



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3328864 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

C07D 487/04 (2006.01)

A61K 31/554 (2006.01)

C07D 498/04 (2006.01)

A61K 31/5513 (2006.01)

A61P 43/00 (2006.01)

C07D 513/04 (2006.01)

A61K 31/553 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2022.12.19
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2022.09.07
(86)	European Application Nr.	16820570.6
(86)	European Filing Date	2016.07.06
(87)	The European Application's Publication Date	2018.06.06
(30)	Priority	2015.07.06, AU, 2015902659
(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	Kinosis Therapeutics Pty Ltd, Suite 201 697 Burke Rd, Camberwell, VIC 3124, Australia
(72)	Inventor	MCGREGOR, Iain Stewart, 10 Florabella Street, Werrimoo, New South Wales 2774, Australia KASSIOU, Michael, 21 Moons Avenue, Lugarno, New South Wales 2210, Australia BOWEN, Michael Thomas, 8/28 Moodie Street, Cammeray, New South Wales 2062, Australia HICKS, Callum, 1161 S. Dorrance Street, Philadelphia, Pennsylvania 19146, USA JORGENSEN, William, 40 Tennant Street, Casula, New South Wales 2170, Australia
(74)	Agent or Attorney	RWS, Europa House, Chiltern Park, Chiltern Hill, SL99FG CHALFONT ST PETER, Storbritannia

(54)	Title	THERAPEUTIC COMPOUNDS AND COMPOSITIONS FOR TREATING SOCIAL DISORDERS AND SUBSTANCE USE DISORDERS
(56)	References Cited:	WO-A1-2010/097576 WO-A2-2006/021213 WO-A2-03/000692 DATABASE REGISTRY [Online] 16 June 2015 'Chemical name: 1H-Pyrazolo[4,3-c]quinoline, 4,5-dihydro-1-methyl', XP055510133 Retrieved from STN Database accession no. 1214866-72-4 REEKIE, TA ET AL.: 'Pyrazolo[1,4]diazepines as non-peptidic probes of the oxytocin and vasopressin receptors' TETRAHEDRON LETTERS vol. 55, no. 33, 2014, pages 4568 - 4571, XP029040790 REEKIE, TA ET AL.: 'Synthesis of biologically active seven-membered-ring heterocycles' SYNTHESIS vol. 45, no. 23, 2013, pages 3211 - 3227, XP055281840

OTTONI O ET AL: "Efficient and Simple Methods for the Introduction of the Sulfonyl, Acyl and Alkyl Protecting Groups on the Nitrogen of Indole and its Derivatives", TETRAHEDRON, ELSEVIER SCIENCE PUBLISHERS, AMSTERDAM, NL, vol. 54, no. 46, 12 November 1998 (1998-11-12), pages 13915-13928, XP004139902, ISSN: 0040-4020, DOI: 10.1016/S0040-4020(98)00865-5

TRISTAN REEKIE ET AL: "Synthesis of Biologically Active Seven-Membered-Ring Heterocycles", SYNTHESIS, vol. 45, no. 23, 24 October 2013 (2013-10-24), pages 3211-3227, XP055281840, STUTTGART, DE. ISSN: 0039-7881, DOI: 10.1055/s-0033-1338549

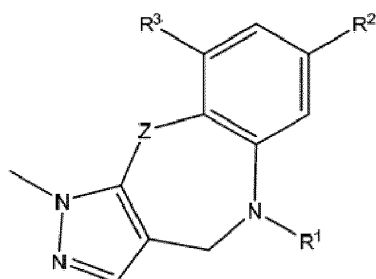
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters 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 farmasøytisk akseptabel bærer, fortynningsmiddel eller hjelpestoff; og

5 en farmasøytisk akseptabel forbindelse av formel (Ia), eller et salt derav:



Formel (Ia)

hvor:

Z er valgt fra: NH, O, S, S(O) eller SO₂;

10 R¹ er H;

R² er valgt fra: H, OH, et halogen, et eventuelt substituert C₁₋₅alkyl, eller et eventuelt substituert OC₁₋₅alkyl; og

R³ er valgt fra: H, OH, et halogen, et eventuelt substituert C₁₋₅alkyl, eller et eventuelt substituert OC₁₋₅alkyl.

15

2. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1, hvor Z er NH

3. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1 eller 2, hvor R² er H.

