



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3867244 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

C07D 405/10 (2006.01)

A61K 31/506 (2006.01)

A61P 25/24 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2023.03.20
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.01.18
(86)	European Application Nr.	19786343.4
(86)	European Filing Date	2019.10.16
(87)	The European Application's Publication Date	2021.08.25
(30)	Priority	2018.10.17, EP, 18200943
(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; TN
(73)	Proprietor	Boehringer Ingelheim International GmbH, Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, Tyskland
(72)	Inventor	GIOVANNINI, Riccardo, Boehringer Ingelheim International GmbH Corporate Patents Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, Tyskland CECI, Angelo, Boehringer Ingelheim International GmbH Corporate Patents Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, Tyskland DORNER-CIOSSEK, Cornelia, Boehringer Ingelheim International GmbH Corporate Patents Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, Tyskland PFAU, Roland, Boehringer Ingelheim International GmbH Corporate Patents Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, Tyskland WIEDENMAYER, Dieter, Boehringer Ingelheim International GmbH Corporate Patents Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, Tyskland
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

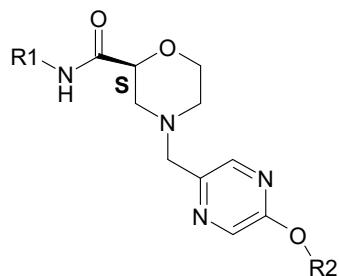
(54)	Title	4-PYRAZIN-2-YLMETHYL-MORPHOLINE DERIVATIVES AND THE USE THEREOF AS MEDICAMENT
(56)	References Cited:	WO-A1-2014/060398 WO-A2-2010/088408 WO-A1-03/010159 WO-A1-2015/130905 CHAFFEY H ET AL: "NMDA receptor subtypes: Structure, function and therapeutics", CURRENT ANAESTHESIA AND CRITICAL CARE, CHURCHILL LIVINGSTONE, LONDON, GB, vol. 19, no. 4, 1 August 2008 (2008-08-01) , pages 183-201, XP023781052, ISSN: 0953-7112, DOI: 10.1016/J.CACC.2008.05.004 [retrieved on 2008-06-26]

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/>

EP3867244

PATENTKRAV

- 5 1. En forbindelse med formel A

**A**

hvor

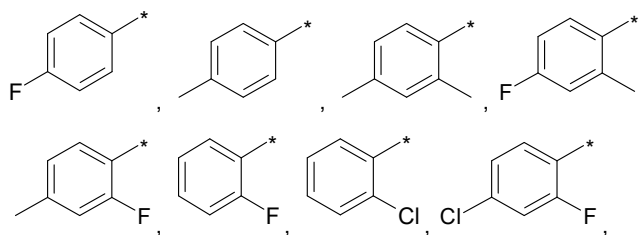
- 10 **R¹** representerer metyl, etyl, propyl, *iso*-propyl, syklopropyl, H₃C-CH₂-CH₂-CH₂-, syklobutyl;
R² representerer fenyl som eventuelt er substituert med 1, 2 eller 3 substituenten valgt fra gruppen bestående av fluor, klor, metyl, etyl, syklopropyl.

15

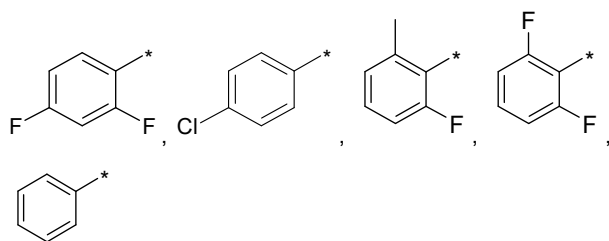
2. Forbindelsen i henhold til krav 1, hvor

R¹ representerer metyl, etyl;

R² representerer



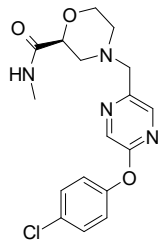
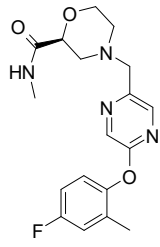
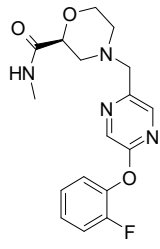
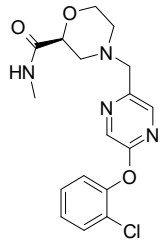
20

