



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3461834 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07J 9/00 (2006.01)
A61K 31/575 (2006.01)
A61P 1/14 (2006.01)
A61P 3/04 (2006.01)
A61P 9/00 (2006.01)
A61P 9/10 (2006.01)
A61P 23/00 (2006.01)
A61P 25/00 (2006.01)
A61P 25/04 (2006.01)
A61P 25/08 (2006.01)
A61P 25/14 (2006.01)
A61P 25/16 (2006.01)
A61P 25/18 (2006.01)
A61P 25/20 (2006.01)
A61P 25/22 (2006.01)
A61P 25/24 (2006.01)
A61P 25/28 (2006.01)
A61P 25/30 (2006.01)
A61P 27/16 (2006.01)
A61P 29/00 (2006.01)
A61P 43/00 (2006.01)
C07J 13/00 (2006.01)
C07J 21/00 (2006.01)
C07J 41/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.08.30
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.05.19
(86)	European Application Nr.	18190034.1
(86)	European Filing Date	2014.03.13
(87)	The European Application's Publication Date	2019.04.03
(30)	Priority	2013.03.13, US, 201361779735 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
(62)	Divided application	EP2968369, 2014.03.13
(73)	Proprietor	Sage Therapeutics, Inc., 215 First Street, Cambridge, MA 02142, USA

(72) Inventor MARTINEZ BOTELLA, Gabriel, 17 Parmenter Road, Wayland, MA 01778, USA
 HARRISON, Boyd L., 9 Wheatston Court, Princeton Junction, NJ 08550, USA
 ROBICHAUD, Albert J., 3 Riverview Court, Ringoes, NJ 08551, USA
 SALITURO, Francesco G., 25 Baker Drive, Marlborough, MA 01752, USA

(74) Agent or Attorney PLOUGMANN VINGTOFT, Postboks 1003 Sentrum, 0104 OSLO, Norge

(54) Title **NEUROACTIVE STEROIDS**

(56) References

Cited:

WO-A1-2013/036835

XILOURI ET AL: "Neuroprotective effects of steroid analogues on P19-N neurons", NEUROCHEMISTRY INTERNATIONAL, PERGAMON PRESS, OXFORD, GB, vol. 50, no. 4, 2 March 2007 (2007-03-02), pages 660-670, XP005911048, ISSN: 0197-0186, DOI: 10.1016/J.NEUINT.2006.12.010

YOON-SEOK ROH ET AL: "Neuroprotective Effects of Ginsenoside Rg 3 against 24-OH-cholesterol-induced Cytotoxicity in Cortical Neurons", JOURNAL OF GINSENG RESEARCH, vol. 34, no. 3, 30 September 2010 (2010-09-30), pages 246-253, XP055294051, KR ISSN: 1226-8453, DOI: 10.5142/jgr.2010.34.3.246

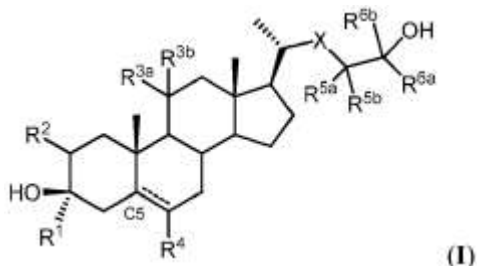
CONNICK J H ET AL: "Org (1) potentiates NMDA-receptor mediated responses in vivo", 2009 NEUROSCIENCE MEETING PLANNER. CHICAGO, IL; OCTOBER 17 - 21, 2009, SOCIETY FOR NEUROSCIENCE, no. Program#/Poster#: 613 1/B86, 17 October 2009 (2009-10-17), pages 1-2, XP002686783,

S. M. PAUL ET AL: "The Major Brain Cholesterol Metabolite 24(S)-Hydroxycholesterol Is a Potent Allosteric Modulator of N-Methyl-D-Aspartate Receptors", JOURNAL OF NEUROSCIENCE, vol. 33, no. 44, 30 October 2013 (2013-10-30), pages 17290-17300, XP055293992, US ISSN: 0270-6474, DOI: 10.1523/JNEUROSCI.2619-13.2013

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 på formelen (I):



eller et farmasøytisk akseptabelt salt av denne;

der:

R^1 er en substituert eller usubstituert alifatisk forbindelse;

R^2 er hydrogen, halogen, substituert eller usubstituert C_{1-6} -alkyl, substituert eller usubstituert syklopropyl, eller $-OR^{A2}$, der R^{A2} er hydrogen eller substituert eller usubstituert alkyl;

R^{3a} er hydrogen eller $-OR^{A3}$, der R^{A3} er hydrogen eller substituert eller usubstituert alkyl, og R^{3b} er hydrogen; eller R^{3a} og R^{3b} er forent for å danne en oksogruppe ($=O$ -gruppe);

R^4 er hydrogen, substituert eller usubstituert alkyl, eller halogen;

X er $-C(R^X)_2-$ eller $-O-$, der R^X er hydrogen eller fluor, eller én R^X -gruppe og R^{5b} er forent for å danne en dobbeltbinding;

R^{5a} er hydrogen;

R^{5b} er hydrogen eller fluor;

R^{6a} er en ikke-hydrogengruppe valgt fra gruppen som består av substituert og usubstituert alkyl-, substituert og usubstituert alkenyl-, substituert og usubstituert alkynyl-, substituert og usubstituert karbosykl-, substituert og usubstituert heterosykl-, substituert og usubstituert aryl-, og substituert og usubstituert heteroarylgruppe, der ikke-hydrogengruppen eventuelt er substituert med fluor; og R^{6b} er hydrogen eller en substituert eller usubstituert alkylgruppe som eventuelt er substituert med fluor;

----- representerer en enkelt- eller dobbeltbinding, forutsatt at dersom en enkeltbinding er til stede, så er hydrogenet ved C5 i *alfa*-konfigurasjonen;

og ytterligere forutsatt at:

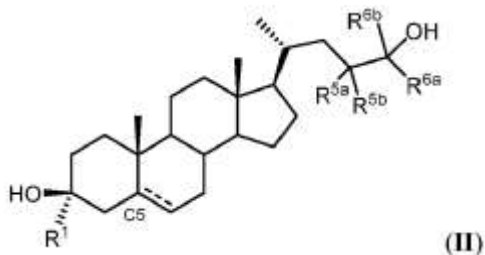
(1) minst én av R^X og R^{5b} er fluor; eller

- 2 -

(2) minst én av R^{6a} og R^{6b} er en ikke-hydrogen gruppe som er substituert med en fluor; eller

(3) R^{6a} er en ikke-hydrogen gruppe som omfatter mellom to og ti karbonatomer.

2. Forbindelse ifølge krav 1, der forbindelsen er en forbindelse på formelen (II):



eller et farmasøytisk akseptabelt salt av denne.

3. Forbindelse ifølge krav 1 eller 2, der R^1 er usubstituert C_{1-3} -alkyl.

4. Forbindelse ifølge krav 2, der R^1 er $-CH_3$, $-CH_2CH_3$, eller $-CH_2CH_2CH_3$.

5. Forbindelse ifølge et av kravene 1–4, der R^{5a} og R^{5b} begge er hydrogen.

6. Forbindelse ifølge et av kravene 1–5, der R^{6a} er en ikke-hydrogen gruppe som er substituert med fluor.

7. Forbindelse ifølge et av kravene 1–5, der R^{6b} er $-CH_3$ eller $-CF_3$.