20 4. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1 eller 2, hvor R² er valgt fra gruppen som består av en hydroksylgruppe, halogen eller OC₁₋₅ alkyl.

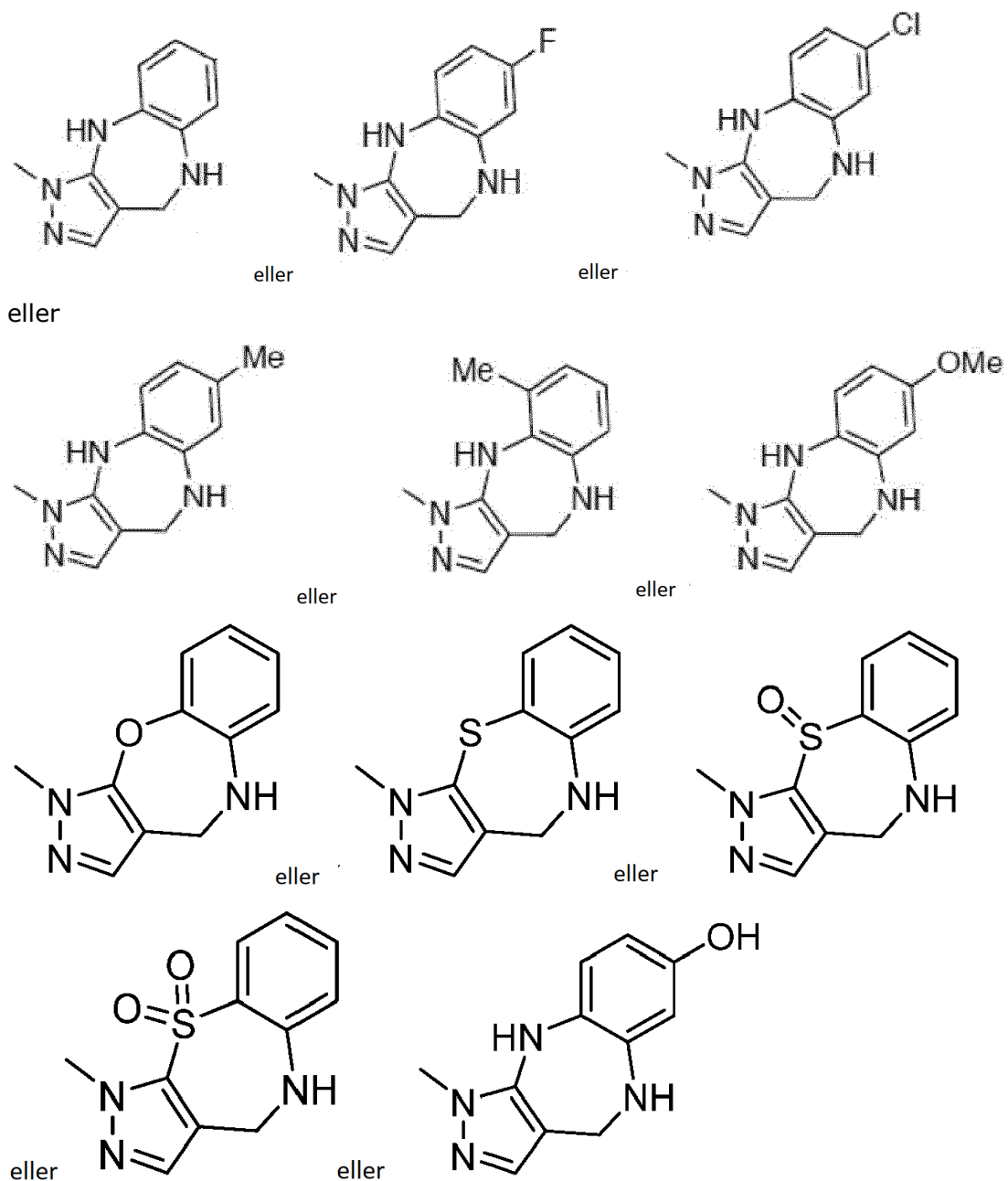
5. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 4, hvor R² er valgt fra gruppen som består av: fluor, klor eller metoksy.

25

6. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1–5, hvor R³ er H.

7. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1–5, 30 hvor R³ er C₁₋₅alkyl.

