



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 3597189 B1

NORWAY

(19) NO  
(51) Int Cl.  
*A61K 31/403 (2006.01)*  
*A61K 45/06 (2006.01)*  
*C07D 209/52 (2006.01)*

**Norwegian Industrial Property Office**

---

|      |                                                                      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          |
|------|----------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| (45) | Translation Published                                                | 2022.08.15                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |
| (80) | Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent | 2022.06.01                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |
| (86) | European Application Nr.                                             | 19196556.5                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |
| (86) | European Filing Date                                                 | 2016.06.17                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |
| (87) | The European Application's Publication Date                          | 2020.01.22                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |
| (30) | Priority                                                             | 2015.06.17, US, 201562181174 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                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |
|      | Designated Extension States:                                         | BA ; ME                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |
| (73) | Proprietor                                                           | Otsuka America Pharmaceutical, Inc., 2440 Research Boulevard, Rockville, MD 20850, USA                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
| (72) | Inventor                                                             | MCKINNEY, Anthony Alexander, 38 Braeland Avenue Suite 2, Newton Center, MA 02459, USA<br>BYMASTER, Franklin, 8545 North Country Road 650 East, Brownsburg, IN 46112, USA<br>PISKORSKI, Walter, 115 Hawthorne Village Road, Nashua, NH 03062, USA<br>FLEITZ, Fred J., W 145 N10063 Sun Valley Trail, Germantown, WI 53022, USA<br>YANG, Yonglai, 313 Sheringham Drive, Hockessin, DE 19707, USA<br>ENGERS, David A., c/o SSCI 3065 Kent Avenue, West Lafayette, IN 47906, USA<br>SMOLENSKAYA, Valeriya, 3409 Cheswick Court, West Lafayette, IN 47906, USA<br>KUSUKUNTLA, Venkat, W143 N10503 Evergreen Circle, Germantown, WI 53022, USA |
| (74) | Agent or Attorney                                                    | BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       |

---

|      |                   |                                          |
|------|-------------------|------------------------------------------|
| (54) | Title             | <b>CRYSTALLINE COMPOUNDS</b>             |
| (56) | References Cited: | US-A1- 2007 082 940<br>WO-A1-2013/019271 |

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.** Krystallinsk form B av (1R,5S)-1-(naftalen-2-yl)-3-azabicyclo[3.1.0]heksanhydroklorid, hvori den krystallinske form B oppviser et røntgenpulverdiffraksjonsmønster (XRPD) som omfatter minst tre 2-theta ( $^{\circ}$ ) verdier valgt fra gruppen bestående av  $6,0 \pm 0,2$ ,  $17,4 \pm 0,2$ ,  $18,9 \pm 0,2$ ,  $19,2 \pm 0,2$  og  $24,4 \pm 0,2$ , hvor XRPD måles ved bruk av en innfallende stråle av Cu K $\alpha$  stråling som har en bølgelengde på 1,54059 Å, og hvori den krystallinske form B omfatter mindre enn 20 vekt% av enhver annen krystallinsk form av (1R,5S)-1-(naftalen-2-yl)-3-azabicyclo[3.1.0]heksanhydroklorid.
- 2.** Krystallinsk form B ifølge krav 1, hvori den krystallinske form B oppviser et røntgenpulverdiffraksjonsmønster (XRPD) som omfatter 2-theta ( $^{\circ}$ ) verdier på  $6,0 \pm 0,2$ ,  $17,4 \pm 0,2$ ,  $18,9 \pm 0,2$ ,  $19,2 \pm 0,2$ , og  $24,4 \pm 0,2$ .
- 3.** Krystallinsk form B ifølge krav 1 eller 2, hvori XRPD-mønsteret til den krystallinske form B videre omfatter minst én, to eller tre 2-theta ( $^{\circ}$ ) verdier valgt fra gruppen bestående av  $12,1 \pm 0,2$ ,  $13,2 \pm 0,2$ ,  $14,9 \pm 0,2$ ,  $15,1 \pm 0,2$ ,  $16,0 \pm 0,2$ ,  $16,9 \pm 0,2$ ,  $18,2 \pm 0,2$ ,  $19,9 \pm 0,2$ ,  $21,1 \pm 0,2$ ,  $21,3 \pm 0,2$ ,  $21,7 \pm 0,2$ ,  $22,6 \pm 0,2$ ,  $23,6 \pm 0,2$ ,  $23,8 \pm 0,2$ ,  $25,3 \pm 0,2$ ,  $26,1 \pm 0,2$ ,  $26,6 \pm 0,2$ ,  $27,2 \pm 0,2$ ,  $28,2 \pm 0,2$ ,  $28,7 \pm 0,2$  og  $29,5 \pm 0,2$ .
- 4.** Krystallinsk form B ifølge hvilket som helst av kravene 1-3, hvori den krystallinske form B oppviser et røntgenpulverdiffraksjonsmønster (XRPD) som omfatter minst tre d-avstandsverdier (Å) valgt fra gruppen bestående av 14,6, 5,1, 4,7, 4,6 og 3,6.
- 5.** Krystallinsk form B ifølge krav 4, hvori den krystallinske form B oppviser et røntgenpulverdiffraksjonsmønster (XRPD) som omfatter d-avstandsverdier (Å) på 14,6, 5,1, 4,7, 4,6 og 3,6.
- 6.** Krystallinsk form B ifølge krav 4 eller 5, hvori XRPD-mønsteret til den krystallinske form B videre omfatter minst én, to eller tre d-avstandsverdier (Å) valgt fra gruppen bestående av 7,3, 6,7, 6,0, 5,9, 5,5, 5,2, 4,9, 4,5, 4,2, 4,1, 3,9, 3,8, 3,7, 3,5, 3,4, 3,3, 3,2, 3,1 og 3,0.
- 7.** Krystallinske form B ifølge hvilket som helst av kravene 1-6, hvori den krystallinske form B tilhører P2<sub>1</sub>2<sub>1</sub>2<sub>1</sub> avstandsgruppe og har følgende enhetscelleparametere:  $a = 5,9055(2)$  Å,  $b = 7,4645(3)$  Å,  $c = 29,1139(13)$  Å,  $\alpha = \beta = \gamma = 90^{\circ}$ .
- 8.** Farmasøytisk sammensetning omfattende krystallinsk form B ifølge hvilket som helst av kravene 1-7 og et farmasøytisk akseptabelt fortynningsmiddel eller bærer.
- 9.** Farmasøytisk sammensetning ifølge krav 8, som er en oral farmasøytisk sammensetning med forsinket frigjøring.
- 10.** Krystallinsk form B ifølge hvilket som helst av kravene 1-7 eller en farmasøytisk sammensetning ifølge hvilket som helst av kravene 8-9 for bruk i profylakse eller behandling av oppmerksomhetsunderskudd hyperaktivitetsforstyrrelse.
- 11.** Krystallinsk form B eller den farmasøytiske sammensetningen for bruk i profylaksen eller behandlingen av oppmerksomhetsunderskudd hyperaktivitetsforstyrrelse ifølge krav 10, hvori oppmerksomhetsunderskudd hyperaktivitetsforstyrrelsen er komorbid med depresjon, rusmisbruk eller angst.