



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 3256466 B1

NORWAY

(19) NO  
(51) Int Cl.  
**C07D 405/14 (2006.01)**  
**A61K 31/353 (2006.01)**  
**A61K 31/4025 (2006.01)**  
**A61P 25/00 (2006.01)**  
**C07D 405/04 (2006.01)**  
**C07D 413/14 (2006.01)**  
**C07D 493/04 (2006.01)**

**Norwegian Industrial Property Office**

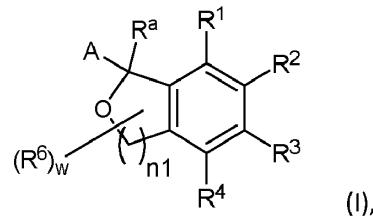
---

(45)	Translation Published	2022.05.02
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2022.04.06
(86)	European Application Nr.	16708262.7
(86)	European Filing Date	2016.02.11
(87)	The European Application's Publication Date	2017.12.20
(30)	Priority	2015.02.11, US, 201562115064 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	Sunovion Pharmaceuticals Inc., 84 Waterford Drive, Marlborough, MA 01752-7010, USA PGI Drug Discovery LLC, 215 College Road, Paramus, NJ 07652, USA
(72)	Inventor	XIE, Linghong, c/o Sunovion Pharmaceuticals Inc. 84 Waterford Drive, Marlborough, Massachusetts 01752-7010, USA JONES, Philip Glyn, c/o Sunovion Pharmaceuticals Inc. 84 Waterford Drive, Marlborough, Massachusetts 01752-7010, USA SPEAR, Kerry L., c/o Sunovion Pharmaceuticals Inc. 84 Waterford Drive, Marlborough, Massachusetts 01752-7010, USA POWELL, Noel Aaron, c/o Sunovion Pharmaceuticals Inc. 84 Waterford Drive, Marlborough, Massachusetts 01752-7010, USA HANANIA, Taleen G., c/o PGI Drug Discovery LLC 765 Old Saw Mill River Road, Tarrytown, New York 10591, USA ALEXANDROV, Vadim, c/o PGI Drug Discovery LLC 765 Old Saw Mill River Road, Tarrytown, New York 10591, USA
(74)	Agent or Attorney	Nordic Patent Service A/S, Bredgade 30, 1260 KØBENHAVN K, Danmark
(54)	Title	<b>1-HETEROCYCLYL ISOCHROMANYL COMPOUNDS AND ANALOGS FOR TREATING CNS DISORDERS</b>
(56)	References Cited:	WO-A1-2014/106238 TOFFANO M ET AL: "Asymmetric routes towards polyfunctionalized pyrrolidines: application to the synthesis of alkaloid analogues", TETRAHEDRON ASYMMETRY, PERGAMON PRESS LTD, OXFORD, GB, vol. 14, no. 21, 31 October 2003 (2003-10-31), pages 3365-3370, XP004468552, ISSN: 0957-4166, DOI: 10.1016/S0957-4166(03)00592-5

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/>

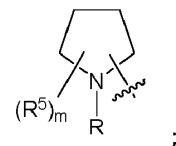
## PATENTKRAV

## 1. Forbindelse med formel I:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvori:

5 A er



m er 0, 1 eller 2;

n1 er 2;

R er -H eller C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>alkyl;

10 R<sup>a</sup> er -H eller C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>alkyl;

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> og R<sup>4</sup> er uavhengig -H, halogen, -OH, -NH<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>alkyl, -OR<sup>7</sup>, -NHR<sup>7</sup>, -N(R<sup>7</sup>)R<sup>7</sup>, -CN, fenyl eller 5- eller 6-leddet heteroaryl, hvori:

hver forekomst av R<sup>7</sup> uavhengig er usubstituert C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>alkyl eller C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>alkyl substituert med 1–3 halogen,

15 hver forekomst av C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>alkyl uavhengig er usubstituert eller substituert med 1–3 halogen,

og

fenylet eller heteroarylet er usubstituert eller substituert med 1 eller 2 grupper

uavhengig valgt fra halogen, -OH, -OCH<sub>3</sub>, -OCF<sub>3</sub>, -NH<sub>2</sub>, -NH(CH<sub>3</sub>), -N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>3</sub>, etyl,