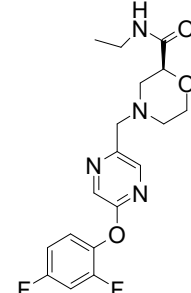
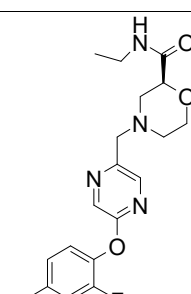
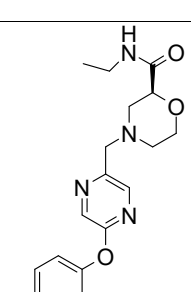
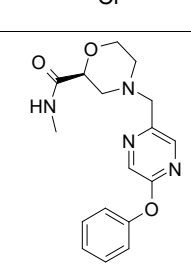


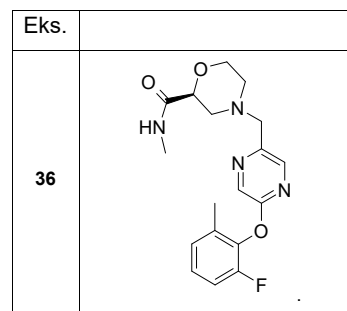
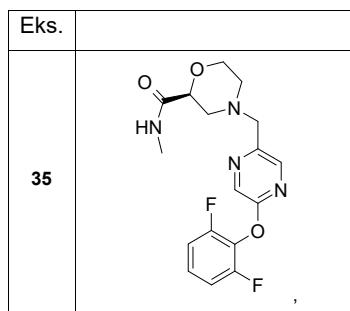
3. (S)-enantiomeren i henhold til hvilke som helst av kravene 1 til 2, nemlig
 5 en forbindelse valgt fra gruppen bestående av

Eks.	
1	
2	
3	

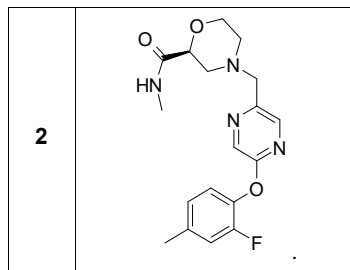
Eks.	
4	
5	
6	

Eks.	
7	
8	
9	
18	

Eks.	
30	
31	
33	
34	

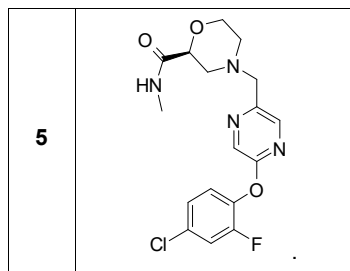


4. (S)-enantiomeren i henhold til hvilke som helst av kravene 1 til 3 med strukturen:

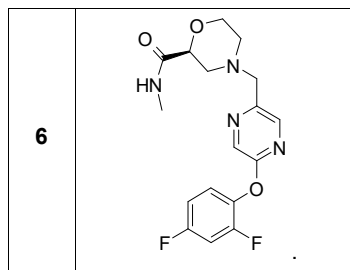


5

5. (S)-enantiomeren i henhold til hvilke som helst av kravene 1 til 3 med strukturen:

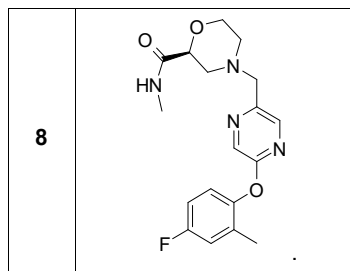


6. (S)-enantiomer i henhold til hvilke som helst af kravene 1 til 3 med strukturen:

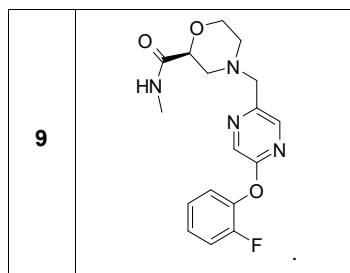


7. (S)-enantiomer i henhold til hvilke som helst af kravene 1 til 3 med strukturen:

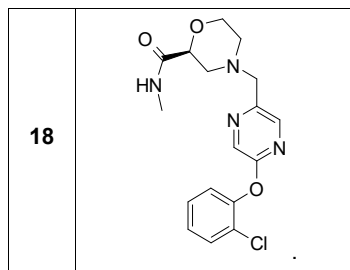
5



8. (S)-enantiomer i henhold til hvilke som helst af kravene 1 til 3 med strukturen:

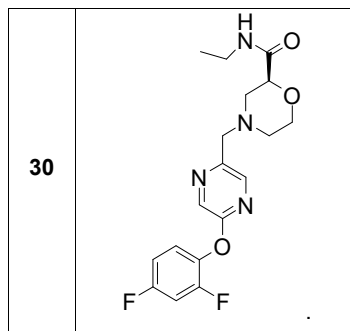


9. (S)-enantiomer i henhold til hvilke som helst af kravene 1 til 3 med strukturen:

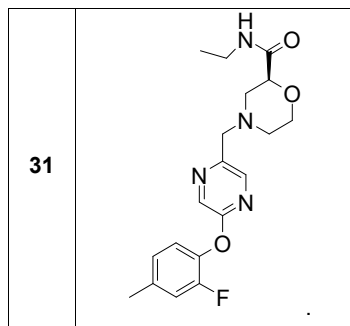


10. The (S)-enantiomer i henhold til hvilke som helst af kravene 1 til 3 med strukturen:

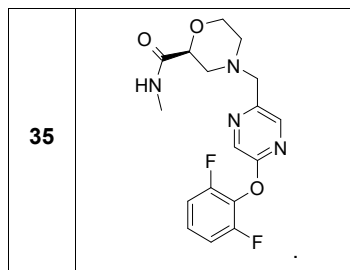
5



11. (S)-enantiomer i henhold til hvilke som helst af kravene 1 til 3 med strukturen:

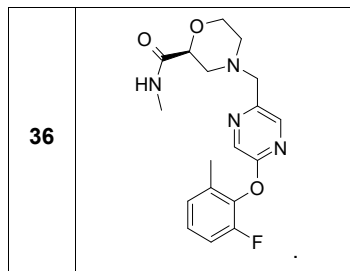


12. (S)-enantiomer i henhold til hvilke som helst av kravene 1 til 3 med strukturen:



13. (S)-enantiomer i henhold til hvilke som helst av kravene 1 til 3 med strukturen:

5



14. Et farmasøytisk akseptabelt salt av en forbindelse i henhold til hvilke som helst av kravene 1 til 13.
- 10 15. Forbindelsen i henhold til hvilke som helst av kravene 1 til 14 for bruk som et medikament.
- 15 16. Forbindelsen i henhold til hvilke som helst av kravene 1 til 14 for bruk for å behandle og/eller forhindre bipolar lidelse I deprimert, hypomanisk, manisk og blandet form; bipolar lidelse II; depressive lidelser; alvorlig depressiv lidelse med eller uten ledsagende ledsagede nervøs lidelse, blandede trekk, melankolske trekk, atypiske trekk, humør-kongruente psykotiske trekk, humør-inkongruente psykotiske trekk, katatoni.

17. Forbindelsen i henhold til hvilke som helst av kravene 1 til 14 for bruk for
å behandle og/eller forhindre en enkel depressive episode eller gjenta-
gende alvorlige depressive lidelser, mindre depressive lidelser, depres-
sive lidelser, depressive lidelser med begynnende postpartum , depres-
sive lidelser med psykotiske symptomer.
18. Forbindelsen for bruk i henhold til hvilke som helst av kravene 15 til 17
karakterisert ved at forbindelsen blir administrert i tillegg til behandling
med andre antidepressiva.
19. Forbindelsen for bruk i henhold til hvilke som helst av kravene 15 til 17
karakterisert ved at forbindelsen blir administrert i tillegg til atferdsterapi.
20. Forbindelsen i henhold til hvilke som helst av kravene 1 til 14 for bruk
ved behandlingen av akutt eller kroniske smerte som er relatert til nevro-
pati, fysiologiske prosesser og fysiske lidelser, lidelser i bevegelsesappa-
rat og bindevev , nerve, nerverot- og plexuslidelser.
21. Forbindelsen i henhold til hvilke som helst av kravene 1 til 14 for bruk
ved behandling av diabetisk nevropati, polynevropati, lav ryggsmerte,
leddsmerte, reumatisme, myalgi, fantomsmerte, karpaltunnelsyndrom.
22. En farmasøytisk sammensetning inneholdende forbindelsen i henhold til
hvilke som helst av kravene i 1 til 14 i blanding med et farmasøytisk ak-
septabelt adjuvans, fortynningsmiddel og/eller bærer.