



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3433233 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 207/48 (2006.01)
A61K 31/40 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2020.09.07
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.07.22
(86)	European Application Nr.	17770546.4
(86)	European Filing Date	2017.03.17
(87)	The European Application's Publication Date	2019.01.30
(30)	Priority	2016.03.25, KR, 20160036080
(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 Validation States:	MA
(73)	Proprietor	Daewoong Pharmaceutical Co., Ltd., 35-14, Jeyakgongdan 4-gil, Hyangnam-eup, Hwaseong-siGyenoggi-do 18623, Sør-Korea
(72)	Inventor	KIM, Aeri, DAEWOONG PHARMACEUTICAL CO., LTD.35-14, Jeyakgongdan 4- gilHyangnam-eupHwaseong-si, Gyeonggi-do 18623, Sør-Korea CHO, Kwan Hyung, 111-1902, 156, Hwamyeongsindosi-roBuk-gu, Busan 46525, Sør-Korea
(74)	Agent or Attorney	Cosmovici Intellectual Property, 14 Rue du Rhône, 1204 GENÈVE, Sveits

(54)	Title	NOVEL CRYSTALLINE FORM OF 1-(5-(2,4-DIFLUOROPHENYL)-1-((3- FLUOROPHENYL)SULFONYL)-4-METHOXY-1H-PYRROL-3-YL)-N- METHYLMETHANAMINE SALT
(56)	References Cited:	EP-A1- 1 803 709 US-A1- 2015 307 449 WO-A2-2016/175555 US-A1- 2010 113 524 CN-A- 104 447 491 KR-A- 20070 060 133 US-A1- 2011 288 040

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 3 433 233 B1**Krav**

1. En krystallinsk metode I av 1-(5-(2,4-difluorofenyl)-1-((3-fluorofenyl)sulfonyl)-4-metoksy-1H-pyrrol-3-yl)-N-metylmetanamin hydroklorid som har topper ved diffraksjonsvinkler ($29 \pm 0,2^\circ$) på $5,8^\circ$, $9,7^\circ$, $10,0^\circ$, $12,8^\circ$, $13,2^\circ$, $17,4^\circ$ og $18,5^\circ$ i et røntgenpulver diffraksjonsmønster.
5
2. Den krystallinske metoden I av 1-(5-(2,4-difluorofenyl)-1-((3-fluorofenyl)sulfonyl)-4-metoksy-1H-pyrrol-3-yl)-N-metylmetanamin hydroklorid fra krav 1, hvor krystallinmetoden krystallinsk form I har en endotermisk opptakstemperatur på $215,02 \pm 3^\circ\text{C}$ og viser en maksimal endotermisk topp ved en endotermisk temperatur på $217,11 \pm 3^\circ\text{C}$ i en scannet kalorimetrianalyse.
10
3. En krystallinsk metode II av 1-(5-(2,4-difluorofenyl)-1-((3-fluorofenyl)sulfonyl)-4-metoksy-1H-pyrrol-3-yl)-N-metylmetanamin hydroklorid som har topper ved diffraksjonsvinkler ($29 \pm 0,2^\circ$) på $9,2^\circ$, $10,0^\circ$, $12,9^\circ$ og $20,2^\circ$ i et røntgenpulver diffraksjonsmønster.
- 15 4. Den krystallinske metoden II av 1-(5-(2,4-difluorofenyl)-1-((3-fluorofenyl)sulfonyl)-4-metoksy-1H-pyrrol-3-yl)-N-metylmetanamin hydroklorid fra krav 3, hvor krystallinmetoden krystallinsk form II har en endotermisk opptakstemperatur på $213,14 \pm 3^\circ\text{C}$ og viser en maksimal endotermisk topp ved en endotermisk temperatur på $215,7 \pm 3^\circ\text{C}$ i en scannet kalorimetrianalyse.
- 20 5. En krystallinsk metode av 1-(5-(2,4-difluorofenyl)-1-((3-fluorofenyl)sulfonyl)-4-metoksy-1H-pyrrol-3-yl)-N-metylmetanamin suksinat som har topper ved diffraksjonsvinkler ($29 \pm 0,2^\circ$) på $8,0^\circ$, $11,2^\circ$, $12,0^\circ$, $14,9^\circ$, $22,1^\circ$ og $24,1^\circ$ i et røntgenpulver diffraksjonsmønster.
6. Den krystallinske metoden I av 1-(5-(2,4-difluorofenyl)-1-((3-fluorofenyl)sulfonyl)-4-metoksy-1H-pyrrol-3-yl)-N-metylmetanamin suksinat fra krav 5, hvori krystallinformen har en endotermisk opptakstemperatur på $132,3 \pm 3^\circ\text{C}$ og viser en maksimal endotermisk topp ved en endotermisk temperatur på $133,9 \pm 3^\circ\text{C}$ i en scannet kalorimetrianalyse.
25
7. En krystallinsk metode I av 1-(5-(2,4-difluorofenyl)-1-((3-fluorofenyl)sulfonyl)-4-metoksy-1H-pyrrol-3-yl)-N-metylmetanamin tartrat som har topper ved diffraksjonsvinkler ($29 \pm 0,2^\circ$) på $11,7^\circ$, $21,5^\circ$ og $23,5^\circ$ i et røntgenpulver diffraksjonsmønster.

