



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2187879 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

A61K 31/00 (2006.01)

A61K 9/00 (2006.01)

A61K 9/14 (2006.01)

A61K 9/16 (2006.01)

A61K 9/20 (2006.01)

A61K 9/48 (2006.01)

A61K 31/70 (2006.01)

A61K 31/7034 (2006.01)

A61P 3/04 (2006.01)

A61P 3/06 (2006.01)

A61P 3/10 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2017.01.09
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2016.10.12
(86)	European Application Nr.	08787264.4
(86)	European Filing Date	2008.08.15
(87)	The European Application's Publication Date	2010.05.26
(30)	Priority	2007.08.16, EP, 07114459
(84)	Designated Contracting States: Designated Extension States:	AT BE BG CH CY CZ DE DK EE ES FI FR GB GR HR HU IE IS IT LI LT LU LV MC MT NL NO PL PT RO SE SI SK TR BA RS
(73)	Proprietor	Boehringer Ingelheim International GmbH, Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, DE-Tyskland
(72)	Inventor	DUGI, Klaus, Boehringer Ingelheim GmbHCD PatentsBinger Strasse 173, 55216 Ingelheim Am Rhein, DE-Tyskland MARK, Michael, Boehringer Ingelheim GmbHCD PatentsBinger Strasse 173, 55216 Ingelheim Am Rhein, DE-Tyskland THOMAS, Leo, Boehringer Ingelheim GmbHCD PatentsBinger Strasse 173, 55216 Ingelheim Am Rhein, DE-Tyskland HIMMELSBACH, Frank, Boehringer Ingelheim GmbHCD PatentsBinger Strasse 173, 55216 Ingelheim Am Rhein, DE-Tyskland
(74)	Agent or Attorney	Bryn Aarflot AS, Postboks 449 Sentrum, 0104 OSLO, Norge

(54) Title **PHARMACEUTICAL COMPOSITION COMPRISING A GLUCOPYRANOSYL-SUBSTITUTED BENZENE DERIVATIVE**

(56) References
Cited:

EP-A- 1 406 873, EP-A- 1 500 403, EP-A- 1 586 571, WO-A-03/037327, WO-A-2004/018468
WO-A-2004/050658, WO-A-2005/000848, WO-A-2005/049022, WO-A-2005/085246
WO-A-2005/092877, WO-A-2005/116014, WO-A-2006/029769, WO-A-2006/040625
WO-A-2007/093610, WO-A-2007/128761, WO-A-2008/055870, WO-A-2008/055940
US-A1- 2002 137 903, US-A1- 2003 114 390, US-A1- 2007 060 530, US-A1- 2007 299 076
ANONYMOUS: "Addendum 1 to "The use of stems in the selection of International
Nonproprietary names (INN) for pharmaceutical substances""[Online] 19 June 2007 (2007-06-
19), pages 1-3, XP007906327 Retrieved from the Internet:
URL:[http://www.who.int/medicinedocs/index/ assoc/s14141e/s14141e.pdf](http://www.who.int/medicinedocs/index/assoc/s14141e/s14141e.pdf)> [retrieved on 2008-
11-11]

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. Farmasøytisk preparat som omfatter det glukopyranosyl-substituerte
5 benzenderivatet 1-klor-4-(β -D-glukopyranos-1-yl)-2-[4-((S)-tetrahydrofuran-3-yl
yloksy)-benzyl]-benzen i kombinasjon med DPP IV-inhibitoren 1-[(4-metyl-kinazolin-
2-yl)metyl]-3-metyl-7-(2-butyln-1-yl)-8-(3-(R)-amino-piperidin-1-yl)-xantin, eller et
farmasøytisk akseptabelt salt derav.
- 10 2. Farmasøytisk preparat ifølge krav 1, karakterisert ved at preparatet er egnet
for kombinert eller samtidig eller sekvensiell bruk av det glukopyranosyl-substituerte
benzenderivatet og DPP IV-inhibitoren.
- 15 3. Farmasøytisk preparat ifølge ett av de foregående krav, karakterisert ved at
det glukopyranosyl-substituerte benzenderivatet og DPP-IV-inhibitoren er tilstede i en
enkelt doseringsform.
- 20 4. Farmasøytisk preparat ifølge ett av de foregående krav, karakterisert ved at
det glukopyranosyl-substituerte benzenderivatet og DPP-IV-inhibitoren er tilstede i en
separat doseringsform.
5. Farmasøytisk preparat ifølge ett av de foregående krav, som omfatter en
mengde på 5 til 50 mg av det glukopyranosyl-substituerte benzenderivatet.
- 25 6. Farmasøytisk preparat ifølge krav 5, som omfatter en mengde på 5 mg, 10 mg,
15 mg, 20 mg, 25 mg eller 50 mg av det glukopyranosyl-substituerte benzen-
derivatet.
- 30 7. Farmasøytisk preparat ifølge ett av de foregående krav, som omfatter en
mengde på 0,5 til 10 mg av DPP IV-inhibitoren.
8. Farmasøytisk preparat ifølge krav 7, som omfatter en mengde på 1 mg, 2,5 mg
eller 5 mg av DPP IV-inhibitoren.
- 35 9. Farmasøytisk preparat ifølge krav 1, 2, 3 eller 4, som omfatter en mengde på 5
til 50 mg av det glukopyranosyl-substituerte benzenderivatet og en mengde på 0,5 til

10 mg av DPP IV-inhibitoren.

