



(12) Translation of
european patent specification

(11) NO/EP 2522668 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 471/08 (2006.01)
A61K 31/439 (2006.01)
A61P 11/14 (2006.01)
C07B 59/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2015.07.13
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2015.02.25
(86)	European Application Nr.	12176544.0
(86)	European Filing Date	2008.04.30
(87)	The European Application's Publication Date	2012.11.14
(30)	Priority	2007.05.01, US, 915130 P 2007.05.08, US, 916662 P 2007.09.28, US, 976044 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
(73)	Proprietor	CONCERT PHARMACEUTICALS, INC., 99 Hayden Avenue, Suite 100, Lexington, MA 02421, US-USA
(72)	Inventor	Tung, Roger, 99 Hayden Avenue Suite 100, Lexington, MA 02421, US-USA
(74)	Agent or Attorney	Tandbergs Patentkontor AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

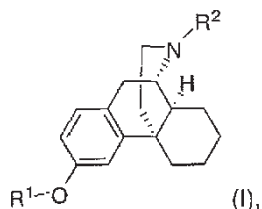
(54) Title **Morphinan compounds**

(56) References
Cited: G. HEINKELE ET. AL.: "Synthesis of [2H3]-dextromethorphan and its major urinary metabolites [2H3]-dextrorphan and [2H3]-dextrorphan-beta-glucoronide", JOURNAL OF LABELLED COMPOUNDS AND RADIOPHARMACEUTICALS, vol. 45, 2002, pages 1153-1158, XP002490642,
T.H. EICHHOLD ET. AL.: "Highly sensitive high-peformance liquid chromatographic-tandem mass spectrometric method for the analysis of dextromorphan in human plasma.", JOURNAL OF CHROMATOGRAPHY B, vol. 698, 1997, pages 147-154, XP002490644,
G. HEINKELE ET. AL.: "Synthesis of [2H]-labelled phase I metabolites using 1-[2H]-pyridinium hydrochloride.", JOURNAL OF LABELLED COMPOUNDS AND RADIOPHARMACEUTICALS, vol. 48, 2005, pages 457-461, XP002490645,
H. BÖLCSKEI ET. AL.: "Synthesis of deuterated dextromethorphan derivatives.", ARKIVOK, vol. 2008, no. iii, 1 March 2008 (2008-03-01), pages 182-193, XP002490643,

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. En forbindelse med formel I:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori:

R^1 er CD_3 ; og
 R^2 er CH_3 ;

for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling eller diagnose av menneskekroppen eller dyrekroppen.

2. Forbindelse eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for anvendelse ifølge krav 1, karakterisert ved et hvilken som helst atom som ikke er utpekt som deuterium er til stede på dens naturlige isotopiske overflod.

3. Pyrogenfri sammensetning omfattende forbindelsen eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav ifølge hvilket som helst av de foregående krav, og en akseptabel bærer.

4. Sammensetning ifølge krav 3, formulert for farmasøytisk administrering, og der bæreren er en farmasøytisk akseptabel bærer.

5. Sammensetning ifølge krav 3 eller 4, ytterligere omfattende et andre terapeutisk middel nyttig for behandling eller forebyggelse av en sykdom eller tilstand valgt fra emosjonell labilitet; pseudobulbær affekt; autisme; nevrologiske lidelser; nevrodegenerative sykdommer; hjerneskade; bevissthetsforstyrrelseslidelser; hjerte- og karsykdommer; glaukom; tardiv dyskinesi; diabetisk nevropati; retinopatiske sykdommer; sykdommer eller forstyrrelser forårsaket av homocystein-indusert apoptose; sykdommer eller lidelser forårsaket av forhøyede nivåer av homocystein; kronisk smerte; intraktable smerte; nevropatisk smerte; sympatisk mediert smerte; smerte forbundet med gastrointestinal dysfunksjon; epileptiske anfall; tinnitus;

seksuell dysfunksjon; intraktabel hoste; dermatitt; avhengighetsforstyrrelser; Retts syndrom (RTT); taleforstyrrelser som skyldes ukontrollert laryngeale muskelspasmer; metotreksatneurotoksisitet; og tretthet forårsaket av kreft.

6. Blanding ifølge krav 5, karakterisert ved at det andre terapeutiske middel er valgt fra kinidin, kinidinsulfat, oksykodon og gabapentin.

7. Separate doseringsformer:

- (i) en forbindelse, farmasøytisk akseptabelt salt derav eller et preparat ifølge hvilket som helst av kravene 1-4; og
- (ii) et andre terapeutisk middel nyttig for behandling eller forebyggelse av en sykdom eller tilstand valgt fra emosjonell labilitet; pseudobulbær affekt; autisme; nevrologiske lidelser; nevrodegenerative sykdommer; hjerneskade; bevissthetsforstyrrelseslidelser; hjerte- og karsykdommer; glaukom; tardiv dyskinesi; diabetisk nevropati; retinopatiske sykdommer; sykdommer eller forstyrrelser forårsaket av homocystein-indusert apoptose; sykdommer eller lidelser forårsaket av forhøyede nivåer av homocystein; kronisk smerte; intraktabel smerte; nevropatisk smerte; sympatisk mediert smerte; smerte forbundet med gastrointestinal dysfunksjon; epileptiske anfall; tinnitus; seksuell dysfunksjon; intraktabel hoste; dermatitt; avhengighetsforstyrrelser; Retts syndrom (RTT); taleforstyrrelser som skyldes ukontrollert laryngeale muskelspasmer; metotreksatneurotoksisitet; og tretthet forårsaket av kreft,

karakterisert ved at nevnte forbindelse, farmasøytisk akseptabelt salt derav eller sammensetning og et andre terapeutiske middel, er forbundet med hverandre.

8. Separate doseringsformer ifølge krav 7, karakterisert ved at nevnte andre terapeutiske middel er valgt fra kinidin, kinidinsulfat, oksykodon og gabapentin.

9. En pakke som omfatter separate doseringsformer ifølge krav 7 eller 8.

10. Separate doseringsformer eller en pakke ifølge hvilket som helst av kravene 7-9, karakterisert ved at nevnte andre middel er for samtidig administrering.

11. Separate doseringsformer eller en pakke ifølge til hvilket som helst av kravene 7-9, karakterisert ved at nevnte andre middel for separat administrering.

12. Sammensetningen, separate doseringsformer eller pakke ifølge hvilket som helst av kravene 5-11, som omfatter 10-60 mg av forbindelsen med formel I eller farmasøytisk akseptabelt salt derav, og 2,5-30 mg kinidin.