EP 3 433 233 B1

- 8.** Den krystallinske metoden av 1-(5-(2,4-difluorofenyl)-1-((3-fluorofenyl)sulfonyl)-4-metoksy-1H-pyrrol-3-yl)-N-metylmetanamin tartrat fra krav 7, hvor krystallinmetoden har en endotermisk opptakstemperatur på $146,34 \pm 3^\circ\text{C}$ og viser en maksimal endotermisk topp ved en endotermisk temperatur på $148,27 \pm 3^\circ\text{C}$ i en differensialscannet kalorimetrianalyse.
- 5 **9.** En krystallinsk metode I av 1-(5-(2,4-difluorofenyl)-1-((3-fluorofenyl)sulfonyl)-4-metoksy-1H-pyrrol-3-yl)-N-metylmetanamin fumar som har topper ved diffraksjonsvinkler ($29 \pm 0,2^\circ$) på $7,9^\circ$, $11,9^\circ$, og $24,0^\circ$ i et røntgenpulver diffraksjonsmønster.
- 10 **10.** Den krystallinske metoden I av 1-(5-(2,4-difluorofenyl)-1-((3-fluorofenyl)sulfonyl)-4-metoksy-1H-pyrrol-3-yl)-N-metylmetanamin fumar fra krav 9, hvori krystallinmetoden krystallinsk form I har en endotermisk opptakstemperatur på $164,97 \pm 3^\circ\text{C}$ og viser en maksimal endotermisk topp ved en endotermisk temperatur på $167,46 \pm 3^\circ\text{C}$ i en differensialscannet kalorimetrianalyse.
- 15 **11.** En krystallinsk metode II av 1-(5-(2,4-difluorofenyl)-1-((3-fluorofenyl)sulfonyl)-4-metoksy-1H-pyrrol-3-yl)-N-metylmetanamin fumar som har topper ved diffraksjonsvinkler ($29 \pm 0,2^\circ$) på $8,4^\circ$, $10,5^\circ$, og $19,02^\circ$ i et røntgenpulver diffraksjonsmønster.
- 20 **12.** Den krystallinske metoden II av 1-(5-(2,4-difluorofenyl)-1-((3-fluorofenyl)sulfonyl)-4-metoksy-1H-pyrrol-3-yl)-N-metylmetanamin fumar fra krav 11, hvor krystallinmetoden krystallinsk form II har en endotermisk opptakstemperatur på $179,47 \pm 3^\circ\text{C}$ og viser en maksimal endotermisk topp ved en endotermisk temperatur på $189,05 \pm 3^\circ\text{C}$ i en differensialscannet kalorimetrianalyse.