



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2431037 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/4545 (2006.01)
A61K 45/06 (2006.01)
A61P 3/00 (2006.01)
A61P 3/10 (2006.01)
A61P 25/00 (2006.01)
A61P 43/00 (2006.01)
C07D 453/02 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2017.03.06
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2016.11.30
(86)	European Application Nr.	11194142.3
(86)	European Filing Date	2008.08.01
(87)	The European Application's Publication Date	2012.03.21
(30)	Priority	2007.08.02, US, 953610 P 2007.08.02, US, 953613 P 2007.08.02, US, 953614 P 2007.09.12, US, 971654 P
(84)	Designated Contracting States:	AT BE BG CH CY CZ DE DK EE ES FI FR GB GR HR HU IE IS IT LI LT LU LV MC MT NL NO PL PT RO SE SI SK TR
	Designated Extension States:	AL BA MK RS
(62)	Divided application	EP2182949, filing date 2008.08.01
(73)	Proprietor	Attenua, Inc., 250 West 50th St., Suite 17H, New York, NY 10019, US-USA
(72)	Inventor	Mazurov, Anatoly A., 3704 Timberoak Drive, Greensboro, NC North Carolina 27410, US-USA Phillips, Teresa Y., 4713 Whitby Place, Greensboro, NC North Carolina 27406, US-USA
(74)	Agent or Attorney	Bryn Aarflot AS, Postboks 449 Sentrum, 0104 OSLO, Norge

(54)	Title	(2S,3R)-N-(2-((3-pyridinyl)methyl)-1-azabicyclo[2.2.2]oct-3-yl)benzofuran-2-carboxamide, novel salt forms, and methods of use thereof
(56)	References Cited:	WO-A-2004/076449 US-B2- 6 953 855 L.M. BROAD ET AL: "Selective alpha7 nicotinic receptor agents for the treatment of neuropsychiatric diseases", DRUGS OF THE FUTURE, vol. 32, no. 2, February 2007 (2007-02), page 161, XP055052022, ISSN: 0377-8282, DOI: 10.1358/dof.2007.032.02.1064020 HAUSER T A ET AL: "P.3.b.005 TC-5619: an a 7 neuronal nicotinic receptor-selective agonist with the potential to treat schizophrenia", EUROPEAN NEUROPSYCHOPHARMACOLOGY, ELSEVIER SCIENCE PUBLISHERS BV, AMSTERDAM, NL, vol. 16, 1 January 2006 (2006-01-01), page S394, XP027969832, ISSN: 0924-977X [retrieved on 2006-01-01]

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. Forbindelse som er (2S,3R)-N-(2-((3-pyridinyl)metyl-1-azabicyklo[2,2,2]okt-3-yl)benzofuran-2-karboksamid eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, i et enantiomert og diastereomert overskudd på 90% eller større i forhold til (2S,3S)-N-(2-((3-pyridinyl)metyl-1-azabicyklo[2,2,2]okt-3-yl)benzofuran-2-karboksamid eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, (2R,3S)-N-(2-((3-pyridinyl)metyl-1-azabicyklo[2,2,2]okt-3-yl)benzofuran-2-karboksamid eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav eller (2R,3R)-N-(2-((3-pyridinyl)metyl-1-azabicyklo[2,2,2]okt-3-yl)benzofuran-2-karboksamid eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor forbindelsen eller det farmasøytisk akseptable saltet derav er et syresalt av (2S,3R)-N-(2-((3-pyridinyl)metyl-1-azabicyklo[2,2,2]okt-3-yl)benzofuran-2-karboksamid, hvor syren er valgt fra gruppen bestående av svovelsyre, fosforsyre, maleinsyre, toluensulfonsyre, galaktarsyre (slimsyre), D-mandelsyre, D-vinsyre, metansulfonsyre, R- og S-10-kamfersulfonsyrer, ketoglutarsyre og hippursyre.
2. Forbindelse som er (2S,3R)-N-(2-((3-pyridinyl)metyl-1-azabicyklo[2,2,2]okt-3-yl)benzofuran-2-karboksamid eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge krav 1, i et enantiomert og diastereomert overskudd på 99% eller større.
3. Syresalt ifølge krav 1 eller 2, hvor støkiometrien av (2S,3R)-N-(2-((3-pyridinyl)metyl-1-azabicyklo[2,2,2]okt-3-yl)benzofuran-2-karboksamid i forhold til syren er 2:1, 1:1 eller 1:2.
4. Syresalt ifølge krav 3, hvor støkiometrien er 1:1.
5. Anvendelse av en forbindelse ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 4 ved fremstilling av et medikament for behandling eller forebygging av en sentralnervesystemlidelse, inflammasjon, smerte eller neovaskularisering.
6. Forbindelse ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 4 for anvendelse i behandling eller forebygging av en sentralnervesystemlidelse, inflammasjon, smerte eller neovaskularisering.
7. Anvendelse ifølge krav 5 eller forbindelse for anvendelse ifølge krav 6, hvor sentralnervesystemlidelsen er valgt fra mild kognitiv svekkelse, alder-assosiert

- hukommelsessvikt, pre-senil demens, tidlig inntreden av Alzheimers sykdom, senil demens, demens av Alzheimers type, Alzheimers sykdom, Lewy-legeme demens, mikroinfarktdemens, AIDS-relatert demens, HIV-demens, multiple cerebrale infarkt, Parkinsonisme, Parkinsons sykdom, Picks sykdom, progressiv supranukleær lammelse, Huntingtons chorea, tardiv dyskinesi, hyperkinesi, mani, oppmerksomhetssvikt, oppmerksomhets- og hyperaktivitetsforstyrrelse, angst, depresjon, dysleksi, schizofreni, kognitiv dysfunksjon ved schizofreni, depresjon, tvangsnevroselidelser eller Tourettes syndrom.
8. Anvendelse eller forbindelse for anvendelse ifølge krav 7, hvor sentralnervesystemlidelsen er valgt fra Alzheimers sykdom, mani, oppmerksomhetssvikt, oppmerksomhets- og hyperaktivitetsforstyrrelse, angst, dysleksi, schizofreni, kognitiv dysfunksjon ved schizofreni, depresjon, tvangsnevroselidelser eller Tourettes syndrom.
9. Anvendelse eller forbindelse for anvendelse ifølge krav 8, hvor sentralnervesystemlidelsen er schizofreni eller kognitiv dysfunksjon ved schizofreni.
10. Anvendelse eller forbindelse for anvendelse ifølge krav 8, hvor sentralnervesystemlidelsen er oppmerksomhetssvikt eller oppmerksomhets- og hyperaktivitetsforstyrrelse.
11. Farmasøytisk preparat omfattende forbindelsen ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 4 og én eller flere av en farmasøytisk akseptabel eksipiens eller bærer.