



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2445489 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/165 (2006.01)
A61K 31/167 (2006.01)
A61K 31/223 (2006.01)
A61K 31/40 (2006.01)
A61K 31/4453 (2006.01)
A61K 31/495 (2006.01)
A61K 31/5375 (2006.01)
A61P 25/32 (2006.01)
A61P 25/34 (2006.01)
A61P 25/36 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2020.02.03
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.10.30
(86)	European Application Nr.	10792277.5
(86)	European Filing Date	2010.06.10
(87)	The European Application's Publication Date	2012.05.02
(30)	Priority	2009.06.26, US, 492566
(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 ; SE ; SI ; SK ; SM ; TR
(73)	Proprietor	SK Biopharmaceuticals Co., Ltd., 99, Seorin-dong Jongro-gu, Seoul 110-728, Sør- Korea
(72)	Inventor	LEE, Sung James, 15 Aynsley Ct, Montville, NJ 07045, USA MELNICK, Susan, Marie, 130 New Rd Apt G8, Parsippany, NJ 07054, USA
(74)	Agent or Attorney	PLOUGMANN VINGTOFT, Postboks 1003 Sentrum, 0104 OSLO, Norge

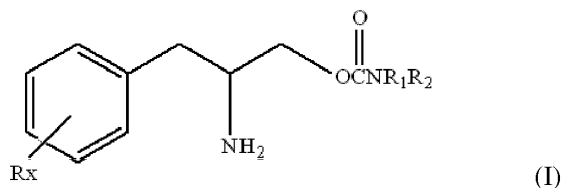
(54)	Title	COMPOSITIONS FOR TREATING DRUG ADDICTION AND IMPROVING ADDICTION-RELATED BEHAVIOR
------	-------	--

(56)	References Cited:	WO-A1-2006/133393 US-A- 5 756 817 WO-A1-98/15526 KR-A- 19980 026 988 US-A1- 2005 080 268 WO-A1-98/17636 WO-A1-2007/018496
------	----------------------	---

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. Sammensetning for bruk i behandling av en medikamentavhengighet omfattende en terapeutisk effektiv mengde av en karbamat-forbindelse, eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller ester derav, som en aktiv ingrediens, hvor det avhengige stoffet er kokain, og hvor karbamat-forbindelsen er valgt fra gruppen bestående av karbamat-forbindelsen med den strukturelle formelen (1)



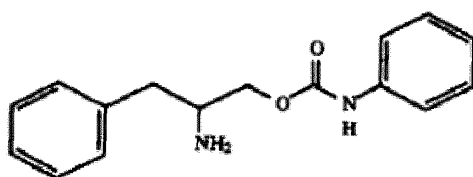
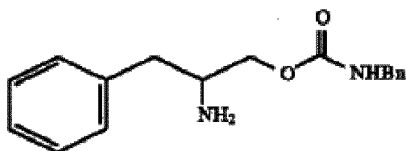
hvor,

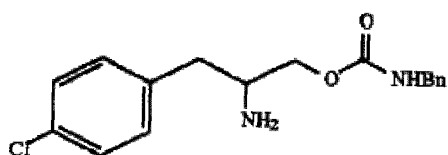
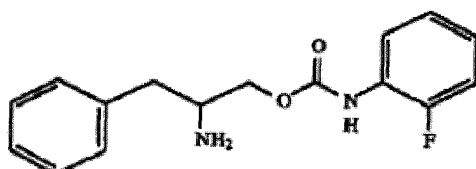
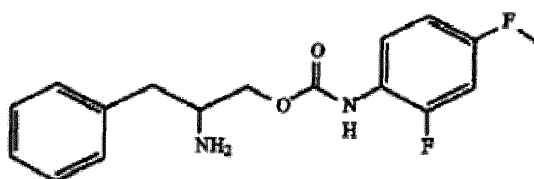
R er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, lavere alkyl med 1 til 8 karbonatomer, halogen valgt fra F, Cl, Br og I, alkoksy med 1 til 3 karbonatomer, nitrogruppe, hydroksey, trifluormetyl og tioalkoksy fra 1 til 3 karbonatomer, x er et helt tall fra 1 til 3, med forbehold om at R kan være den like eller være forskjellig når x er 2 eller 3,

