



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3151832 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/437 (2006.01)
A61P 25/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.08.30
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.03.24
(86)	European Application Nr.	15803364.7
(86)	European Filing Date	2015.06.03
(87)	The European Application's Publication Date	2017.04.12
(30)	Priority	2014.06.06, US, 201462008939 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
(73)	Proprietor	Ovid Therapeutics, Inc., 1460 Broadway, New York, NY 10036, USA
(72)	Inventor	DURING, Matthew, 14 Cedar Lane, Weston, CT 06883, USA
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54)	Title	METHODS OF INCREASING TONIC INHIBITION AND TREATING SECONDARY INSOMNIA
(56)	References Cited:	US-A- 5 929 065 US-A1- 2005 137 222 DE-A1-102005 020 882 US-A1- 2011 046 090 K. EGAWA ET AL: "Decreased Tonic Inhibition in Cerebellar Granule Cells Causes Motor Dysfunction in a Mouse Model of Angelman Syndrome", SCIENCE TRANSLATIONAL MEDICINE, vol. 4, no. 163, 5 December 2012 (2012-12-05), pages 163ra157-1, XP055242013, US ISSN: 1946-6234, DOI: 10.1126/scitranslmed.3004655 JOSE LUIS OLMOS-SERRANO ET AL: "The GABA_A Receptor Agonist THIP Ameliorates Specific Behavioral Deficits in the Mouse Model of Fragile X Syndrome", DEVELOPMENTAL NEUROSCIENCE., vol. 33, no. 5, 1 January 2011 (2011-01-01), pages 395- 403, XP055349321, ISSN: 0378-5866, DOI: 10.1159/000332884

EGAWA, K ET AL.: 'Decreased Tonic Inhibition in Cerebellar Granule Cells Causes Motor Dysfunction in a Mouse Model of Angelman Syndrome' SCI TRANSL MED, [Online] vol. 4, no. 163, 10 January 2012, XP055242013 Retrieved from the Internet: <URL:http://www.ovidrx.com/wp-content/theme s/ovid-theme/pdfs/combined_elucidating_tonic_inhibibon.pdt> <DOI: 10.1126/scitranslmed.3004655> [retrieved on 2015-07-25]

WALSH, JK ET AL.: 'The Selective Extrasynaptic GABAA Agonist, Gaboxadol, Improves Traditional Hypnotic Efficacy Measures and Enhances Slow Wave Activity in a Model of Transient Insomnia' SLEEP, [Online] vol. 30, no. 5, 2007, pages 593 - 602, XP055242020 Retrieved from the Internet: <URL:http://www.researchgate.net/publication/6285087_The_selective_extrasynaptic_GABAA_agonist_gaboxadol_improves_traditional_hypnotic_efficacy_measures_and_enhances_slow_wave_activity_in_a_model_of_transient_insomnia> [retrieved on 2015-07-25]

WALSH ET AL: "The Selective Extrasynaptic GABAA Agonist, Gaboxadol, Improves Traditional Hypnotic Efficacy Measures and Enhances Slow Wave Activity in a Model of Transient Insomnia", SLEEP, vol. 30, no. 5, 1 January 2007 (2007-01-01), pages 593-602, XP055242020, OLMOS-SERRANO, JL ET AL.: 'Defective GABAergic Neurotransmission and Pharmacological Rescue of Neuronal Hyperexcitability in the Amygdala in a Mouse Model of Fragile X Syndrome' THE JOURNAL OF NEUROSCIENCE, [Online] vol. 30, no. 29, 2010, pages 9929 - 9938, XP055123397 Retrieved from the Internet: <URL:http://www.jneurosci.org/content/30/29/9929.full.pdf+html> [retrieved on 2015-07-25]

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. Farmasøytisk sammensetning omfattende en effektiv mengde av 4,5,6,7-tetrahydroisoksazolo(5,4-c)pyridin-3-ol (THIP) eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav og en farmasøytisk akseptabel bærer eller hjelpestoff for anvendelse i en fremgangsmåte for å behandle et menneske med fragilt X-syndrom i en daglig dose av THIP eller farmasøytisk akseptabelt salt derav på mellom 1 mg og 10 mg.
2. Sammensetningen for anvendelse ifølge krav 1, hvori THIP eller farmasøytisk akseptabelt salt derav er det eneste aktive midlet.
3. Sammensetningen for anvendelse ifølge krav 2, hvori den farmasøytiske sammensetningen består av en effektiv mengde av THIP eller farmasøytisk akseptabelt salt derav og én eller flere farmasøytisk akseptable bærere eller hjelpestoffer.
4. Sammensetningen for anvendelse ifølge et hvilket som helst foregående krav, hvori den farmasøytiske sammensetningen formuleres for forlenget frigjøring.
5. Sammensetningen for anvendelse ifølge et hvilket som helst foregående krav, hvori sammensetningen administreres én gang hver 24.–48. time.
6. Sammensetningen for anvendelse ifølge et hvilket som helst foregående krav, hvori administreringsveien er transdermal administrering.
7. Sammensetningen for anvendelse ifølge krav 6, hvori administrering omfatter å bringe et transdermalt plaster omfattende den farmasøytiske sammensetningen i kontakt med huden til individet.
8. Sammensetningen for anvendelse ifølge et hvilket som helst foregående krav, hvori sammensetningen administreres om morgenen eller kvelden.
9. Sammensetningen for anvendelse ifølge et hvilket som helst foregående krav, hvori administreringsveien er intravenøs administrering.

10. Sammensetningen for anvendelse ifølge krav 9, hvori administreringsraten av THIP eller farmasøytisk akseptabelt salt derav er 0,001 mg/kg per time til 1 mg/kg per time.