



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3254681 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/437 (2006.01)
A61P 11/00 (2006.01)
A61P 25/00 (2006.01)
C07D 471/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21) Translation Published 2019.11.04

(80) Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent 2019.06.19

(86) European Application Nr. 17180587.2

(86) European Filing Date 2013.02.25

(87) The European Application's Publication Date 2017.12.13

(30) Priority 2012.02.27, US, 201261603598 P

(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

(62) Divided application EP2820016, 2013.02.25

(73) Proprietor Bristol-Myers Squibb Company, Route 206 and Province Line Road, Princeton, NJ 08543, USA

(72) Inventor ROBERTS, Daniel Richard, Bristol-Myers Squibb Company1 Squibb Drive, New Brunswick, NJ New Jersey 08903, USA
SCHARTMAN, Richard Raymond, 27 Cliffside Drive, Wallingford, CT Connecticut 06492, USA
WEI, Chenkou, Bristol-Myers Squibb Company1 Squibb Drive, New Brunswick, NJ New Jersey 08903, USA

(74) Agent or Attorney TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

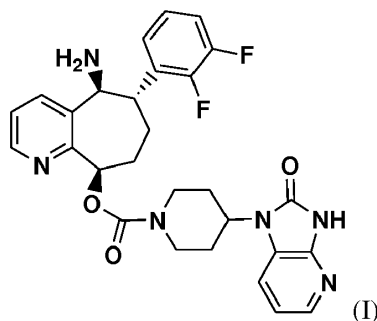
(54) Title **N-(5S,6S,9R)-5-AMINO-6-(2,3-DIFLUOROPHENYL)-6,7,8,9-TETRAHYDRO-5H-CYCLOHEPTA[B]PYRIDIN-9-YL-4-(2-OXO-2,3-DIHYDRO-1H-IMIDAZO[4,5-B]PYRIDIN-1-YL)PIPERIDINE-1-CARBOXYLATE SALT**

(56) References Cited: WO-A1-2011/046997
BOWKER ET AL: "A Procedure for Salt Selection and Optimization" In: Stahl Peter Heinrich; Wermuth Camille G: "HANDBOOK OF PHARMACEUTICAL SALTS : PROPERTIES, SELECTION, AND USE", 1 January 2002 (2002-01-01), , ZÜRICH : VERL. HELVETICA CHIMICA ACTA ; WEINHEIM [U.A.] : WILEY-VCH, DE, XP003027023, ISBN: 978-3-906390-26-0 pages 162-173, * the whole document ** page 163 - page 164, paragraph 1 ** page 166, last paragraph ** page 167 - page 168, paragraph 3.1; table 1 * DATABASE ZREGISTRY 18 May 2012 (2012-05-18), XP002696163, Database accession no. 1374024-48-2

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. Fast farmasøytisk sammensetning i doseringsenhetsform, omfattende fra 1 til 1000 mg per dose av et hemisulfatsalt av forbindelse (I):



5

og en farmasøytisk akseptabel bærer eller fortynningsmiddel.

2. Farmasøytisk sammensetning i form av en oral doseringsform, omfattende fra 70 til 750 mg av hemisulfatsaltet av forbindelse (I) ifølge krav 1.

10

3. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 2, omfattende 70 mg av hemisulfatsaltet av forbindelse (I).

4. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 2, omfattende 80 mg av hemisulfatsaltet av forbindelse (I).

15

5. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, hvori hemisulfatsaltet av forbindelse (I) er et sesquihydrat.

20 6. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5, hvori hemisulfatsaltet av forbindelse (I) er krystallinsk form H1.5-1, **karakterisert ved** følgende:

enhetscelleparametere som i det vesentlige er lik følgende:

Celledimensjoner:	a = 10,92 Å
	b = 33,04 Å
	c = 7,90 Å
	α = 90 grader
	β = 90 grader
	γ = 90 grader

Romgruppe: P2₁2₁2

Molekyler av forbindelse (I)/asymmetrisk enhet: 1

Volum = 2851 Å³

Tetthet (beregnet) = 1,423 g/cm³,

5 hvori måling av den krystallinske formen er ved en temperatur på ca. 25 °C.

7. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 6, hvori formen H1.5-1 er

karakterisert ved én eller flere av følgende:

10 a) et pulverrøntgenstrålediffraksjonsmønster (CuKα λ=1,5418Å) omfattende følgende
2θ-verdier: 5,4±0,1, 8,6±0,1, 9,7±0,1, 12,4±0,1, 14,9±0,1, 17,6±0,1, 18,1±0,1,
20,5±0,1, 21,4±0,1 og 22,0±0,1, hvori måling av den krystallinske formen er ved en
temperatur på ca. 25 °C

og/eller

15 b) et kjerneresonansspektra i fast tilstand omfattende følgende topper (δ (ppm) referert
til TMS): 26,6±0,1, 27,1±0,1, 28,3±0,1, 30,7±0,1, 43,1±0,1, 45,9±0,1, 47,1±0,1,
52,0±0,1, 54,2±0,1, 72,5±0,1, 117,0±0,1, 117,7±0,1, 124,2±0,1, 125,2±0,1,
128,3±0,1, 130,3±0,1, 131,4±0,1, 134,1±0,1, 140,8±0,1, 144,7±0,1, 148,7±0,1,
149,8±0,1, 151,2±0,1, 153,4±0,1, 155,1±0,1, 155,6±0,1 og 156,7±0,1.

20 **8.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7 for
anvendelse i behandling av migrenehodepiner.

9. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7 for
oral administrering som er nyttig for behandling av migrenehodepiner.

25

10. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7
for sublingual administrering nyttig for behandling av migrenehodepiner.

30 **11.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7
for intranasal administrering nyttig for behandling av migrenehodepiner.

12. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7
for anvendelse én gang per dag i behandling av migrenehodepiner.

35 **13.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7
for anvendelse to ganger daglig i behandling av migrenehodepiner.