R₁ og R₂ kan være den like eller være forskjellige fra hverandre og er uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydrogen, lavere alkyl med 1 til 8 karbonatomer, eller sykloalkyl med 3 til 7 karbonatomer, og

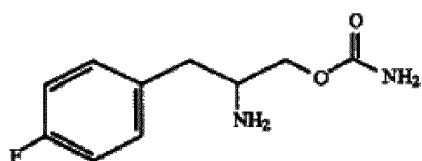
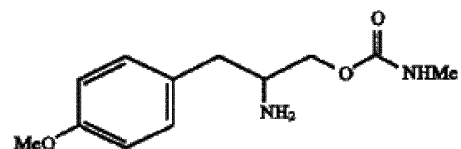
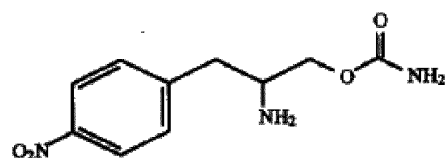
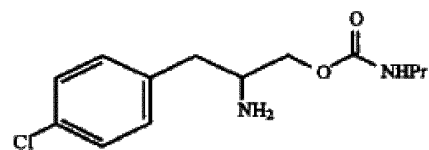
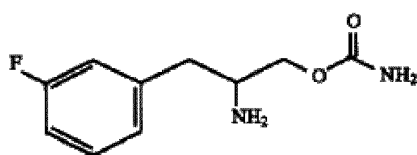
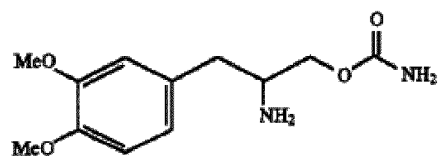
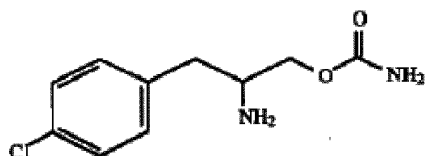
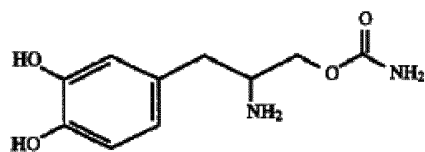
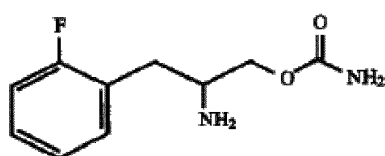
R₁ og R₂ kan forbindes for å danne en 5- til 7-leddet heterosyklus som er substituert med et medlem valgt fra gruppen bestående av hydrogen, alkyl og arylgrupper, hvor den heterosykliske forbindelsen omfatter 1 til 2 nitrogenatomer og 0 til 1 oksygenatom, og nitrogenatomene er ikke direkte forbundet med hverandre eller med oksygenatomet; og