10. Farmasøytisk preparat ifølge hvilket som helst av de foregående krav, karakterisert ved at det farmasøytiske preparatet er formulert for oral administrering i fast form.
11. Farmasøytisk preparat ifølge ett av kravene 1 til 10 for anvendelse i
- å forebygge, bremse utviklingen av, forsinke eller behandle en metabolsk lidelse valgt fra gruppen bestående av type 1 diabetes mellitus, type 2 diabetes mellitus, svekket glukosetoleranse, svekket fastende blodglukose, hyperglykemi, postprandial hyperglykemi, overvekt, fedme og metabolsk syndrom; eller
 - å bedre glykemisk kontroll og/eller redusere fastende plasmaglukose, postprandial plasmaglukose og/eller glykosylert hemoglobin HbA1c; eller
 - å forebygge, bremse, forsinke eller reversere progresjon fra nedsatt glukosetoleranse, nedsatt fastende blodsukker, insulinresistens og/eller fra metabolsk syndrom til type 2 diabetes mellitus; eller
 - å forebygge, bremse utviklingen av, forsinke eller behandle en tilstand eller forstyrrelse valgt fra gruppen bestående av komplikasjoner ved diabetes mellitus så som grå stær og mikro- og makrovaskulære sykdommer så som nefropati, retinopati, neuropati, vevsiskemi, arteriosklerose, myokardialt infarkt, slag og perifer arteriell okklusiv sykdom; eller
 - å redusere kroppsvekt eller forebygge en økning i kroppsvekt eller tilrettelegge for en reduksjon i kroppsvekt; eller
 - å forebygge, bremse, forsinke eller behandle degenerasjon av betaceller i bukspyttkjertelen og/eller den nedsatte funksjonaliteten til betaceller i bukspyttkjertelen og/eller for å forbedre og/eller gjenopprette funksjonaliteten til betaceller i bukspyttkjertelen og/eller gjenopprette funksjonaliteten til bukspyttkjertelens insulinsekresjon; eller
 - å forebygge, redusere, forsinke eller behandle sykdommer eller tilstander som skyldes en unormal akkumulering av fett i leveren; eller
 - å opprettholde og/eller forbedre insulinsensitiviteten og/eller behandle eller forebygge hyperinsulinemi og/eller insulinresistens;

i en pasient med behov for dette.

12. Farmasøytisk preparat ifølge krav 11, for anvendelse i forbedringen av glykemisk kontroll i pasienter med type 2 diabetes mellitus.

5

13. Farmasøytisk preparat for anvendelse ifølge krav 11 eller 12, karakterisert ved at det glukopyranosyl-substituerte benzenderivatet administreres i kombinasjon eller alternering med DPP IV-inhibitoren.

10

14. Farmasøytisk preparat for anvendelse ifølge krav 11, 12 eller 13, hvor pasienten er et individ som er diagnostisert med en eller flere av tilstandene valgt fra gruppen bestående av overvekt, fedme, visceral fedme og abdominal fedme.

15

15. Farmasøytisk preparat for anvendelse ifølge krav 11, 12 eller 13, hvor pasienten er et individ som viser en, to eller flere av de følgende tilstander:

(a) en fastende blodglukose- eller serumglukosekonsentrasjon som er større enn 110 mg/dl, spesielt større enn 125 mg/dl;

(b) en postprandial plasmaglukose som er lik eller større enn 140 mg/dl;

(c) en HbA1c verdi som er lik eller større enn 6,5%, spesielt lik eller større enn 8,0%.

20

16. Farmasøytisk preparat for anvendelse ifølge krav 11, 12 eller 13, hvor pasienten er et individ hvor en, to, tre eller flere av de følgende betingelser er til stede:

25

(a) fedme, visceral fedme og/eller abdominal fedme,

(b) triglyserid blodnivå ≥ 150 mg/dl,

(c) HDL-kolesterol blodnivå < 40 mg/dl hos kvinnelige pasienter og < 50 mg/dl hos mannlige pasienter,

30

(d) et systolisk blodtrykk ≥ 130 mm Hg og diastolisk blodtrykk ≥ 85 mm Hg,

(e) et fastende blodsukkernivå ≥ 110 mg/dl.

17. Farmasøytisk preparat for anvendelse ifølge krav 11, 12 eller 13, hvor pasienten er et individ for hvem monoterapien med metformin er kontraindisert, og/eller som har en intoleranse mot metformin ved terapeutiske doser.
- 5 18. Farmasøytisk preparat for anvendelse ifølge krav 11, 12 eller 13, hvor pasienten er et individ med utilstrekkelig glykemisk kontroll til tross for monoterapi med en SGLT2-inhibitor, særlig det glukopyranosyl-substituerte benzenderivatet ifølge krav 1.
- 10 19. Farmasøytisk preparat for anvendelse ifølge krav 11, 12 eller 13, hvor pasienten er et individ med utilstrekkelig glykemisk kontroll til tross for monoterapi med en DPP IV inhibitor, spesielt DPP-IV-inhibitoren ifølge krav 1.