



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3908570 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C07C 211/35 (2006.01)
A61K 31/135 (2006.01)
A61P 25/24 (2006.01)
C07C 65/11 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2024.03.11
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.12.13
(86)	European Application Nr.	20739053.5
(86)	European Filing Date	2020.01.10
(87)	The European Application's Publication Date	2021.11.17
(30)	Priority	2019.01.11, US, 201962791058 P 2019.07.09, US, 201962871763 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	Alar Pharmaceuticals Inc., Rm. 312, 3F., No. 19, Keyuan Rd Xitun Dist, Taichung City, Taiwan 40763, Taiwan
(72)	Inventor	LIN, Tong-Ho, Rm. 312, 3F., No. 19, Keyuan Rd. Xitun Dist., Taichung City, Taiwan 40763, Kina WEN, Yung-Shun, Rm. 312, 3F., No. 19, Keyuan Rd. Xitun Dist., Taichung City, Taiwan 40763, Kina CHEN, Chia-Hsien, Rm. 312, 3F., No. 19, Keyuan Rd. Xitun Dist., Taichung City, Taiwan 40763, Kina CHANG, Wei-Ju, Rm. 312, 3F., No. 19, Keyuan Rd. Xitun Dist., Taichung City, Taiwan 40763, Kina
(74)	Agent or Attorney	PLOUGMANN VINGTOFT, C. J. Hambros plass 2, 0164 OSLO, Norge

(54)	Title	KETAMINE PAMOATE AND USE THEREOF
(56)	References Cited:	

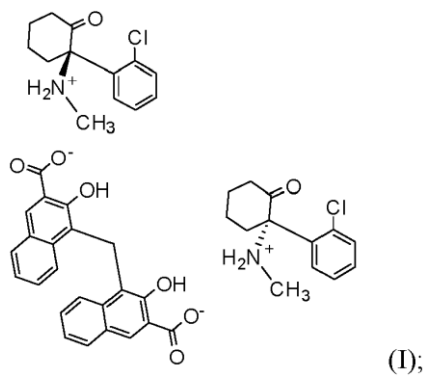
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters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

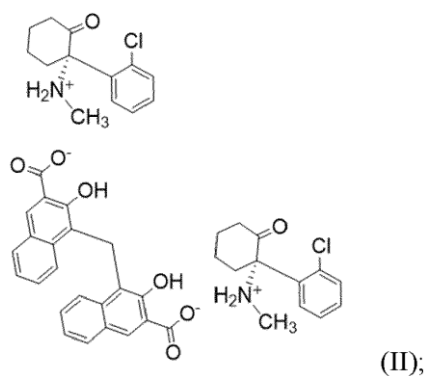
1. Pamoatsalt av ketamin som har en støkiometri på 2:1 av ketamin til pamoat.

2. Pamoatsaltet av ketamin ifølge krav 1, som er:

et pamoatsalt av R, S-ketamin representert av formel (I) nedenfor:

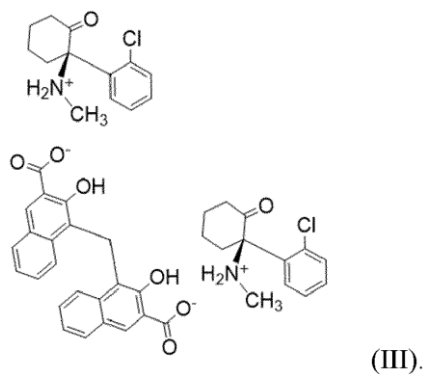


et pamoatsalt av S-ketamin representert av formel (II) nedenfor:



eller

et pamoatsalt av R-ketamin representert av formel (III) nedenfor:



3. Pamoatsaltet av ketamin ifølge krav 1, som er amorft.

4. Pamoatsaltet av ketamin ifølge krav 1, som er krystallinsk som har et røntgenpulverdiffraksjons-(XRPD)-mønster omfattende én eller flere 2θ -verdier $\pm 0,2$ 2θ valgt fra 6,0, 10,7, 11,6, 12,0, 13,0, 14,7, 15,0, 19,6, 22,2, 25,2 og 30,3.