20 -CF<sub>3</sub> og -CN,

eventuelt hvor

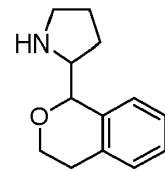
to tilstøtende tilfeller av R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> og R<sup>4</sup> sammen danner -O-CH<sub>2</sub>-O-, -O-CH(CH<sub>3</sub>)-O-, -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-O-, -O-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-O- eller -O-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-O-;

hver forekomst av R<sup>5</sup> uavhengig er halogen, -CH<sub>3</sub> eller etyl;

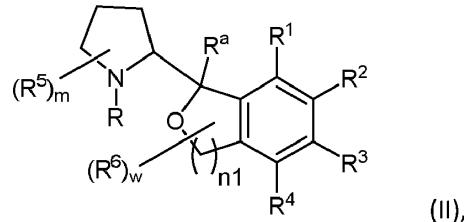
25 hver forekomst av R<sup>6</sup> uavhengig er halogen, -CH<sub>3</sub>, etyl eller -OH; og

w er 0, 1 eller 2;

forutsatt at forbindelsen ikke er:

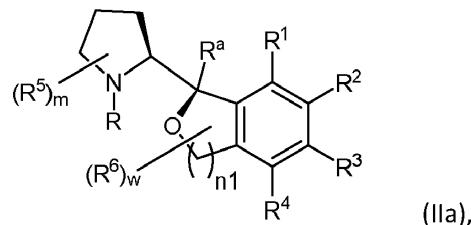


2. Forbindelsen ifølge krav 1 med formel (II):



5      eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

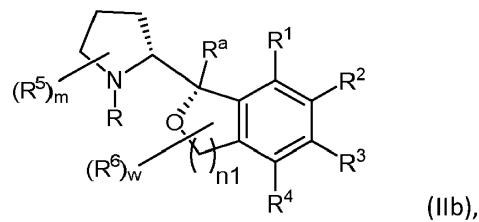
3. Forbindelsen ifølge krav 2 med formel (IIa):



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

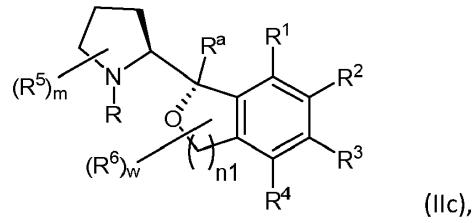
10

4. Forbindelsen ifølge krav 2 med formel (IIb):



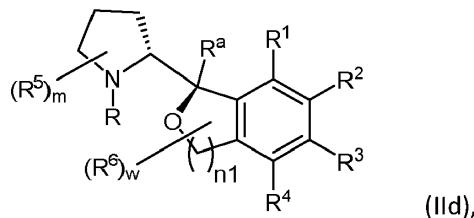
eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

15    5. Forbindelsen ifølge krav 2 med formel (IIc):



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

6. Forbindelsen ifølge krav 2 med formel (IId):



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

5 7. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1–6, eller et farmasøytisk  
akseptabelt salt derav, hvor minst to av  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  og  $R^4$  er -H eller hvor minst tre av  $R^1$ ,  $R^2$ ,  
 $R^3$  og  $R^4$  er -H.

10 8. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1–7, eller et farmasøytisk  
akseptabelt salt derav, hvor  $R^a$  er -H.

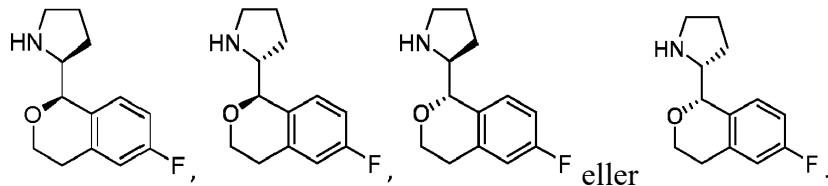
9. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1–8, eller et farmasøytisk  
akseptabelt salt derav, hvor  $R$  er -H.

15 10. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1–9, eller et farmasøytisk  
akseptabelt salt derav, hvor  $m$  er 0 og/eller hvor  $w$  er 0.

20 11. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1–10, eller et farmasøytisk  
akseptabelt salt derav, hvor  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  og  $R^4$  er uavhengig -H, halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>alkyl, -OR<sup>7</sup> eller  
-CN.

12. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1–11, eller et farmasøytisk  
akseptabelt salt derav, hvor  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  og  $R^4$  er uavhengig -H, -F, -CH<sub>3</sub>, -OCH<sub>3</sub> eller -CN.

