



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3057595 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/55 (2006.01)
A61K 31/519 (2006.01)
A61P 25/14 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2020.09.28
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.04.29
(86)	European Application Nr.	14854586.6
(86)	European Filing Date	2014.10.17
(87)	The European Application's Publication Date	2016.08.24
(30)	Priority	2013.10.18, US, 201361892841 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 N Wabash, Suite 3500, Chicago, IL 60611, USA
(72)	Inventor	CHIPKIN, Richard E., 5816 Cheshire Drive, Bethesda, Maryland 20814, USA
(74)	Agent or Attorney	Valet Patent Services, LLP, Siedlungsstrasse 4 A, 85253 ERDWEG, Tyskland

(54) Title **FUSED BENZAZEPINES FOR TREATMENT OF STUTTERING**

(56) References
Cited:

WO-A1-2012/033874
US-A1- 2011 206 782
US-A1- 2003 109 532
WO-A2-99/21540
US-A- 6 132 724
US-A1- 2010 273 767
Various: "Risperidone - Wikipedia", , 31 March 2017 (2017-03-31), XP055363361, Retrieved
from the Internet: URL:<https://en.wikipedia.org/wiki/Risperidone> [retrieved on 2017-04-10]
PETTERSSON I ET AL: "A study on the contribution of the 1-phenyl substituent to the molecular
electrostatic potentials of some benzazepines in relation to selective dopamine D-1 receptor
activity.", JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY 07 FEB 1992, vol. 35, no. 3, 7 February 1992
(1992-02-07), pages 502-507, XP002769138, ISSN: 0022-2623

MAGUIRE G A ET AL: "ALLEVIATING STUTTERING WITH PHARMACOLOGICAL INTERVENTIONS", EXPERT OPINION ON PHARMACOTHERAPY, ASHLEY PUBLICATIONS LTD, LONDON, UK, vol. 5, no. 7, 1 January 2004 (2004-01-01) , pages 1565-1571, XP009039827, ISSN: 1465-6566, DOI: 10.1517/14656566.5.7.1565

MAGUIRE GERALD A ET AL: "Risperidone for the treatment of stuttering", JOURNAL OF CLINICAL PSYCHOPHARMACOLOGY, vol. 20, no. 4, August 2000 (2000-08), pages 479-482, XP002769137, ISSN: 0271-0749

European Medicines Agency: "Zypadhera", , 25 April 2014 (2014-04-25), XP002769139, Retrieved from the Internet: URL:https://www.google.de/url?sa=t&rct=j&q=&esrc=s&source=web&cd=1&ved=0ahUKEwj7kbXN9ZnTAhULbhQKHak7CRgQFggjMAA&url=http%3A%2F%2Fwww.ema.europa.eu%2Fdocs%2Fen_GB%2Fdocument_library%2FEPAR_-_Assessment_Report_-_Variation%2Fhuman%2F000890%2FWC500169220.pdf&usq=AFQjCNEpOSWZkEvxojlReq0bCPRY6StPkQ&cad=rja [retrieved on 2017-04-10]

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.** Selektiv D1- og/eller selektiv D5-reseptorantagonist for anvendelse i behandling av stamming hos et individ.
- 2.** Den selektive D1- og/eller selektive D5-reseptorantagonisten for anvendelse ifølge krav 1, hvori individet er en mann.
- 3.** Den selektive D1- og/eller selektive D5-reseptorantagonisten for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 2, hvori individet ikke er eldre enn 17 år.
- 4.** Den selektive D1- og/eller selektive D5-reseptorantagonisten for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–3, hvori individet anses å være fritt for oppmerksomhetssvikt-hyperaktivitetslidelse, depresjon, Tourettes syndrom og tvangslidelse.
- 5.** Den selektive D1- og/eller selektive D5-reseptorantagonisten for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–4, hvori stammingen er forbundet med en utviklingsstammelidelse.
- 6.** Den selektive D1- og/eller selektive D5-reseptorantagonisten for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–4, hvori stammingen er forbundet med en nevrogen eller psykogen lidelse.
- 7.** Den selektive D1- og/eller selektive D5-reseptorantagonisten for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–3, 5 eller 6, hvori antagonisten omfatter ecopipam eller et farmasøytisk akseptabelt salt, solvat, hydrat, prodrug, strukturanalog eller polymorf derav.
- 8.** Den selektive D1- og/eller selektive D5-reseptorantagonisten for anvendelse ifølge krav 7, hvori antagonisten omfatter ecopipam eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

9. Den selektive D1- og/eller selektive D5-reseptorantagonisten for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–3 eller 5-8, hvori antagonisten formuleres for oral levering.

10. Den selektive D1- og/eller selektive D5-reseptorantagonisten for anvendelse ifølge kravene 8 eller 9, hvori antagonisten omfatter ecopipam eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav og formuleres for å administrere en dose på 1 mg/kg kroppsvekt per dag.

11. Den selektive D1- og/eller selektive D5-reseptorantagonisten for anvendelse ifølge kravene 8 eller 9, hvori antagonisten omfatter ecopipam eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav og formuleres for å administrere en dose på 2 mg/kg kroppsvekt per dag.

12. Den selektive D1- og/eller selektive D5-reseptorantagonisten for anvendelse ifølge krav 9, hvori antagonisten formuleres for å administrere en dose på ca. 0,01 mg/kg til ca. 500 mg/kg, og hvori dosen justeres avhengig av alder og kroppsvekt.

13. Den selektive D1- og/eller selektive D5-reseptorantagonisten for anvendelse ifølge krav 12, hvori antagonisten formuleres for å administrere en dose på ca. 0,01 mg/kg til ca. 50 mg/kg; ca. 0,01 mg/kg til ca. 5 mg/kg; eller ca. 0,1 mg/kg til ca. 5 mg/kg.

14. Den selektive D1- og/eller selektive D5-reseptorantagonisten for anvendelse ifølge krav 12, hvori antagonisten formuleres for å administrere en dose på ca. 5–100 mg/dag.

15. Den selektive D1- og/eller selektive D5-reseptorantagonisten for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–3 eller 5–14, hvori antagonisten formuleres til dose én gang daglig.

16. Den selektive D1- og/eller selektive D5-reseptorantagonisten for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–3 eller 5–15, hvori antagonisten er for

administrering sammen med en andre behandling for å behandle stammelidelsen.

17. Den selektive D1- og/eller selektive D5-reseptorantagonisten for anvendelse ifølge krav 16, hvori den andre behandlingen er en adferdsbehandling, kirurgisk behandling eller farmasøytisk behandling.