5. Pamoatsaltet av ketamin ifølge krav 2, hvori pamoatsaltet av R, S-ketamin er krystallinsk som har et XRPD-mønster representert av minst ett av følgende:

- (i) XRPD-mønsteret omfattende én eller flere 2θ -verdier $\pm 0,2$ 2θ valgt fra 6,0, 8,6, 10,7, 11,6, 12,0, 13,0, 14,7, 15,0, 15,3, 17,9, 18,6, 19,6, 20,0, 21,1, 21,6, 22,2, 23,3, 24,4, 25,2, 25,9, 26,9, 28,6, 29,7, 30,3, 32,4, 34,0 og 36,6; og
- (ii) XRPD-mønsteret vist i FIG. 2A.

6. Pamoatsaltet av ketamin ifølge krav 2, hvori pamoatsaltet av S-ketamin er krystallinsk som har en spesifikk rotasjon av $[\alpha]_D^{25^\circ} = -67^\circ$ og et XRPD-mønster representert av minst ett av følgende:

- (i) XRPD-mønsteret omfattende én eller flere 2θ -verdier $\pm 0,2$ 2θ valgt fra 6,0, 10,8, 11,7, 12,0, 12,6, 13,1, 14,6, 15,1, 18,2, 19,2, 19,7, 20,1, 22,0, 22,8, 23,3, 23,7, 24,1, 24,7, 25,2, 27,3, 30,1, 31,6, 45,4, 56,4 og 75,2; og
- (ii) XRPD-mønsteret vist i FIG. 2B.

7. Pamoatsaltet av ketamin ifølge krav 2, hvori pamoatsaltet av R-ketamin er krystallinsk som har en spesifikk rotasjon av $[\alpha]_D^{25^\circ} = +67^\circ$ og et XRPD-mønster representert av minst ett av følgende:

- (i) XRPD-mønsteret omfattende én eller flere 2θ -verdier $\pm 0,2$ 2θ valgt fra 6,0, 10,8, 11,7, 12,0, 12,6, 13,1, 14,6, 15,0, 18,2, 19,3, 19,7, 20,6, 22,0, 22,9, 23,6, 24,1, 24,7, 25,2, 25,9, 27,3, 30,1, 31,6, 45,4, 56,4 og 75,2; og
- (ii) XRPD-mønsteret vist i FIG. 2C.

8. Pamoatsaltet av ketamin ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7, som har en renhet på over 95 %.

9. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ved behandling av en sykdom i sentralnervesystemet (CNS), omfattende administrering til et individ med behov derav av en effektiv mengde av den farmasøytiske sammensetningen, hvori den farmasøytiske sammensetningen omfatter pamoatsaltet av ketamin ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8 og en farmasøytisk akseptabel eksipiens derav.

10. Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 9, hvori CNS-sykdommen velges fra gruppen som består av alvorlig depressiv lidelse (MDD), MDD med overhengende risiko for selvmordstanker, behandlingsresistent depresjon (TRD), bipolar lidelse, obsessiv-kompulsiv lidelse, posttraumatisk stresslidelse (PTSD), autismespekterforstyrrelse, tinnitus, refraktær kronisk migrene, astma, angst, rusmisbruksforstyrrelser, alkoholbruksforstyrrelse, spiseforstyrrelser, refraktær status epilepticus, hjerneiskemi, Alzheimers sykdom, Parkinsons sykdom, hjerneslag, traumatisk hjerneskade, multippel sklerose og smerte.

11. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ved bedøvelse av et individ med behov derav, omfattende administrering til individet av en effektiv mengde av den farmasøytiske sammensetningen, hvori den farmasøytiske sammensetningen omfatter pamoatsaltet av ketamin ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8 og en farmasøytisk akseptabel eksipiens derav.

12. Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 9 til 11, hvori behandlingen av CNS-sykdommen eller bedøvelsen starter innen 24 timer og varer i minst 10 dager etter administrering av den farmasøytiske sammensetningen.