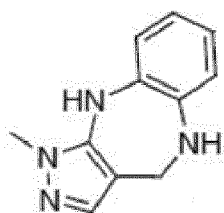
8. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1, hvor forbindelsen av formel (Ia) er valgt fra en hvilken som helst av:



eller et salt derav.

5

9. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1, hvori forbindelsen av formel (Ia) er:



eller et salt derav.

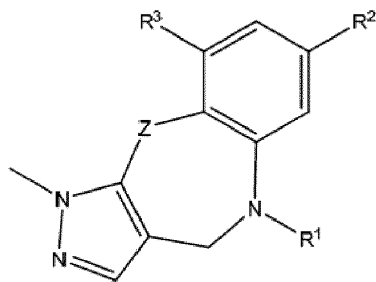
10. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori sammensetningen omfatter forbindelsen av formel (Ia).

11. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-9, hvori sammensetningen omfatter saltet av forbindelsen av formel (Ia).

12. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 11, hvori forbindelsen er et salt valgt fra en hvilken som helst av: saltsyre, svovelsyre, fosforsyre, salpetersyre, karbonsyre, borsyre, sulfaminsyre, hydrobromsyre, eddiksyre, propionsyre, smørsyre, vinsyre, maleinsyre, hydroksymaleinsyre, fumarsyre, isetionsyre, eplesyre, sitronsyre, melkesyre, slimsyre, glukonsyre, benzosyre, ravsyre, oksalsyre, fenyleddiksyre, metansulfonsyre, toluensulfonsyre, benzensulfonsyre, salisylsyre, sulfaninsyre, asparaginsyre, glutaminsyre, edetinsyre, stearinsyre, palmitinsyre, oljesyre, laurinsyre, pantotensyre, garvesyre, askorbinsyre- og valeriansyresalter; eller metallsalter, som inkluderer natrium-, kalium-, litium-, kalsium-, magnesium- og sinkmetallsalter; eller ammonium, alkylammoniumsalter; eller aminosyresalter.

13. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, formulert for oral, rektal, nasal, topisk eller parenteral administrering, eller i en form egnet for administrering ved inhalasjon av insufflasjon.

14. Forbindelse av formel (Ia), eller et salt derav:



Formel (Ia)

25 hvori:

Z er valgt fra: NH, O, S, S(O) eller SO₂;

R¹ er H;

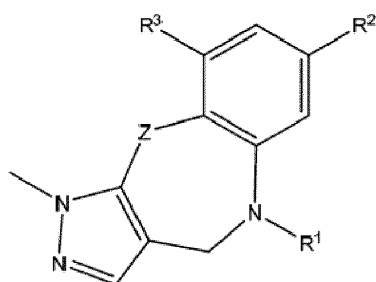
R² er valgt fra: H, OH, et halogen, et eventuelt substituert C₁₋₅alkyl, eller et eventuelt substituert OC₁₋₅alkyl; og

30 R³ er valgt fra: H, OH, et halogen, et eventuelt substituert C₁₋₅alkyl, eller et eventuelt substituert OC₁₋₅alkyl;

eller en farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1-13, for anvendelse ved å stimulere prososial adferd hos et individ, som tilveiebringer akutt og

- 5 langsiktig regulering av sosial adferd hos et individ, behandle eller forebygge en rusmisbruksforstyrrelse hos et individ, behandle eller forebygge en sosial dysfunksjon hos et individ, og/eller behandle eller forebygge en psykiatrisk lidelse hos et individ som en del av en terapi for en psykiatrisk lidelse som fremmer dysfunksjon som en primær eller sekundær funksjon.

15. Forbindelse av formel (Ia), eller et salt derav:



Formel (Ia)

10 hvori:

Z er valgt fra: NH, O, S, S(O) eller SO₂;

R¹ er H;

R² er valgt fra: H, OH, et halogen, et eventuelt substituert C₁₋₅alkyl, eller et eventuelt substituert OC₁₋₅alkyl; og

15 R³ er valgt fra: H, OH, et halogen, et eventuelt substituert C₁₋₅alkyl, eller et eventuelt substituert OC₁₋₅alkyl;

eller en farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 13, for anvendelse i behandling eller forebygging av en tilstand hos et individ, hvori tilstanden er en sosial dysfunksjon, en psykiatrisk lidelse eller en rusmisbruksforstyrrelse.