



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3245217 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07J 41/00 (2006.01)
A61K 31/57 (2006.01)
A61P 25/00 (2006.01)
A61P 25/28 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2020.02.10
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.10.02
(86)	European Application Nr.	16704468.4
(86)	European Filing Date	2016.01.11
(87)	The European Application's Publication Date	2017.11.22
(30)	Priority	2015.01.12, SE, 1500018
(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	Umecrine Cognition AB, Karolinska Institutet Science Park Fogdevreten 2, 171 65 Solna, Sverige
(72)	Inventor	BÄCKSTRÖM, Torbjörn, Sofiehemsvägen 73A, SE-907 38 Umeå, Sverige RAGAGNIN, Gianna, Jakob Grubbs väg 17, SE-903 55 Umeå, Sverige
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

(54)	Title	3.ALPHA.-ETHYNYL, 3.BETA.-HYDROXY-5.ALPHA.-PREGNAN-20-OXIME FOR USE IN THE TREATMENT OF CNS DISORDERS
(56)	References Cited:	WO-A1-2009/142594 WO-A1-2008/063128

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. 3 α -etynyl, 3 β -hydroksy, 5 α -pregnan-20-oksim eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

2. Farmasøytisk formulering som omfatter en forbindelse som definert i krav 1, i tilsetning med en farmasøytisk akseptabel adjuvans, fortynningsmiddel eller bærer.

3. Forbindelse som definert i krav 1, for anvendelse i terapi.

4. Forbindelse som definert i krav 1, for anvendelse i en metode for behandling av:

(a) en steroid-relatert CNS-lidelse;

(b) et forhold eller av symptomer forårsaket av toleranseutvikling etter eksponering for 3-alfa-hydroksy-5-alfa/beta-steroider;

(c) et forhold som er påvirket av avvenning/abstinens av eksponering for 3-alfa-hydroksy-5-alfa/beta-steroider;

(d) én eller flere bivirkninger av et anti-inflammatorisk steroid;

(e) én eller flere bivirkninger av postmenopausal terapi; og/eller

(f) én eller flere bivirkninger av et oralt prevensjonsmiddel.

5. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 4, hvori den steroid-relaterte CNS-lidelsen er valgt fra gruppen epilepsi, menstruasjonssyklusavhengig epilepsi, depresjon, stressrelatert depresjon, migrene, tretthet og spesielt stressrelatert tretthet, premenstruelt syndrom, premenstruell dysforisk lidelse, menstruasjonssyklusbundne humørendringer, minimal kognitiv svikt, kognitiv svikt, menstruasjonssyklusbundne hukommelsesendringer, stressrelaterte hukommelsesendringer, stressrelaterte lærevanskeligheter, hepatisk encefalopati, Downs syndrom, Alzheimers sykdom, menstruasjonssyklusbundne konsentrasjonsvanskeligheter, menstruasjonssyklusbundne soveforstyrrelser og tretthet, økt appetitt, overspising og obesitet, tilbakefall av alkohol og substansmisbruk, balanseforstyrrelser, bevegelsesforstyrrelser og koordinasjonsvanskeligheter.

6. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 5, hvori lidelsen er hepatisk encefalopati.

7. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 6, hvori den hepatiske encefalopati er Type A hepatisk encefalopati, Type B hepatisk encefalopati, Type C hepatisk encefalopati, minimal hepatisk encefalopati eller åpen hepatisk encefalopati.

5 **8.** Forbindelse for anvendelse ifølge krav 5, hvori lidelsen er Downs syndrom eller Alzheimers sykdom.

9. Kombinasjonsprodukt som omfatter:

(A) en forbindelse som definert i krav 1; og

10 (B) minst ett annet terapeutisk middel som er nyttig i behandlingen av en steroid-relatert CNS-lidelse,
hvor i hver av bestanddeler (A) og (B) er formulert i tilsetning med en farmasøytisk akseptabel adjuvans, fortynningsmiddel eller bærer.

15 **10.** Kombinasjonsprodukt ifølge krav 9 som omfatter en farmasøytisk formulering som inkluderer en forbindelse som definert i krav 1, minst ett annet terapeutisk middel som er nyttig i behandlingen av en steroid-relatert CNS-lidelse, og en farmasøytisk akseptabel adjuvans, fortynningsmiddel eller bærer.

20 **11.** Kombinasjonsprodukt ifølge krav 9 som omfatter et sett deler som omfatter bestanddeler:

(a) en farmasøytisk formulering som omfatter en forbindelse med formel I som definert i krav 1, i tilsetning med en farmasøytisk akseptabel adjuvans, fortynningsmiddel eller bærer; og

25 (b) en farmasøytisk formulering som omfatter minst ett annet terapeutisk middel som er nyttig i behandlingen av en steroid-relatert CNS-lidelse, i tilsetning med en farmasøytisk akseptabel adjuvans, fortynningsmiddel eller bærer,
hvilke bestanddeler (a) og (b) hver er tilveiebrakt i en form som er egnet for administrering sammen med den andre.

30

12. Fremgangsmåte for fremstillingen av en forbindelse med formel I som definert i krav 1, hvilken fremgangsmåte omfatter reaksjon av 3 α -etynyl, 3 β -hydroksy, 5 α -pregnan-20-one med hydroksylamin.

35 **13.** Fremgangsmåte for fremstillingen av en farmasøytisk formulering som definert i krav 2, hvilken fremgangsmåte omfatter å sammenslutte en forbindelse

som definert i krav 1 med en farmasøytisk akseptabel adjuvans, fortynningsmiddel eller bærer.

- 5 **14.** Fremgangsmåte for fremstillingen av et kombinasjonsprodukt som definert i et hvilket som helst av kravene 9 til 11, hvilken fremgangsmåte omfatter å sammenslutte en forbindelse som definert i krav 1, med det andre terapeutiske middelet som er nyttig i behandlingen av en steroid-relatert CNS-lidelse, og minst én farmasøytisk akseptabel adjuvans, fortynningsmiddel eller bærer.