



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3347006 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

A61K 31/395 (2006.01)

A61K 31/536 (2006.01)

A61K 31/535 (2006.01)

A61P 25/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2022.10.24
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2022.07.27
(86)	European Application Nr.	16769437.1
(86)	European Filing Date	2016.03.18
(87)	The European Application's Publication Date	2018.07.18
(30)	Priority	2015.03.20, US, 201562135979 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	GABA Therapeutics Inc., 5000 Birch Street West Tower, Suite 3000, Newport Beach, CA 92660, USA
(72)	Inventor	DASSE, Olivier, 30 Calotte Place, Foothill Ranch, CA 92610, USA
(74)	Agent or Attorney	Nordic Patent Service A/S, Bredgade 30, 1260 KØBENHAVN K, Danmark

(54)	Title	DEUTERATED ANALOGS OF ETIFOXINE, THEIR DERIVATIVES AND USES THEROF
------	-------	---

(56)	References Cited:
------	----------------------

US-A1- 2007 167 446

SHAO L ET AL: "Derivatives of tramadol for increased duration of effect", BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS, PERGAMON, AMSTERDAM, NL, vol. 16, no. 3, 1 February 2006 (2006-02-01), pages 691-694, XP027965859, ISSN: 0960-894X [retrieved on 2006-02-01]

YUN MI CHOI ET AL: "Etifoxine for Pain Patients with Anxiety", THE KOREAN JOURNAL OF PAIN, vol. 28, no. 1, 1 January 2015 (2015-01-01), page 4, XP055562640, ISSN: 2005-9159, DOI: 10.3344/kjp.2015.28.1.4

FOSTER A B: "Deuterium isotope effects in the metabolism of drugs and xenobiotics: implications for drug design", ADVANCES IN DRUG RESEA, ACADEMIC PRESS, LONDON, GB, vol. 14, 1 January 1985 (1985-01-01), pages 1-40, XP009086953, ISSN: 0065-2490

BUTEAU K C: "Deuterated Drugs: Unexpectedly Nonobvious?", JOURNAL OF HIGH TECHNOLOGY LAW, SUFFOLK UNIVERSITY LAW SCHOOL, US , vol. X, no. 1 1 January 2009 (2009-01-01), pages 22-74, XP002636702, ISSN: 1536-7983 Retrieved from the Internet: URL:http://www.law.suffolk.edu/highlights/ stuorgs/jhtl/docs/pdf/Buteau_10JHTL1.pdf [retrieved on 2009-01-01]

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. Forbindelsen 6-klor-*N*-(etyl- d_5)-4-metyl-4-fenyl-4*H*-3,1-benzoksazin-2-amin eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav, hvori et deuterium er til stede i en forekomst som er minst 3340 ganger større enn den naturlige forekomsten av deuterium.

2. Forbindelsen ifølge krav 1, hvori forbindelsen er den enantiomert rene *S*-etifoksinanalog, eller den enantiomert rene *R*-etifoksinanalog eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav.

3. Forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1–2, hvori et hvilket som helst atom som ikke er betegnet som deuterium er til stede i sin naturlige isotopiske forekomst.

4. Farmasøytisk sammensetning omfattende forbindelsen ifølge et hvilket som helst av kravene 1–3, eller det farmasøytisk akseptable saltet eller solvatet derav, og en farmasøytisk akseptabel eksipiens.

5. Forbindelsen ifølge krav 1–3 eller sammensetningen ifølge krav 4 for anvendelse i behandlingen av en lidelse i sentralnervesystemet, forstyrrelse i det perifere nervesystemet eller inflammatorisk tilstand.

6. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 5, hvori anvendelsen er for behandlingen av en forstyrrelse i sentralsystemet slik som multippel sklerose, netthinne degenerasjoner og fotoindusert skade på netthinnen, muskelavslapping ved spinal spastisitet, spinal muskelatrofi, cerebral parese, trigeminusnevralgi, migrene, Alzheimers sykdom, Huntingtons chorea, Parkinsons sykdom, Creutzfeldt-Jakobs sykdom, Friedreichs sykdom, delirium, demens, amnestisk lidelse, kognitiv lidelse; iskemisk eller hemorragisk cerebral vaskulær hendelse inkludert slag og traumatisk hjerneskade (TBI), fakomatoser, amyotrofisk lateral sklerose, schizofreni, humørsykdom, depresjon, legemiddelabstinenssymptomer, stamming, autismespekterforstyrrelse, konvulsiv lidelse, epilepsi, angstlidelse, søvnforstyrrelse, oppmerksomhetssviktforstyrrelse, hyperaktivitet- og oppmerksomhetsforstyrrelse, forstyrrende atferdsforstyrrelse, legemiddelrelatert lidelse, demens av Alzheimers type, vaskulær demens, demens som følge av HIV-sykdom, demens som følge av hodetraume, demens som følge av Parkinsons sykdom, demens som følge av Huntingtons sykdom, demens som følge av Picks

sykdom, demens som følge av Creutzfeldt-Jakobs sykdom, angst, panikklidelse uten agorafobi, panikklidelse med agorafobi, agorafobi uten historie med panikklidelse, spesifikk fobi, sosial fobi, tvangslidelse, posttraumatisk stresslidelse, akutt stresslidelse, generalisert angstlidelse, angstlidelse som følge av en medisinsk tilstand, stoffindusert angstlidelse, angstlidelse som ikke er spesifisert på annen måte (NOS), stemningslidelse, depressiv lidelse, inkludert alvorlig depressiv lidelse-enkelt episode eller tilbakevendende, dystym lidelse, depressiv lidelse NOS, bipolar lidelse, inkludert bipolar I lidelse, bipolar II lidelse, syklotymisk lidelse, bipolar lidelse NOS, stemningslidelse som følge av generell medisinsk tilstand, stoffindusert stemningslidelse eller stemningslidelse NOS.

10

7. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 5, hvori anvendelsen er for behandlingen av en perifer nervøs lidelse slik som diabetisk nevropati, legemiddelindusert nevropati, inflammatorisk nevropati, enzymmangel-indusert nevropati, arvelig motorisk nevropati, sensorisk nevropati, perifer nevropati, HIV-indusert nevralgi eller postherpetisk nevralgi.

15

8. Forbindelsen for anvendelse ifølge krav 5, hvori anvendelsen er for behandlingen av en inflammatorisk tilstand slik som revmatoid artritt eller en tarmmotilitetsforstyrrelse slik som irritabel tarmsyndrom.