å fremstille en krystallinsk form A av en forbindelse med formel 1 ifølge krav 1, omfattende:

å suspendere forbindelsen representert ved formel 1 i en hvilken som helst tilfeldig form i et løsemiddel valgt fra gruppen bestående av acetonitril, C₁₋₄-alkylacetat, C₁₋₄-dikloralkan, kloroform, tetrahydrofuran, toluen, di(C₁₋₄-alkyl)eter, (C₁₋₄-alkyl)(C₁₋₄-alkyl)eter, C₁₋₄-alkyleter, vann og en blanding derav;

25

å utsette den resulterende oppløsningen for varmebehandling under omrøring i 1 time til 24 timer; og

EP 3248967

2

å avkjøle den resulterende oppløsningen til romtemperatur etterfulgt av modning av krystaller under omrøring i 1 time til 48 timer.

5 **5.** Fremgangsmåten ifølge krav 4, hvori løsemiddelet er acetonitril, metylacetat, etylacetat, isopropylacetat, 1,2-diklorethan, metylenklorid, kloroform, tetrahydrofuran, toluen, dietyleter, isopropyleter, *tert*-butylmetyleter, vann eller en blanding derav.

10 **6.** Fremgangsmåten ifølge krav 4, hvori varmebehandlingen er å øke temperaturen til fra 50 °C til 120 °C.

15 **7.** Fremgangsmåte for å fremstille en krystallinsk form A av en forbindelse med formel 1 ifølge krav 1, omfattende:
å løse opp forbindelsen representert ved formel 1 i en hvilken som helst tilfeldig form i et løsemiddel valgt fra gruppen bestående av C₁₋₄-alkohol, aceton og en blanding derav;
å krystallisere forbindelsen ved å tilsette et antiløsemiddel til den resulterende oppløsningen; og
20 å modne det resulterende krystallet ved omrøring i 6 timer til 24 timer ved romtemperatur.

25 **8.** Fremgangsmåten ifølge krav 7, hvori løsemiddelet er metanol, etanol, isopropanol, n-propanol, n-butanol, isobutanol, t-butanol, aceton eller en blanding derav.

9. Fremgangsmåten ifølge krav 7, hvori antiløsemiddelet er vann, isopropyleter, acetonitril, dietyleter, *tert*-butylmetyleter eller en blanding derav.

30 **10.** Fremgangsmåten ifølge kravene 4 eller 7, ytterligere omfattende filtrering eller tørking.