



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3288946 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07D 487/06 (2006.01)
A61K 31/407 (2006.01)
A61P 25/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2020.01.20
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.08.21
(86)	European Application Nr.	16721320.6
(86)	European Filing Date	2016.04.26
(87)	The European Application's Publication Date	2018.03.07
(30)	Priority	2015.04.27, US, 201562153082 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
	Designated Extension States:	BA ; ME
	Designated Validation States:	MA MD
(73)	Proprietor	Arena Pharmaceuticals, Inc., 6154 Nancy Ridge Drive, San Diego, CA 92121, USA
(72)	Inventor	REN, Albert S., 4266 Corte de Sausalito, San Diego, California 92130, USA SEMPLE, Graeme, 350 Nutmeg St. no. 307, San Diego, California 921303, USA ZHU, Xiuwen, 11367 BlackColt Lane, San Diego, California 92130, USA SAGE, Carleton R., 1388 Peachwood Drive, Encinitas, California 92024, USA
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54)	Title	5-HT2C RECEPTOR AGONISTS AND COMPOSITIONS AND METHODS OF USE
(56)	References Cited:	WO-A1-2015/066344 WO-A2-02/36596 WO-A2-02/42304

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 valgt fra følgende forbindelser, og farmasøytisk akseptable salter, hydrater og solvater derav:

- 5 *N*-(2,2-difluoretyl)-7-metyl-1,2,3,4,6,7-heksahydro-[1,4]diazepino[6,7,1-*hi*]indol-8-karboksamid (forbindelse nr. 1);
- (*S*)-*N*-(2,2-difluoretyl)-7-metyl-1,2,3,4,6,7-heksahydro-[1,4]diazepino[6,7,1-*hi*]indol-8-karboksamid (forbindelse nr. 2);
- (*R*)-*N*-(2,2-difluoretyl)-7-metyl-1,2,3,4,6,7-heksahydro-[1,4]diazepino[6,7,1-*hi*]indol-8-
- 10 karboksamid (forbindelse nr. 3);
- (*S*)-*N*-(2,2-difluoretyl)-7-etyl-1,2,3,4,6,7-heksahydro-[1,4]diazepino[6,7,1-*hi*]indol-8-karboksamid (forbindelse nr. 4);
- (*R*)-*N*-(2,2-difluoretyl)-7-etyl-1,2,3,4,6,7-heksahydro-[1,4]diazepino[6,7,1-*hi*]indol-8-karboksamid (forbindelse nr. 5);
- 15 *N*-(2,2-difluoretyl)-7,7-dimetyl-1,2,3,4,6,7-heksahydro-[1,4]diazepino[6,7,1-*hi*]indol-8-karboksamid (forbindelse nr. 6);
- N*-(2,2-difluoretyl)-2,3,4,6-tetrahydro-1*H*-spiro[[1,4]diazepino[6,7,1-*hi*]indol-7,1'-syklobutan]-8-karboksamid (forbindelse nr. 7);
- (*S*)-*N*-(2,2-difluoretyl)-7-(2,2,2-trifluoretyl)-1,2,3,4,6,7-heksahydro-
- 20 [1,4]diazepino[6,7,1-*hi*]indol-8-karboksamid (forbindelse nr. 8); og
- (*R*)-*N*-(2,2-difluoretyl)-7-(2,2,2-trifluoretyl)-1,2,3,4,6,7-heksahydro-[1,4]diazepino[6,7,1-*hi*]indol-8-karboksamid (forbindelse nr. 9).

2. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori forbindelsen er (*R*)-*N*-(2,2-difluoretyl)-7-metyl-1,2,3,4,6,7-heksahydro-[1,4]diazepino[6,7,1-*hi*]indol-8-karboksamid (forbindelse nr. 3) eller et farmasøytisk akseptabelt salt, hydrat eller solvat derav.

3. Farmasøytisk sammensetning omfattende en forbindelse ifølge krav 1 eller krav 2 og en farmasøytisk akseptabel bærer.

30

4. Fremgangsmåte for fremstilling av en farmasøytisk sammensetning, omfattende blanding av en forbindelse ifølge krav 1 eller krav 2 og en farmasøytisk akseptabel bærer.

5. Forbindelse ifølge krav 1 eller krav 2 eller en sammensetning ifølge krav 3 for anvendelse

i en fremgangsmåte for behandling av menneske- eller dyrekroppen ved terapi.