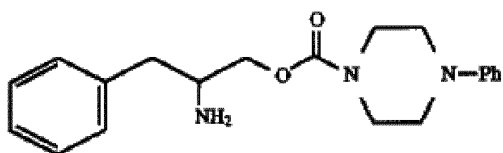
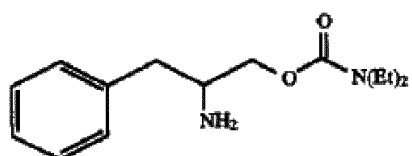
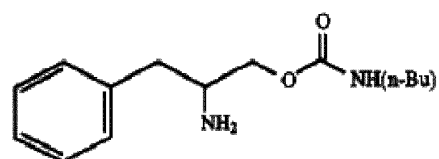
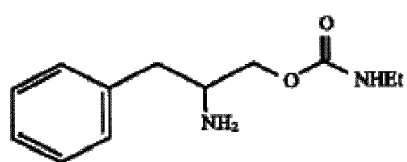
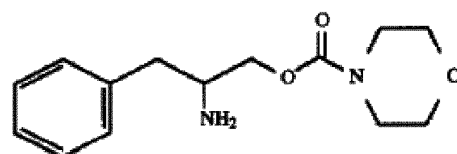
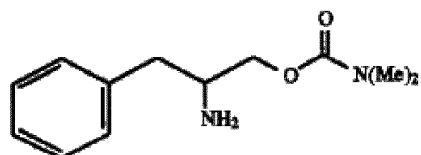
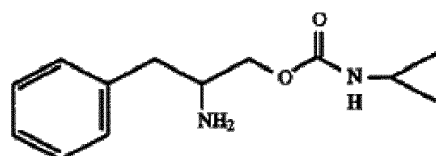
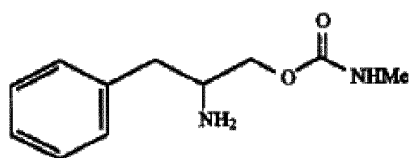
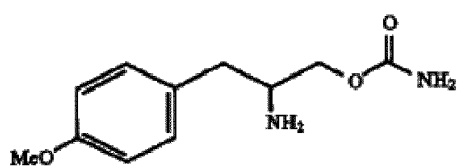
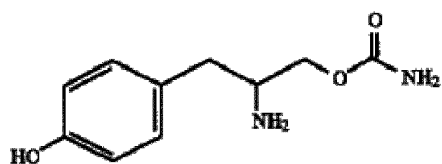
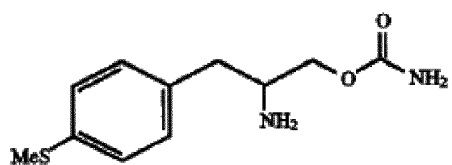
forbindelsene representert ved de følgende strukturene:

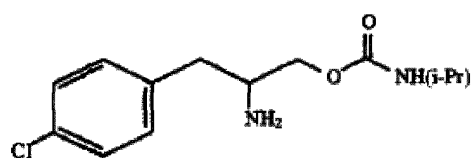
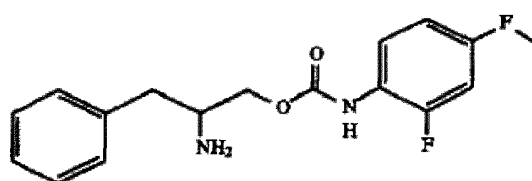
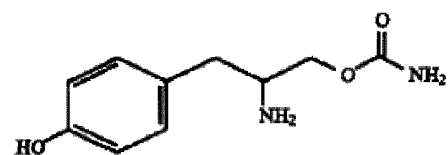
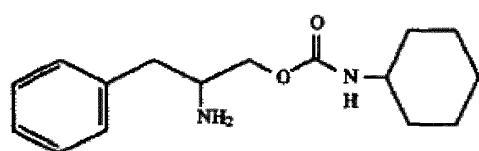
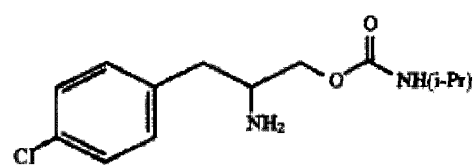
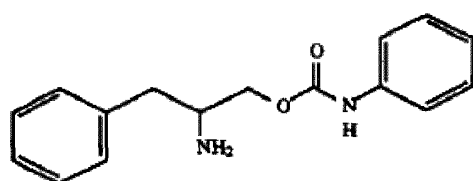
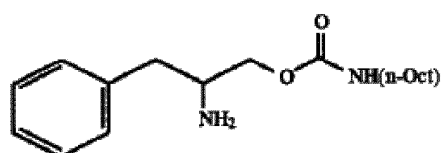
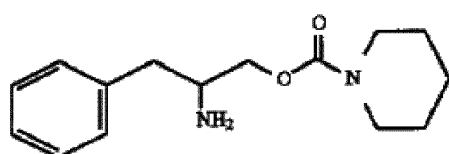
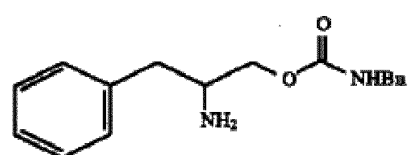
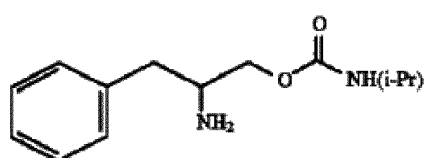
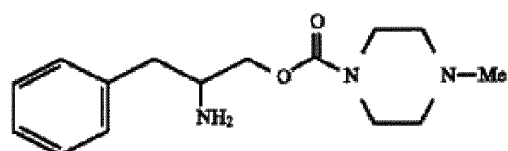
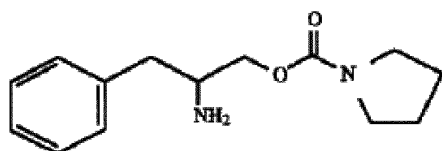
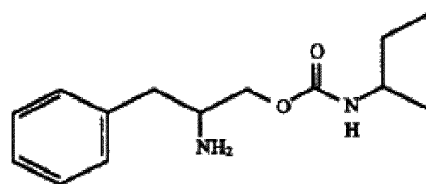
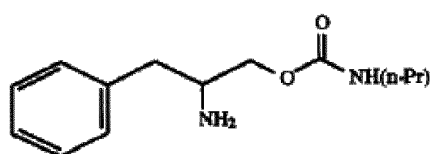


