



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 3294719 B1

NORWAY

(19) NO  
(51) Int Cl.  
*C07D 295/096 (2006.01)*  
*A61K 31/495 (2006.01)*  
*A61P 25/18 (2006.01)*  
*A61P 25/24 (2006.01)*  
*A61P 25/28 (2006.01)*  
*C07D 207/28 (2006.01)*

Norwegian Industrial Property Office

---

|      |                                                                      |                                                                                                                                                                                                                                          |
|------|----------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| (21) | Translation Published                                                | 2019.03.18                                                                                                                                                                                                                               |
| (80) | Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent | 2019.01.02                                                                                                                                                                                                                               |
| (86) | European Application Nr.                                             | 16721817.1                                                                                                                                                                                                                               |
| (86) | European Filing Date                                                 | 2016.05.11                                                                                                                                                                                                                               |
| (87) | The European Application's Publication Date                          | 2018.03.21                                                                                                                                                                                                                               |
| (30) | Priority                                                             | 2015.05.13, DK, 201500284                                                                                                                                                                                                                |
| (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                                                                                                                                                                                                                                    |
|      | Designated Validation States:                                        | MA MD                                                                                                                                                                                                                                    |
| (73) | Proprietor                                                           | H. Lundbeck A/S, Ottiliavej 9, 2500 Valby, Danmark                                                                                                                                                                                       |
| (72) | Inventor                                                             | DE DIEGO, Heidi, Lopez, Hælderne 5, 2850 Nærum, Danmark<br>CHRISTENSEN, Kim, Lasse, Holmstrupvej 73, 4200 Slagelse, Danmark<br>HOLM, Rene, Turkisvej 2, 4040 Jyllinge, Danmark<br>KATEB, Jens, Köpenhamnsvägen 9b, 217 43 Malmö, Sverige |
| (74) | Agent or Attorney                                                    | BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge                                                                                                                                                                                       |

---

|      |                   |                                                       |
|------|-------------------|-------------------------------------------------------|
| (54) | Title             | <b>VORTIOXETINE PYROGLUTAMATE</b>                     |
| (56) | References Cited: | WO-A1-2007/144005, WO-A1-2014/044721, GB-A- 1 006 728 |

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. Vortioxetin pyroglutamat.
2. Forbindelse ifølge krav 1 valgt fra vortioxetin(L)-pyroglutamat, vortioxetin(D)-pyroglutamat og vortioxetin(DL)-pyroglutamat.
3. Forbindelse ifølge krav 1, som er vortioxetin(L)-pyroglutamat eller vortioxetin(D)-pyroglutamat i krystallinsk form med XRPD refleksjoner ved 10,72, 12,14, 16,22 og 18,59 ( $^{\circ}2\theta$ ) ( $\pm 0,1^{\circ}2\theta$ ).
4. Forbindelse ifølge krav 1, som er vortioxetin(DL)-pyroglutamatmonohydrat i krystallinsk form med XRPD-refleksjoner ved 6,16, 9,25, 17,68 og 18,12 ( $^{\circ}2\theta$ ) ( $\pm 0,1^{\circ}2\theta$ ).
5. Forbindelse ifølge krav 1, som er vortioxetin(DL)-pyroglutamat  $\alpha$ -form i krystallinsk form med XRPD refleksjoner ved 14,27, 15,75, 17,06 og 18,59 ( $^{\circ}2\theta$ ) ( $\pm 0,1^{\circ}2\theta$ ).
6. Forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-5 for bruk i terapi.
7. Farmasøytisk sammensetning omfattende en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-5 sammen med minst en farmasøytisk akseptabel bærer eller fortynningsmiddel.
8. Gelbar farmasøytisk sammensetning omfattende en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-5 og et salt.
9. Gel inneholdende en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-5, et salt og vann.
10. Fast farmasøytisk sammensetning for oral administrering omfattende en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-5 og et enterisk belegg.
11. Fremgangsmåte for fremstilling av en gel, hvilken fremgangsmåte omfatter blanding av en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-5, et salt og en vandig løsning.
12. Anvendelse av en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-5 til fremstilling av et medikament for behandling av en sykdom valgt fra vesentlig depressiv lidelse; stor

depressiv episode; generell angstlidelse; tvangslidelse (OCD), panikklidelse; posttraumatisk stresslidelse; kognitiv svekkelse; mild kognitiv svekkelse (MCI); kognitiv svekkelse forbundet med Alzheimers sykdom, depresjon, schizofreni (CIAS); og oppmerksomhetsunderskudd hyperaktivitetsforstyrrelse (ADHD).

13. Anvendelse av en forbindelse ifølge krav 12 og et salt i fremstillingen av et medikament for behandling av en sykdom valgt fra vesentlig depressiv lidelse; stor depressiv episode; generell angstlidelse; tvangslidelse (OCD), panikklidelse; posttraumatisk stresslidelse; kognitiv svekkelse; mild kognitiv svekkelse (MCI); kognitiv svekkelse forbundet med Alzheimers sykdom, depresjon, schizofreni (CIAS); og oppmerksomhetsunderskudd hyperaktivitetsforstyrrelse (ADHD).

14. Forbindelse ifølge hvilket som helst av kravene 1-5 for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av en sykdom valgt fra vesentlig depressiv lidelse; stor depressiv episode; generell angstlidelse; tvangslidelse (OCD), panikklidelse; posttraumatisk stresslidelse; kognitiv svekkelse; mild kognitiv svekkelse (MCI); kognitiv svekkelse forbundet med Alzheimers sykdom, depresjon, schizofreni (CIAS); og oppmerksomhetsunderskudd hyperaktivitetsforstyrrelse (ADHD).

15. Forbindelse ifølge krav 14 sammen med et salt for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av en sykdom valgt fra vesentlig depressiv lidelse; stor depressiv episode; generell angstlidelse; tvangslidelse (OCD), panikklidelse; posttraumatisk stresslidelse; kognitiv svekkelse; mild kognitiv svekkelse (MCI); kognitiv svekkelse forbundet med Alzheimers sykdom, depresjon, schizofreni (CIAS); og oppmerksomhetsunderskudd hyperaktivitetsforstyrrelse (ADHD).