



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 3459538 B1

NORWAY

(19) NO  
(51) Int Cl.  
*A61K 31/165 (2006.01)*  
*A61K 47/54 (2017.01)*  
*A61P 3/04 (2006.01)*  
*A61P 25/00 (2006.01)*  
*C07C 237/06 (2006.01)*

Norwegian Industrial Property Office

---

|      |                                                                      |                                                                                                                                                                                                                                      |
|------|----------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| (45) | Translation Published                                                | 2020.09.28                                                                                                                                                                                                                           |
| (80) | Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent | 2020.05.06                                                                                                                                                                                                                           |
| (86) | European Application Nr.                                             | 17192115.8                                                                                                                                                                                                                           |
| (86) | European Filing Date                                                 | 2017.09.20                                                                                                                                                                                                                           |
| (87) | The European Application's Publication Date                          | 2019.03.27                                                                                                                                                                                                                           |
| (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                                                           | Sandoz AG, Lichtstrasse 35, 4056 Basel, Sveits                                                                                                                                                                                       |
| (72) | Inventor                                                             | LENGAUER, Hannes, c/o Sandoz GmbH Biochemiestr. 10, 6250 Kundl, Østerrike<br>PICHLER, Arthur, c/o Sandoz GmbH Biochemiestr. 10, 6250 Kundl, Østerrike<br>MARGREITER, Renate, c/o Sandoz GmbH Biochemiestr. 10, 6250 Kundl, Østerrike |
| (74) | Agent or Attorney                                                    | ZACCO NORWAY AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge                                                                                                                                                                                |

---

(54) Title                    **CRYSTALLINE SALTS OF A DEXTROAMPHETAMINE PRODRUG**

(56) References  
Cited:                    WO-A1-2010/148305  
DATABASE CAPLUS [Online] CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US;  
1965, "Amides from amino acids with amphetamine", XP002778249, retrieved from STN  
Database accession no. 1966:19805 -& BE 658 748 A 26 July 1965 (1965-07-26) -& DATABASE  
WPI Week 1968 1968 Thomson Scientific, London, GB; AN 1966-17758F XP002778250, & NL 6  
414 901 A (HOFFMANN-LA ROCHE) 28 July 1965 (1965-07-28)

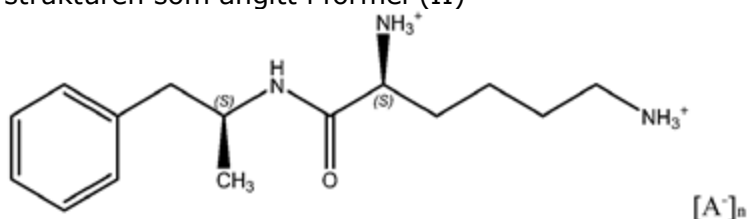
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters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

[EP3459538]

1

**Patentkrav**

1. Krystallinsk salt av *L*-lysin-*d*-amfetamin representert ved den kjemiske strukturen som angitt i formel (II)



formel (II)

hvor  $n$  er i området fra 1,9 til 2,1, og  $A$  er valgt fra gruppen bestående av adipinsyre, *p*-toluensvovelsyre, fumarsyre og oksalsyre, og hvor det krystallinske saltet er valgt fra gruppen bestående av

- *L*-lysin-*d*-amfetamindiadipat (form I), **karakterisert ved** ved at det har et røntgenpulverdiffraktogram omfattende refleksjoner ved 2-Theta-vinkler på  $(4,7 \pm 0,2)^\circ$ ,  $(11,1 \pm 0,2)^\circ$  og  $(18,9 \pm 0,2)^\circ$ , målt ved en temperatur i området fra 20 til 30 °C og en relativ fuktighet i området fra 0 til 65 % med Cu-K $\alpha_{1,2}$ -stråling med en bølgelengde på 0,15419 nm;