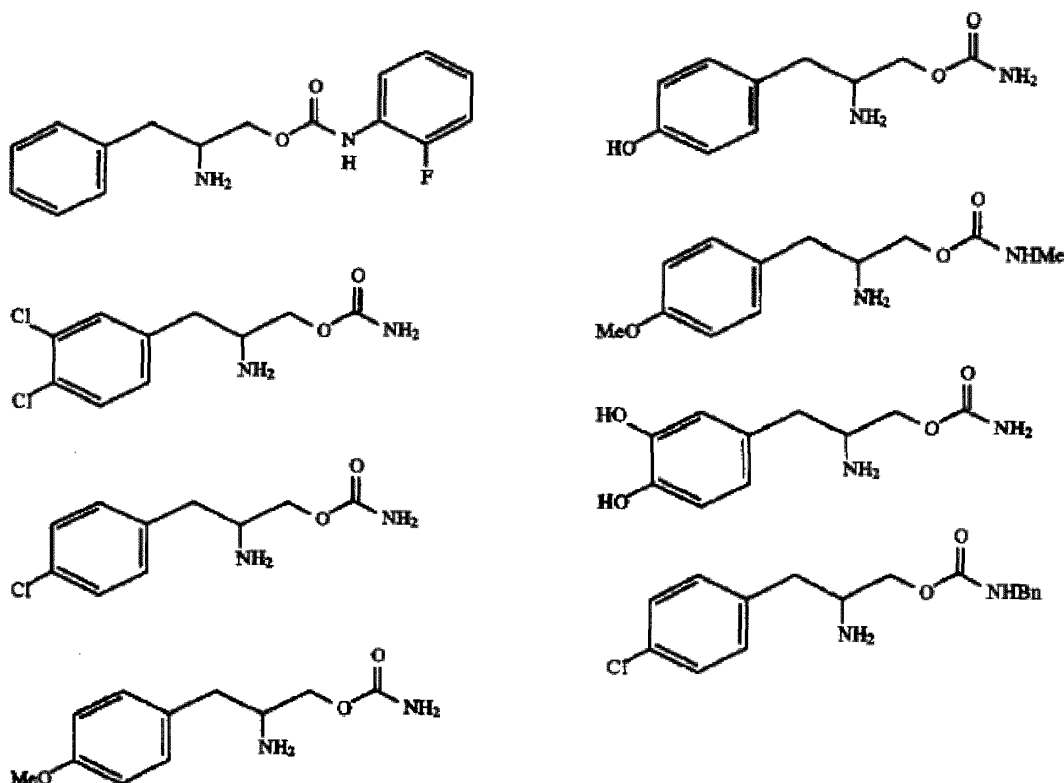


2. Sammensetning for bruk ifølge krav 1, hvor forbindelsen er representert ved den følgende strukturen:

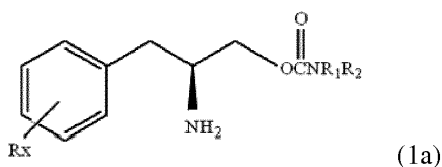








3. Sammensetningen for bruk ifølge krav 1, hvor R er hydrogen og $x = 1$.
4. Sammensetningen for bruk ifølge krav 1, hvor R, R₁ og R₂ er hydrogen og $x = 1$.
5. Sammensetningen for bruk ifølge krav 1, hvor forbindelsen som har strukturell formel (1) er en enantiomer som i det vesentlige er fri av andre enantiomerer eller en enantiomer blanding hvor en enantiomer av forbindelsen som har strukturell formel (1) er dominerende.
6. Sammensetningen for bruk ifølge krav 5, hvor enantiomeren er (S) eller (L) enantiomer som representert med Strukturformel (1a):