25 13. Forbindelsen ifølge krav 1, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, valgt fra:



- 14.** Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1–3, eller 7–13, hvori forbindelsen er:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

5

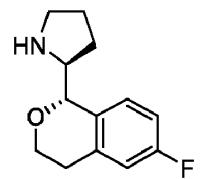
- 15.** Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1, 2, 6 eller 7–13, hvori forbindelsen er:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

10

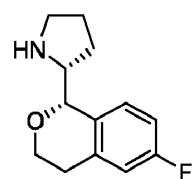
- 16.** Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1, 2, 5 eller 7–13, hvori forbindelsen er:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

15

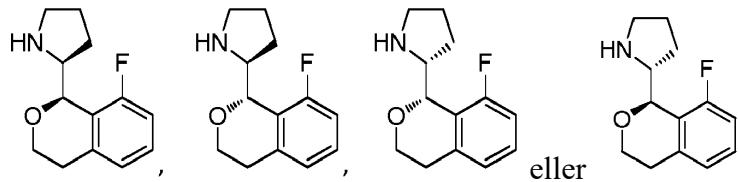
- 17.** Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1, 2, 4 eller 7–13, hvori forbindelsen er:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

20

- 18.** Forbindelsen ifølge krav 1, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, valgt fra:



- 19.** Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1–3, eller 7–12, hvori forbindelsen er:

5



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

- 20.** Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1, 2, 5 eller 7–12, hvori forbindelsen er:

10



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

- 21.** Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1, 2, 4 eller 7–12, hvori forbindelsen er:

15



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

- 22.** Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1, 2, 6 eller 7–12, hvori forbindelsen er:

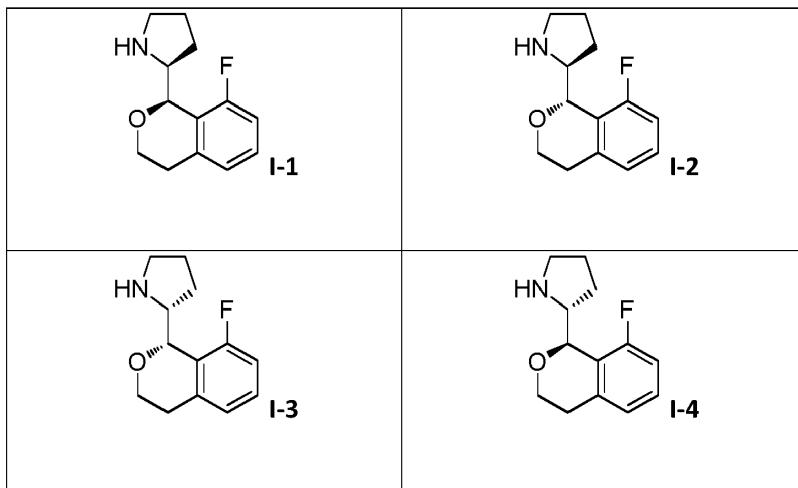
20



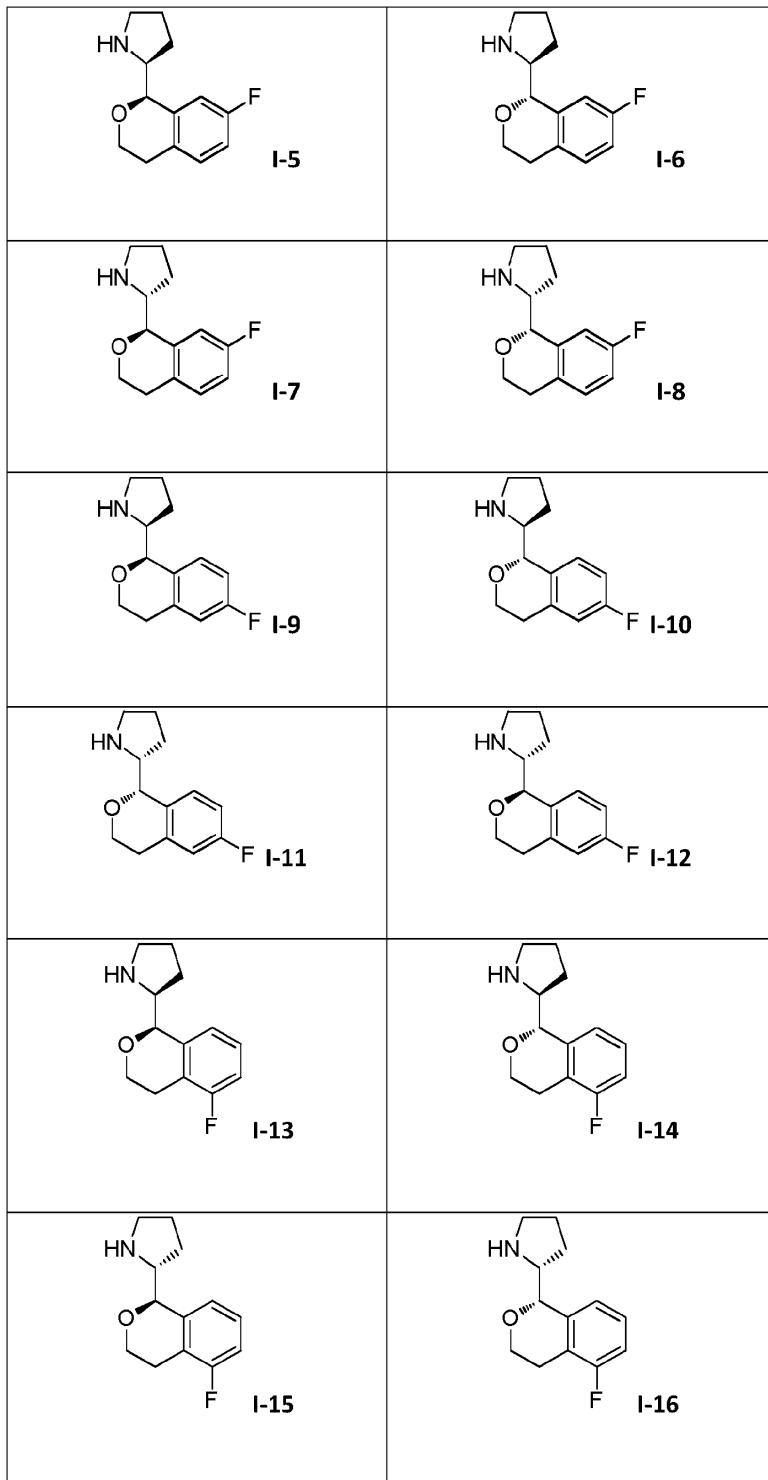
eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

23. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1–12, valgt fra de følgende forbindelsene, eller et farmassøytisk akseptabelt salt derav:

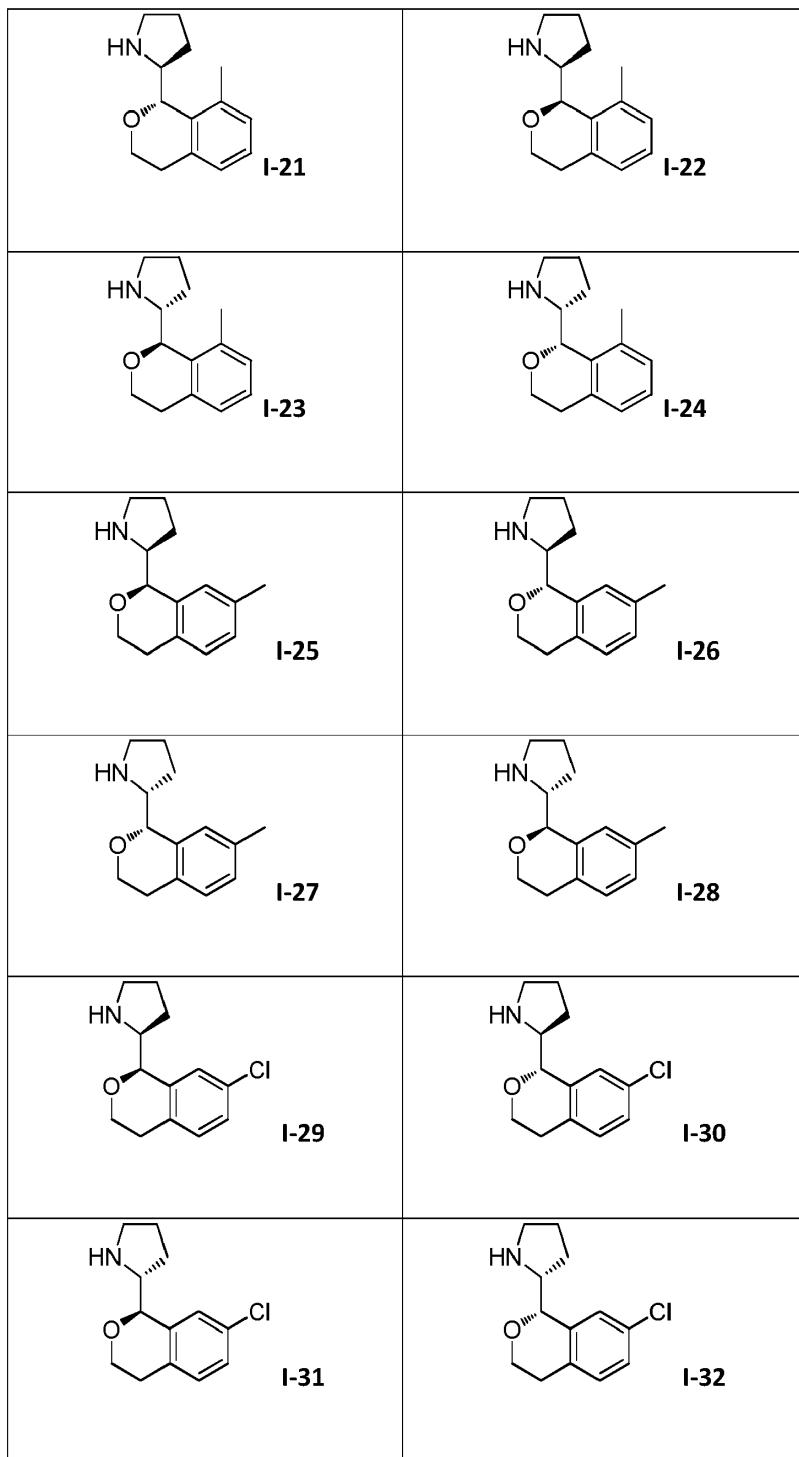
TABELL 1



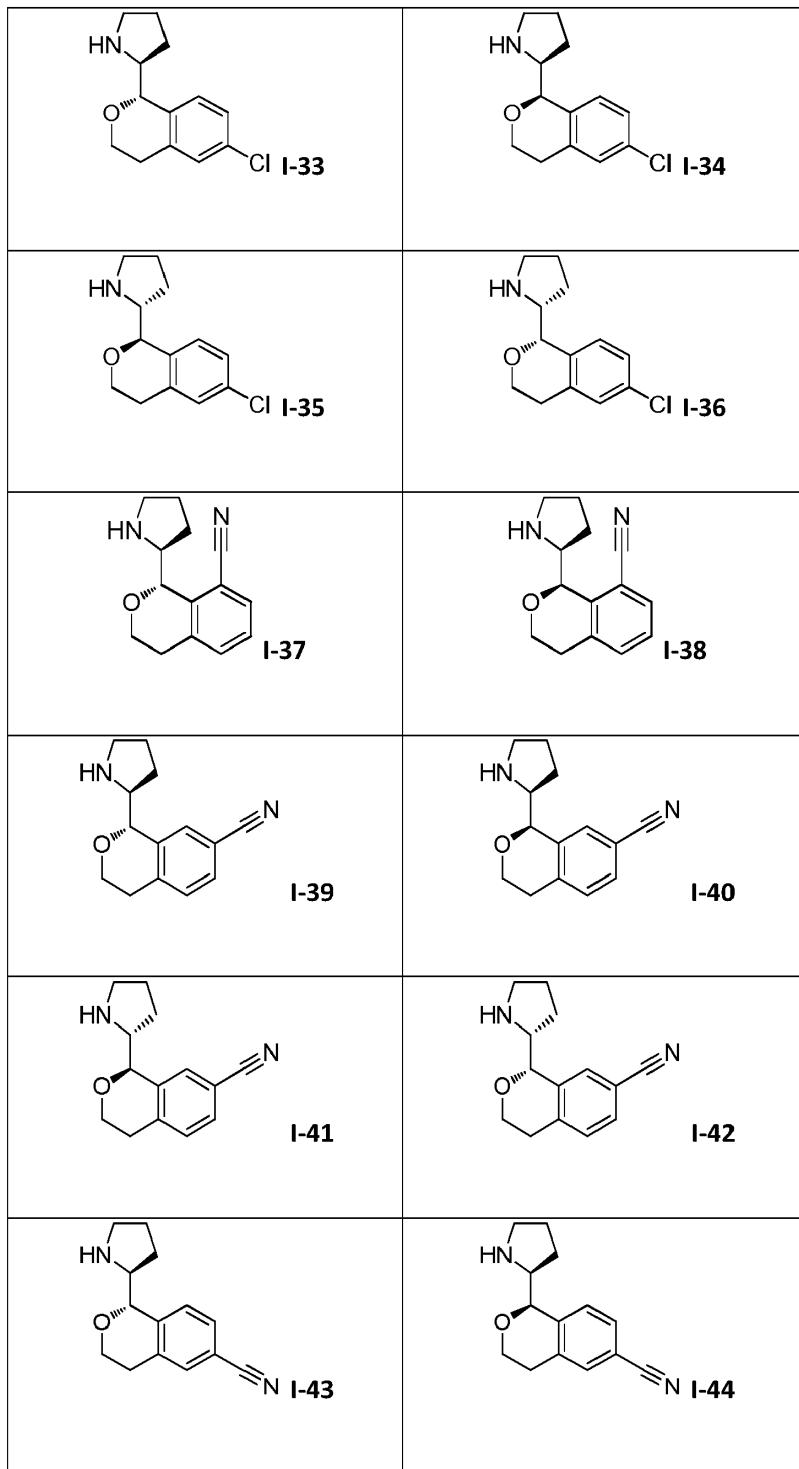
TABELL 1



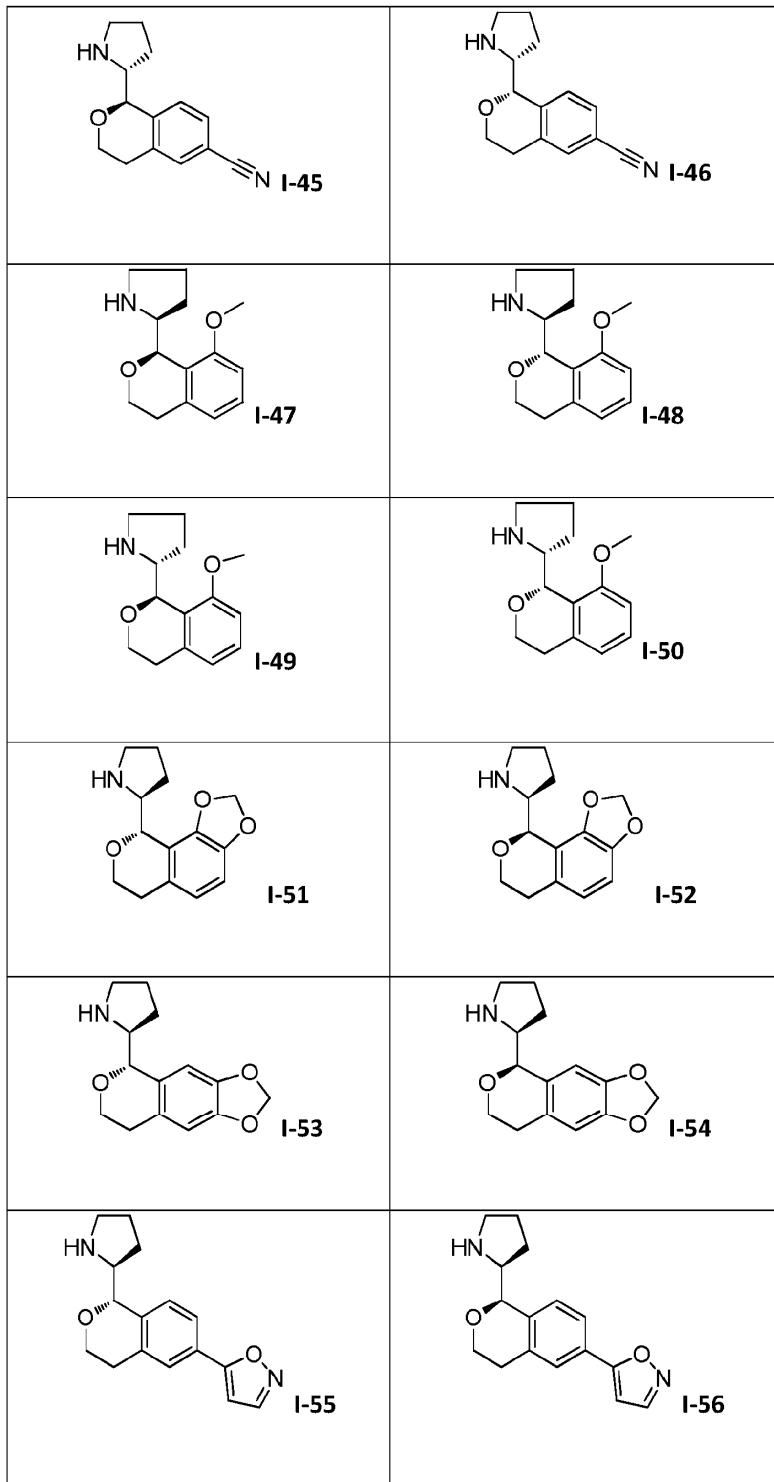
TABELL 1



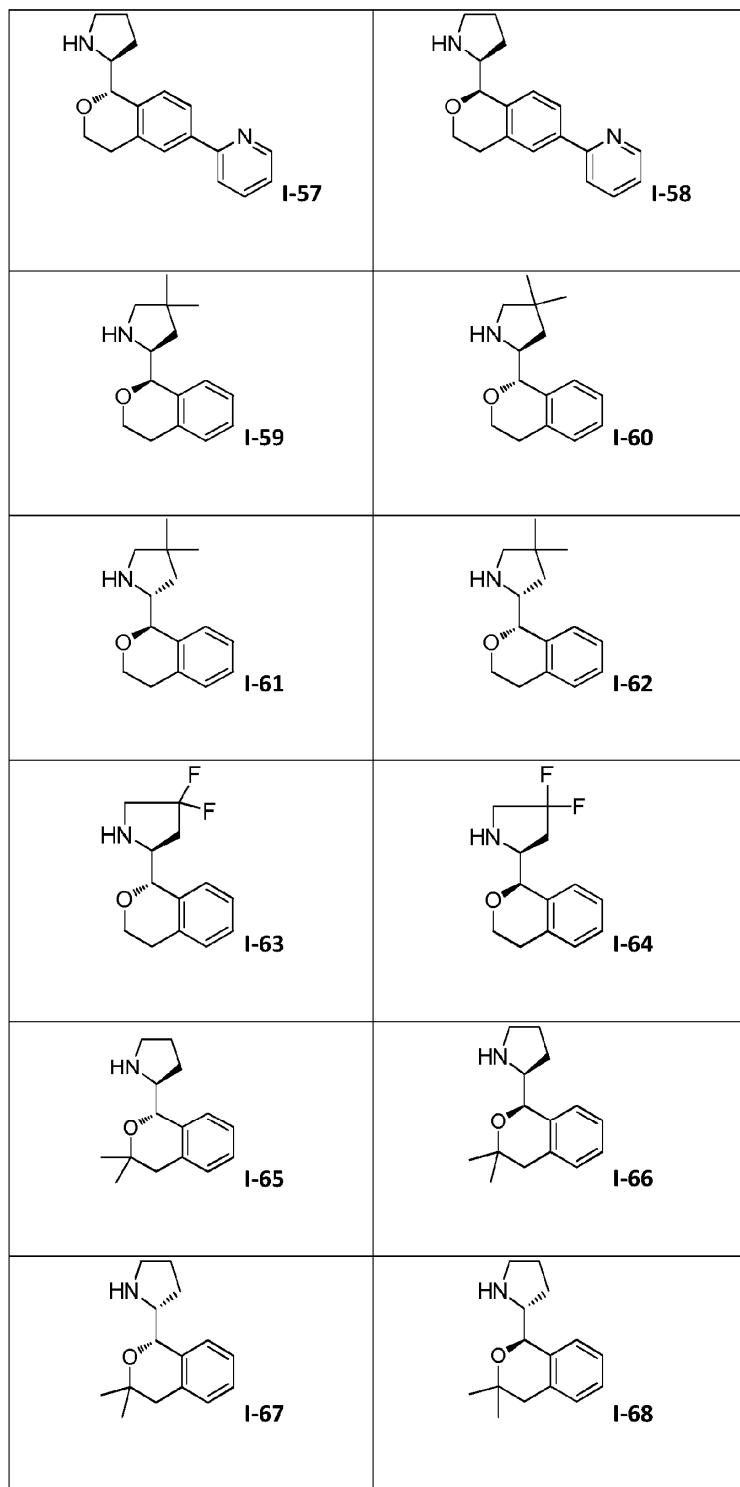
TABELL 1



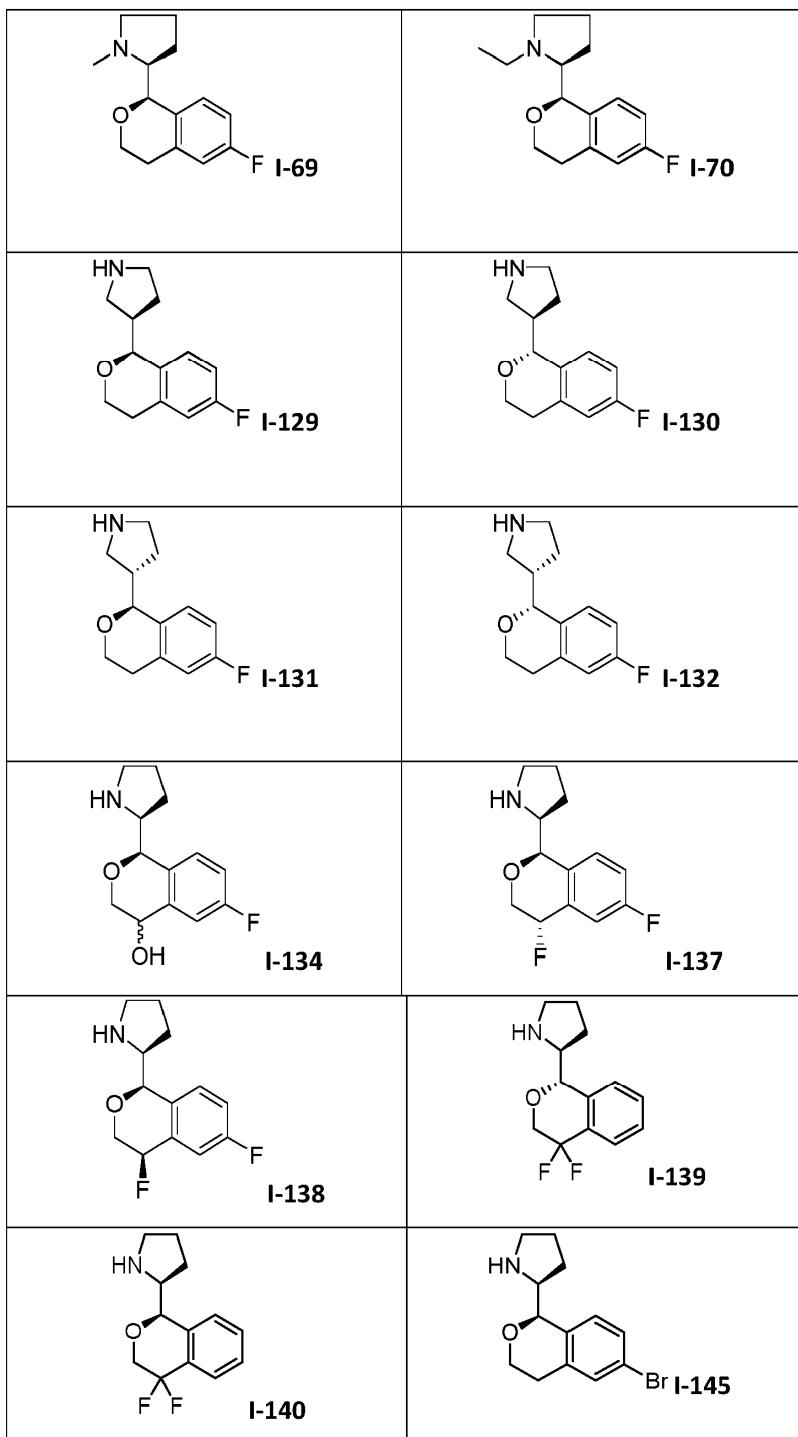
TABELL 1



TABELL 1



TABELL 1



24. Sammensetning omfattende en forbindelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–23,  
 5 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, og en farmasøytisk akseptabel bærer, adjuvans eller  
 vehikkel.

**25.** Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1–23, eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for anvendelse ved behandling av en nevrologisk eller psykiatrisk lidelse.

5   **26.** Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 25, hvor den nevrologiske eller psykiatriske lidelsen er alvorlig depresjon, schizofreni, bipolar lidelse, obsessiv-kompulsiv lidelse (OCD), panikklidelse eller posttraumatisk stresslidelse (PTSD).

10   **27.** Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 26, hvor den nevrologiske eller psykiatriske lidelsen er bipolar lidelse, mani, psykose eller schizofreni.

**28.** Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 27, hvor den nevrologiske eller psykiatriske lidelsen er bipolar lidelse.