- *L*-lysin-*d*-amfetamindiadipat (form II), **karakterisert ved** det har et røntgenpulverdiffraktogram omfattende refleksjoner ved 2-Theta-vinkler på  $(4,7 \pm 0,2)^\circ$ ,  $(7,1 \pm 0,2)^\circ$  og  $(21,1 \pm 0,2)^\circ$ , målt ved en temperatur i området fra 20 til 30 °C og en relativ fuktighet i området fra 0 til 65 % med Cu-K $\alpha_{1,2}$ -stråling med en bølgelengde på 0,15419 nm;

- *L*-lysin-*d*-amfetaminditosylat (form I), **karakterisert ved** det har et røntgenpulverdiffraktogram omfattende refleksjoner ved 2-Theta-vinkler på  $(6,0 \pm 0,2)^\circ$ ,  $(7,4 \pm 0,2)^\circ$  og  $(8,1 \pm 0,2)^\circ$ , målt ved en temperatur i området fra 20 til 30 °C og en relativ fuktighet i området fra 0 til 65 % med Cu-K $\alpha_{1,2}$ -stråling med en bølgelengde på 0,15419 nm;

- *L*-lysin-*d*-amfetaminditosylat (form II), **karakterisert ved** det har et røntgenpulverdiffraktogram omfattende refleksjoner ved 2-Theta-vinkler på  $(5,0 \pm 0,2)^\circ$ ,  $(5,7 \pm 0,2)^\circ$  og  $(7,2 \pm 0,2)^\circ$ , målt ved en temperatur i området fra 20 til 30 °C og en relativ fuktighet i området fra 0 til 65 % med Cu-K $\alpha_{1,2}$ -stråling med en bølgelengde på 0,15419 nm;

[EP3459538]

2

- 5       • *L*-lysin-*d*-amfetamindifumarat, **karakterisert ved** det har et røntgenpulverdiffraktogram omfattende refleksjoner ved 2-Theta-vinkler på  $(4,3 \pm 0,2)^\circ$ ,  $(6,6 \pm 0,2)^\circ$  og  $(23,8 \pm 0,2)^\circ$ , målt ved en temperatur i området fra 20 til 30 °C og en relativ fuktighet i området fra 0 til 65 % med Cu-Kalpha<sub>1,2</sub>-stråling med en bølgelengde på 0,15419 nm; og
  - 10       • *L*-lysin-*d*-amfetamindioksalat, **karakterisert ved** det har et røntgenpulverdiffraktogram omfattende refleksjoner ved 2-Theta-vinkler på  $(9,2 \pm 0,2)^\circ$ ,  $(9,4 \pm 0,2)^\circ$  og  $(12,3 \pm 0,2)^\circ$ , målt ved en temperatur i området fra 20 til 30 °C og en relativ fuktighet i området fra 0 til 65 % med Cu-Kalpha<sub>1,2</sub>-stråling med en bølgelengde på 0,15419 nm.
2. Anvendelse av det krystallinske saltet som definert i krav 1 for fremstilling av en farmasøytisk sammensetning.
- 15       3. Farmasøytisk sammensetning omfattende det krystallinske saltet som definert i krav 1 og minst én farmasøytisk akseptabel eksipient.
- 20       4. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 3, hvori den minst ene farmasøytisk akseptable eksipienten er valgt fra gruppen bestående av mikrokrySTALLinsk cellulose, krySSkarmellosenatrium og magnesiumstearat.
- 25       5. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 3 eller 4, hvori den farmasøytiske sammensetningen er en oral fast doseringsform.
- 30       6. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 5, hvori den orale faste doseringsformen er en kapsel.
7. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 6, hvori kapselen er en hard gelatinkapsel
8. Det krystallinske saltet som definert i krav 1 eller den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 3 til 7 for anvendelse som medikament.

[EP3459538]

3

5      **9.** Det krystallinske saltet som definert i krav 1 eller den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 3 til 7 for anvendelse i behandling av symptomer på oppmerksomhetsforstyrrelse med hyperaktivitet (ADHD) og overspisingsforstyrrelse (BED).