hvor,

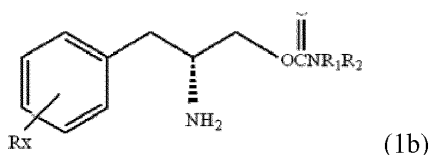
R er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, lavere alkyl med 1 til 8 karbonatomer, halogen valgt fra F, Cl, Br og I, alkoksy med 1 til 3 karbonatomer, nitrogruppe, hydroksy, trifluormetyl og tioalkoksy fra 1 til 3 karbonatomer; x er et helt tall fra 1 til 3, med forbehold om at R kan være den like eller være forskjellig når x er 2 eller 3;

R_1 og R_2 kan være like eller være forskjellige fra hverandre og er uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydrogen, lavere alkyl med 1 til 8 karbonatomer, eller sykloalkyl med 3 til 7 karbonatomer;

R_1 og R_2 kan forbindes for å danne en 5- til 7-leddet heterosyklus som er substituert med et medlem valgt fra gruppen bestående av hydrogen, alkyl og arylgrupper, hvor den heterosykliske forbindelsen omfatter 1 til 2 nitrogenatomer og 0 til 1 oksygenatom, og nitrogenatomene er ikke direkte forbundet med hverandre eller med oksygenatomet.

7. Sammensetningen for bruk ifølge krav 6, hvor R_x , R_1 og R_2 er hydrogen og x er 1.

8. Sammensetningen for bruk ifølge krav 5, hvor enantiomeren er (R) eller (D) enantiomer, som representert med Strukturformel (1b).



hvor,

R er valgt fra gruppen bestående av hydrogen, lavere alkyl med 1 til 8 karbonatomer, halogen valgt fra F, Cl, Br og I, alkoksy med 1 til 3 karbonatomer, nitrogruppe, hydrokso, trifluormetyl og tioalkoksy fra 1 til 3 karbonatomer; x er et helt tall fra 1 til 3, med forbehold om at R kan være den like eller være forskjellig når x er 2 eller 3;

R_1 og R_2 kan være like eller være forskjellige fra hverandre og er uavhengig valgt fra gruppen bestående av hydrogen, lavere alkyl med 1 til 8 karbonatomer, eller sykloalkyl med 3 til 7 karbonatomer;

R_1 og R_2 kan forbindes for å danne en 5- til 7-leddet heterosyklus som er substituert med et medlem valgt fra gruppen bestående av hydrogen, alkyl og arylgrupper, hvor den heterosykliske forbindelsen omfatter 1 til 2 nitrogenatomer og 0 til 1 oksygenatom, og nitrogenatomene er ikke direkte forbundet med hverandre eller med oksygenatomet.

9. Sammensetningen for bruk ifølge et hvilket som helst av kravene 5 til 8, hvor en enantiomer er dominerende i en grad av omtrent 90% eller mer.

10. Sammensetningen for bruk ifølge krav 9, hvor en enantiomer er dominerende i en grad av omtrent 98% eller mer.

11. Sammensetningen for bruk ifølge krav 8, hvor enantiomeren er (R)-(beta-amino-benzenpropyl)karbamat.
12. Sammensetningen for bruk ifølge krav 11, hvor enantiomeren av (R)-(beta-amino-benzenpropyl)karbamat er dominerende i en grad av omtrent 90% eller mer.
13. Sammensetningen for bruk ifølge krav 12, hvor enantiomeren av (R)-(beta-amino-benzenpropyl)karbamat er dominerende i en grad av omtrent 98% eller mer.
14. Sammensetningen for bruk ifølge krav 1, hvor den terapeutisk effektive mengden av forbindelsen er fra ca. 0,01 mg / kg / dose til ca. 300 mg / kg / dose.