

(12) BREVET D'INVENTION

- (11) N° de publication : **MA 52920 B1**
- (51) Cl. internationale : **A61K 31/444; C07D 401/06; A61P 25/06**
- (43) Date de publication : **30.11.2021**
-
- (21) N° Dépôt : **52920**
- (22) Date de Dépôt : **05.12.2017**
- (30) Données de Priorité : **06.12.2016 US 201662430662 P**
- (86) Données relatives à la demande internationale selon le PCT: **PCT/US2017/064652 05.12.2017**
- (71) Demandeur(s) : **CoLucid Pharmaceuticals, Inc., c/o Eli Lilly and Company Lilly Corporate Center Indianapolis, IN 46285 (US)**
- (72) Inventeur(s) : **ALLIERI, Brigida ; FAGAN, Paul ; SHARP, Emma ; SKWIERCZYNSKI, Raymond, D.**
- (74) Mandataire : **H&H IP LAW**
- (86) N° de dépôt auprès de l'organisme de validation: **EP17829372.6**
-
- (54) Titre : **COMPOSITIONS ET PROCÉDÉS SE RAPPORTANT À DES AGONISTES DE PYRIDINOYLPIPÉRIDINE 5-HT1F**
- (57) Abrégé : La présente invention concerne de nouveaux pseudo-polymorphes du sel d'hémisuccinate de 2,4,6-trifluoro-N-[6-(1-méthyl-pipéridine-4-carbonyl)-pyridin-2-yl]-benzamide qui sont utiles dans des compositions pharmaceutiques, par exemple, pour le traitement et la prévention de la céphalée migraineuse.

REVENDEICATIONS

1. Di-hydrate de sel hémisuccinate de 2,4,6-trifluoro-*N*-[6-(1-méthyl-
5 pipéridine-4-carbonyl)-pyridin-2-yl]-benzamide (Forme D) caractérisé par une
diffraction des rayons X comprenant des pics à 18,7, 26,5, 27,0, 27,5 et
27,8 degrés 2θ , +/- 0,2 degrés, en utilisant l'irradiation Cu- $K\alpha$.
2. Di-hydrate selon la revendication 1, la diffraction des rayons X
10 comprenant l'un ou plusieurs des pics additionnels suivants à 8,5, 9,7, 11,9,
13,8, 14,0, 15,4, 15,5, 15,8, 17,0, 17,3, 17,7, 18,0, 18,9, 19,3, 19,8, 20,0, 20,8,
21,4, 21,6, 21,9, 22,4, 22,7, 23,0, 24,1, 24,3, 24,7, 25,6, 25,9, 26,1, 26,4, 28,4,
29,1, 29,6, 29,8 ou 31,9 degrés 2θ en utilisant l'irradiation Cu- $K\alpha$.
- 15 3. Di-hydrate selon la revendication 1, caractérisé en outre en ce qu'il
présente des paramètres de cellule unique à 100 Kelvin d'environ $a = 25,08 \text{ \AA}$,
 $b = 10,08 \text{ \AA}$, $c = 20,84 \text{ \AA}$, $\alpha = 90^\circ$, $\beta = 123,71$, et d'angle $\gamma = 90^\circ$.
4. Di-hydrate selon la revendication 1, produit par un procédé comprenant
20 la granulation à l'état humide d'hémisuccinate de 2,4,6-trifluoro-*N*-[6-(1-méthyl-
pipéridine-4-carbonyl)-pyridin-2-yl]-benzamide amorphe.
5. Composition pharmaceutique comprenant le di-hydrate selon l'une
quelconque des revendications 1 à 4 et un support pharmaceutiquement
25 acceptable.
6. Composition pharmaceutique selon la revendication 5, ledit di-hydrate
étant sensiblement exempt d'impuretés.
- 30 7. Composition pharmaceutique selon la revendication 6, ledit di-hydrate
ayant une pureté chimique supérieure à 98,0 % telle que déterminée par CLHP.

8. Composition pharmaceutique selon la revendication 5, comprenant en outre une forme cristalline solide anhydre du sel hémisuccinate de 2,4,6-trifluoro-*N*-[6-(1-méthyl-pipéridine-4-carbonyl)-pyridin-2-yl]-benzamide (Forme A).

5

9. Di-hydrate selon l'une quelconque des revendications 1 à 4 pour l'utilisation dans le traitement de la migraine.