6. Forbindelse ifølge krav 1 eller krav 2 eller en sammensetning ifølge krav 3 for anvendelse i en fremgangsmåte for å:

5 redusere hyppigheten av å røyke tobakk hos et individ som prøver å redusere hyppigheten av tobakkkrøykingen;

hjelp til med å stanse eller minske anvendelsen av et tobakksprodukt hos et individ som forsøker å stanse eller minske anvendelsen av et tobakksprodukt;

medvirke til røykeslutt og forhindre forbundet vektøkning;

10 kontrollere vektøkning forbundet med røykeslutt hos et individ som prøver å slutte å røyke tobakk;

redusere vektøkning forbundet med røykeslutt hos et individ som forsøker å slutte å røyke tobakk;

15 behandle nikotinavhengighet, avhengighet og/eller tilbaketrekking hos et individ som prøver å behandle nikotinavhengighet, avhengighet og/eller tilbaketrekking; eller

redusere sannsynligheten for tilbakefallsbruk av nikotin hos et individ som prøver å slutte å anvende nikotin.

7. Forbindelse eller sammensetning for anvendelse ifølge krav 6, hvori fremgangsmåten 20 omfatter:

velge et individ med en innledende $BMI \geq 27 \text{ kg/m}^2$; og

foreskrive og/eller administrere til individet en effektiv mengde av forbindelsen eller sammensetningen i minst ett år.

25 8. Forbindelse eller sammensetning for anvendelse ifølge krav 6, hvori fremgangsmåten omfatter:

administrere forbindelsen eller sammensetningen til et individ;

overvåke individet for BMI under administreringen; og

30 avbryte administreringen dersom BMI-en for individet blir $< 18,5 \text{ kg/m}^2$ under administreringen.

9. Forbindelse eller sammensetning for anvendelse ifølge krav 6, hvori fremgangsmåten omfatter:

administrere forbindelsen eller sammensetningen til et individ med en innledende $BMI \leq$

25 kg/m²;

overvåke individet for kroppsvekt under administreringen; og avbryte administreringen hvis kroppsvekten til individet synker med mer enn ca. 1 % under administreringen.

5 10. Forbindelse eller sammensetning for anvendelse ifølge krav 6, hvori fremgangsmåten omfatter:

administrere forbindelsen eller sammensetningen til et individ;

overvåke individet for kroppsvekt under administreringen; og

10 avbryte administreringen hvis kroppsvekten til individet synker med mer enn ca. 1 kg under administreringen.

11. Forbindelse eller sammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 6 til 10, hvori individet også blir forskrevet og/eller administrert et tilskuddsmiddel.

15 12. Forbindelse ifølge krav 1 eller krav 2 eller en sammensetning ifølge krav 3 for anvendelse i en fremgangsmåte for å redusere matinntak hos et individ.

20 13. Forbindelse ifølge krav 1 eller krav 2 eller en sammensetning ifølge krav 3 for anvendelse i en fremgangsmåte for å indusere metthetsfølelse hos et individ.

14. Forbindelse ifølge krav 1 eller krav 2 eller en sammensetning ifølge krav 3 for anvendelse i en fremgangsmåte for å behandle fedme hos et individ.

25 15. Forbindelse ifølge krav 1 eller krav 2 eller en sammensetning ifølge krav 3 for anvendelse i en fremgangsmåte for å forebygge fedme hos et individ.

16. Forbindelse ifølge krav 1 eller krav 2 eller en sammensetning ifølge krav 3 for anvendelse i en fremgangsmåte for vektstyring hos et individ.

30 17. Forbindelse ifølge krav 1 eller krav 2 eller en sammensetning ifølge krav 3 for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av diabetes type 2 hos et individ.

18. Forbindelse ifølge krav 1 eller krav 2 eller en sammensetning ifølge krav 3 for anvendelse i en fremgangsmåte for forebygging av diabetes type 2 hos et individ.

19. Forbindelse ifølge krav 1 eller krav 2 eller en sammensetning ifølge krav 3 for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av legemiddelavhengighet hos et individ.

5 20. Forbindelse ifølge krav 1 eller krav 2 eller en sammensetning ifølge krav 3 for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av alkoholavhengighet hos et individ.

21. Forbindelse ifølge krav 1 eller krav 2 eller en sammensetning ifølge krav 3 for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av en anfallsforstyrrelse hos et individ.

10

22. Forbindelse eller sammensetning for anvendelse ifølge krav 21, hvori anfallsforstyrrelsen er epilepsi.

15

23. Forbindelse eller sammensetning for anvendelse ifølge krav 21, hvori anfallsforstyrrelsen er Dravets syndrom.

24. Forbindelse ifølge krav 1 eller krav 2 eller en sammensetning ifølge krav 3 for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av urininkontinens.