



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 2872139 B1

NORWAY

(19) NO  
(51) Int Cl.  
**A61K 31/4545 (2006.01)**  
**A61P25/24 (2006.01)**

**Norwegian Industrial Property Office**

---

(21)	Translation Published	2018.04.03
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2017.11.01
(86)	European Application Nr.	13816622.8
(86)	European Filing Date	2013.07.09
(87)	The European Application's Publication Date	2015.05.20
(30)	Priority	2012.07.12, US, 201261741114 P 2012.07.12, US, 201261741115 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	Glytech LLC, 2711 Centerville Rd., Wilmington DE 19087, US-USA
(72)	Inventor	JAVITT, Daniel,C., 800 Park Ave,apt 1803, Ft. Lee, NJ 07024, US-USA
(74)	Agent or Attorney	HÅMSØ PATENTBYRÅ AS, Postboks 171, 4301 SANDNES, Norge
(54)	Title	<b>COMPOSITION AND METHOD FOR TREATMENT OF DEPRESSION AND PSYCHOSIS IN HUMANS</b>
(56)	References Cited:	WO-A1-2012/104852, SAHINER ET AL.: 'Memantine Improves Learning In Kindled Rats' JOURNAL OF NEUROLOGICAL SCIENCES vol. 28, no. 3, 08 September 2011, pages 322 - 329, XP019925492, WO-A2-2005/000216, WO-A2-2005/065308, WO-A2-2006/058059, WO-A2-2011/044089, KR-A- 20070 017 136, US-A1- 2009 176 715, US-A1- 2011 207 776, US-A1- 2011 306 586, US-A1- 2012 041 026, ROGOZ Z ET AL: "Synergistic effect of uncompetitive NMDA receptor antagonists and antidepressant drugs in the forced swimming test in rats", NEUROPHARMACOLOGY, PERGAMON PRESS, OXFORD, GB, vol. 42, no. 8, 1 June 2002 (2002-06-01), pages 1024-1030, XP002288820, ISSN: 0028-3908, DOI: 10.1016/S0028-3908(02)00055-2, HERESCO-LEVY U ET AL: "Controlled trial of d-cycloserine adjuvant therapy for treatment-resistant major depressive disorder", JOURNAL OF AFFECTIVE DISORDERS, ELSEVIER BIOCHEMICAL PRESS, AMSTERDAM, NL, vol. 93, no. 1-3, 1 July 2006 (2006-07-01) , pages 239-243, XP024997304, ISSN: 0165-0327, DOI: 10.1016/J.JAD.2006.03.004 [retrieved on 2006-07-01], CRANE G E: "Cycloserine as an antidepressant agent", AMERICAN JOURNAL OF PSYCHIATRY, AMERICAN PSYCHIATRIC PUBLISHING, INC, US, vol. 115, no. 11, 1 May 1959 (1959-05-01), pages 1025-1026, XP009158563, ISSN: 0002-953X, ARDAYFIO PAUL A ET AL: "The 5-Hydroxytryptamine(2A) Receptor Antagonist R-(+)-alpha-(2,3-

Dimethoxyphenyl)-1-[2-(4-fluorophenyl) ethyl-4-piperidinemethanol (M100907) Attenuates Impulsivity after Both Drug-Induced Disruption (Dizocilpine) and Enhancement (Antidepressant Drugs) of Differential-Reinforcement-of-Low-Rate 72-s B", JOURNAL OF PHARMACOLOGY AND EXPERIMENTAL THERAPEUTICS, vol. 327, no. 3, December 2008 (2008-12), pages 891-897, XP002741249, ISSN: 0022-3565, GAISLER-SALOMON I ET AL: "Abnormally persistent latent inhibition induced by MK801 is reversed by risperidone and by positive modulators of NMDA receptor function: differential efficacy depending on the stage of the task at which they are administered", PSYCHOPHARMACOLOGY, vol. 196, no. 2, February 2008 (2008-02), pages 255-267, XP002741250, ISSN: 0033-3158, M. L. CARLSSON ET AL: "The 5-HT2A receptor antagonist M100907 is more effective in counteracting NMDA antagonist- than dopamine agonist-induced hyperactivity in mice", JOURNAL OF NEURAL TRANSMISSION, vol. 106, no. 2, 17 March 1999 (1999-03-17), pages 123-129, XP055040422, ISSN: 0300-9564, DOI: 10.1007/s007020050144, DE PAULIS T: "M-100907 (Aventis)", CURRENT OPINION IN INVESTIGATIONAL DRUGS, PHARMAPRESS, US, vol. 2, no. 1, 1 January 2001 (2001-01-01), pages 123-132, XP009108036, ISSN: 1472-4472, WO-A1-2013/138322

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/>

## P a t e n t k r a v

1. Sammensetning for anvendelse ved behandling av bivirkninger forbundet med medisiner administrert til et menneske underlagt behandling av psykiske lidelser, som omfatter en bivirkning som reduserer en effektiv mengde av en oral eller parenteral dosering som består av:
  - 5 - en første forbindelse valgt fra gruppen som består av en selektiv 5-HT2A-reseptorantagonist/inverse agonister; og
  - en andre forbindelse valgt fra gruppen som består av NMDAR-reseptorantagonister.
- 10 2. Sammensetningen ifølge krav 1 for anvendelse ved behandling av bivirkninger forbundet med medisiner administrert til et menneske underlagt behandling av psykiske lidelser, hvori NMDAR-reseptorantagonisten velges fra gruppen som består av ikke-selektive antagonister, selektive antagonister og kombinasjoner derav.
- 15 3. Sammensetningen ifølge krav 1 for anvendelse ved behandling av bivirkninger forbundet med medisiner administrert til et menneske underlagt behandling av psykiske lidelser, hvori den selektive 5-HT2A-reseptorantagonisten/inverse agonisten velges fra en gruppe som inkluderer MDL 100.907, pruvanserin, eplivanserin, CYR-101 og pimavanserin.
- 20 4. Sammensetningen ifølge krav 1 for anvendelse ved behandling av bivirkninger forbundet med medisiner administrert til et menneske underlagt behandling av psykiske lidelser, hvori NMDAR-antagonisten velges fra gruppen som består av antagonister av glysin-, glutamat- og kanalgjenkjennelsesstedene.
5. Sammensetningen ifølge krav 1 for anvendelse ved behandling av bivirkninger forbundet med medisiner administrert til et menneske underlagt behandling av psykiske lidelser, hvori NMDAR-antagonisten er selektiv for NMDAR som inneholder en NR2B-delenhet.
- 25 6. Sammensetningen ifølge krav 1 for anvendelse ved behandling av bivirkninger forbundet med medisiner administrert til et menneske underlagt behandling av psykiske lidelser, hvori NMDAR-antagonisten består av D-sykloserin, administrert i en dose på 500 mg/d eller høyere.
7. Sammensetningen ifølge krav 1 for anvendelse ved behandling av bivirkninger forbundet med medisiner administrert til et menneske underlagt behandling av psykiske lidelser, hvori NMDAR-antagonisten velges fra gruppen som består av CGS-19755, D-CPPene, MK-0657, AZD6765, Glyx-13, NRX- 1059, eller EVT-101.
- 30 8. Sammensetningen ifølge krav 1 for anvendelse ved behandling av bivirkninger forbundet med medisiner administrert til et menneske underlagt behandling av psykiske lidelser, formulert for oral, intramuskulær, intravenøs, intraperitoneal eller parenteral administrering.