(12) **Translation of European patent specification**

(11) **NO/EP 2872145 B1**

(19) NO

NORWAY

(51) Int Cl.
A61K 31/55 (2006.01)
A61P 25/14 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2022.06.13
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2022.03.09
(86)	European Application Nr.	13815988.4
(86)	European Filing Date	2013.07.12
(87)	The European Application's Publication Date	2015.05.20
(30)	Priority	2012.07.12, US, 201261671044 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	Emalex Biosciences, Inc., 330 North Wabash Avenue, Suite 3500, Chicago, IL 60611, USA
(72)	Inventor	CHIPKIN, Richard, E., 5266 Pooks Hill Road, Bethesda, MD 20814, USA KWAN, Rudolf, 9 Friar Tuck Circle, Summit, NJ 07901, USA
(74)	Agent or Attorney	Budde Schou A/S, Dronningens Tværgade 30, 1302 KØBENHAVN K, Danmark

(54) Title **FUSED BENZAZEPINES FOR TREATMENT OF TOURETTE'S SYNDROME**

(56) References Cited:

WO-A1-96/13257
WO-A1-2012/033874
WO-A1-2011/057199
DATABASE PUBMED [Online] 25 October 2006 XP055184772 Retrieved from NCBI Database accession no. 10591286 & ROMACH MK ET AL.: 'Attenuation of the euphoric effects of cocaine by the dopamine DI/D5 antagonist ecopipam (SCH 39166).' ARCH GEN PSYCHIATRY vol. 56, no. 12, 1999, pages 1101 - 1106
ANDREW C MCCREARY ET AL: "The thyrotrophin-releasing hormone analogue MK771 induces tic-like behaviours: the effects of dopamine D1 and D2 receptor antagonists", EUROPEAN JOURNAL OF PHARMACOLOGY, vol. 369, no. 1, 1 March 1999 (1999-03-01) , pages 1-9, XP055221494, NL ISSN: 0014-2999, DOI: 10.1016/S0014-2999(99)00039-4
Jang-Woo Shin ET AL: "Interpretation of Animal Dose and Human Equivalent Dose for Drug Development", The Journal of Korean Oriental Medicine, 1 May 2010 (2010-05-01), pages 1-7, XP55315075, Retrieved from the Internet: URL:http://jkom.org/upload/31-3 01 [01-07].pdf [retrieved on 2016-10-31]
QIANG L ET AL: "Discovery of new SCH 39166 analogs as potent and selective dopamine D1 receptor antagonists", BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS, PERGAMON, AMSTERDAM, NL, vol. 20, no. 3, 1 February 2010 (2010-02-01), pages 836-840, XP026861816,

ISSN: 0960-894X [retrieved on 2010-01-04]
ARNE ASTRUP ET AL: "'Randomized Controlled Trials of the D1/D5 Antagonist Ecopipam for Weight Loss in Obese Subjects", OBESITY RESEARCH, BATON ROUGE, LA, US, vol. 15, no. 7, 7 July 2007 (2007-07-07), pages 1717-1731, XP008156118, ISSN: 1071-7323, DOI: 10.1002/HBM.22021
Lynn Dunlap: "TSA, Psyadon to collaborate on drug trial", , May 2011 (2011-05), Retrieved from the Internet: URL:https://missouritsa.org/2011/05/12/tsa -psyadon-to-collaborate-on-drug-trial/ [retrieved on 2017-04-11]
Anonymous: "Clinica Trials Archive - History of Changes for Study: NCT01244633", , 8 May 2012 (2012-05-08), XP55738348, Retrieved from the Internet: URL:https://www.clinicaltrials.gov/ct2/his tory/NCT01244633?V_5=View#StudyPageTop [retrieved on 2020-10-09]
DURSUN S M ET AL: "SIMILARITIES IN THE PHARMACOLOGY OF SPONTANEOUS AND DOI-INDUCED HEAD-SHAKES SUGGEST 5HT2A RECEPTORS ARE ACTIVE UNDER PHYSIOLOGICAL CONDITIONS", PSYCHOPHARMACOLOGY, SPRINGER VERLAG, BERLIN, DE, vol. 128, no. 2, 1 January 1996 (1996-01-01), pages 198-205, XP001059606, ISSN: 0033-3158, DOI: 10.1007/S002130050125
ROGER KURLAN, M.D.: 'Tourette's Syndrome.' THE NEW ENGLAND JOURNAL OF MEDICINE vol. 363, 2010, pages 2332 - 2338, XP008176095 Retrieved from the Internet: <URL:http:JJwww.nejm.org/doi/full/ 10.1056lnejmcp 1007805>
REAGAN-SHAW SHANNON ET AL: "Dose translation from animal to human studies revisited.", FASEB JOURNAL : OFFICIAL PUBLICATION OF THE FEDERATION OF AMERICAN SOCIETIES FOR EXPERIMENTAL BIOLOGY MAR 2008, vol. 22, no. 3, March 2008 (2008-03), pages 659-661, ISSN: 1530-6860

Patentkrav

1. Forbindelse for anvendelse i behandlingen av Tourettes syndrom hos mennesker, hvori forbindelsen er ekopipam eller et farmasøytisk akseptabelt salt, solvat eller hydrat derav, hvori forbindelsen er for oral administrering i en dose på 50 mg til 100 mg/dag.

2. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvori individet ikke er eldre enn 17 år.

3. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1 til 2, hvori individet anses å være fri for oppmerksomhetsunderskudd-hyperaktivitetsforstyrrelse, depresjon og tvangslidelser.

4. Forbindelse for anvendelse ifølge kravene 1 til 3, hvori forbindelsen formuleres for oral levering.

5. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvori administrering av forbindelsen gjentas én, to eller tre ganger daglig.

6. Forbindelse for anvendelse ifølge kravene 1−5 for anvendelse i kombinasjon med en andre behandling, slik som atferdsterapi, kirurgisk eller farmasøytisk terapi for behandling av Tourettes syndrom.

7. Forbindelse for anvendelse ifølge kravene 1−2 eller 4−6 for anvendelse i kombinasjon med en terapeutisk effektiv mengde av en andre forbindelse for behandlingen av oppmerksomhetsunderskudd-hyperaktivitetsforstyrrelse, depresjon eller tvangslidelse.

8. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvori forbindelsen formuleres i en enhetsdoseform.

9. Forbindelse for anvendelse ifølge krav 1, hvori forbindelsen formuleres som en kapsel, tablett, piller, pulver eller sirup, eller for å gi rask, vedvarende eller forsinket frigjøring.