



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2482806 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/20 (2006.01)
A61K 9/24 (2006.01)
A61K 9/28 (2006.01)
A61K 31/155 (2006.01)
A61K 31/351 (2006.01)
A61K 45/06 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2017.02.20
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2016.12.14
(86)	European Application Nr.	10759923.5
(86)	European Filing Date	2010.10.01
(87)	The European Application's Publication Date	2012.08.08
(30)	Priority	2009.10.02, EP, 09172081
(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
	Designated Extension States:	BA ME
(73)	Proprietor	Boehringer Ingelheim International GmbH, Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, DE-Tyskland
(72)	Inventor	SCHNEIDER, Peter, Boehringer Ingelheim GmbHCorporate PatentsBinger Str. 173, 55216 Ingelheim am Rhein, DE-Tyskland EISENREICH, Wolfram, Boehringer Ingelheim GmbHCorporate PatentsBinger Str. 173, 55216 Ingelheim am Rhein, DE-Tyskland PEARNOB, Nantharat, Boehringer Ingelheim GmbHCorporate PatentsBinger Str. 173, 55216 Ingelheim am Rhein, DE-Tyskland
(74)	Agent or Attorney	Bryn Aarflot AS, Postboks 449 Sentrum, 0104 OSLO, Norge

(54)	Title	PHARMACEUTICAL COMPOSITION, PHARMACEUTICAL DOSAGE FORM, PROCESS FOR THEIR PREPARATION, METHODS FOR TREATING AND USES THEREOF
(56)	References Cited:	WO-A1-03/099836 WO-A1-2008/101943 WO-A1-2008/116179 WO-A2-2007/128761 WO-A2-2008/055940 HUSSEY ELIZABETH K ET AL: "Safety, Pharmacokinetics and Pharmacodynamics of Remogliflozin Etaborate (SGLT2 Inhibitor) and Metformin When Co-Administered in Type 2 Diabetes Mellitus (T2DM) Patients", DIABETES, AMERICAN DIABETES ASSOCIATION, US, vol. 58, no. Suppl. 1, 9 June 2009 (2009-06-09), page A157, XP009136671, ISSN: 0012-1797

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. Fast farmasøytisk preparat omfattende SGLT-2 inhibitoren 1-klor-4-(β -D-glukopyranos-1-yl)-2-[4-((S)-tetrahydrofuran-3-yloksy)-benzyl]-benzen, metforminhydroklorid og ett eller flere farmasøytiske eksipienser,
 5 hvori SGLT-2 inhibitoren er tilstede i en dosestyrke på 5 mg eller 12,5 mg og hvori metforminhydroklorid er tilstede i en dosestyrke på 500 mg, 850 mg eller 1000 mg, og
 10 hvori det faste farmasøytiske preparatet omfatter kopovidon som et bindemiddel.
2. Farmasøytisk preparat ifølge krav 1, hvori eksipiensene er valgt fra gruppen bestående av ett eller flere fyllstoffer omfattende mikrokrySTALLinsk cellulose; D-mannitol, maisstivelse og pregelatinert stivelse; et bindemiddel omfattende
 15 kopovidon; et smøremiddel omfattende magnesiumstearat eller natrium-stearylfumarat; og et glidemiddel omfattende kolloidal vannfri silika.
3. Farmasøytisk preparat ifølge krav 2, som videre omfatter én eller flere av de følgende: fyllstoffet maisstivelse, smøremiddelet magnesiumstearat eller natrium-stearylfumarat og glidemiddelet kolloidal vannfri silika.
 20
4. Farmasøytisk preparatet ifølge krav 2, som videre omfatter én eller flere av de følgende: fyllstoffet mikrokrySTALLinsk cellulose, smøremiddelet magnesiumstearat eller natrium-stearylfumarat og glidemiddelet kolloidal vannfri silika.
 25
5. Fast farmasøytisk preparat ifølge ett eller flere av de foregående krav, omfattende én eller flere av de følgende mengder (vekt% av total belagt tablettmasse):

0,1-2,11%	SGLT-2 inhibitor,
47-88 %	metformin HCl,
3,9-8,3 %	bindemiddel (f.eks. kopovidon),
2,3-8,0 %	fyllstoff 1 (f.eks. maisstivelse),
0-4,4 %	fyllstoff 2 (f.eks. pregelatinert stivelse),
0-33 %	fyllstoff 3 (f.eks. D-mannitol),

0,7-1,5 %	smøremiddel (f.eks. magnesiumstearat),
0,05-0,5 %	glidemiddel (f.eks. kolloidal vannfri silika),
0,00-3,0 %	desintegreringsmiddel (f.eks. krysspovidon eller krysskarmellosenatrium)

- 5 6. Fast farmasøytisk preparat ifølge ett eller flere av de foregående krav, omfattende én eller flere av de følgende mengder (vekt% av total belagt tablett-masse):

0,1-2,11 %	SGLT-2 inhibitor,
47-88 %	metformin HCl,
3,9-8,3 %	kopovidon som et bindemiddel,
2,3-8,0 %	maisstivelse som et fyllstoff,
0-4,4 %	pregelatinert stivelse som et fyllstoff,
0-33 %	D-mannitol som et fyllstoff,
0,7-1,5 %	magnesiumstearat som et smøremiddel,
0,05-0,5 %	kolloidal vannfri silika som et glidemiddel,
0,00-3,0 %	krysspovidon eller krysskarmellosenatrium som et desintegreringsmiddel.

- 10 7. Farmasøytisk preparatet ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 6 i doseformen av en tablett.

8. Farmasøytisk doseform omfattende et farmasøytisk preparat ifølge ett eller flere av kravene 1 til 7, karakterisert ved at den er en fast farmasøytisk doseform og den er en kapsel eller en tablett.

- 15 9. Farmasøytisk preparat ifølge ett av kravene 1 til 7 for anvendelse for
- forhindring av, moderering av progresjonen av, utsettelse av eller behandling av en metabolsk lidelse valgt fra gruppen bestående av type 1 diabetes mellitus, type 2 diabetes mellitus, svekket glukosetoleranse, svekket fastende blodsukker, hyperglykemi, postprandial hyperglykemi, overvekt, fedme og
- 20 metabolsk syndrom; eller

- forbedring av glykemisk kontroll og/eller for reduksjon av fastende plasma-glukose, av postprandial plasmaglukose og/eller av glykosylert hemoglobin HbA1c; eller

5 - forhindring av, moderering av, utsettelse av eller reversering av progresjonen fra svekket glukosetoleranse, insulinresistens og/eller fra metabolsk syndrom til type 2 diabetes mellitus; eller

10 - forhindring av, moderering av progresjonen av, utsettelse av eller behandling av en tilstand eller lidelse valgt fra gruppen bestående av komplikasjoner ved diabetes mellitus så som katarakter og mikro- og makrovaskulære sykdommer så som nefropati, retinopati, nevropati, vevsiskemi, arteriosklerose, myokardialt infarkt, slag og perifer arteriell okklusiv sykdom; eller

15 - forhindring av, moderering av, utsettelse av eller behandling av degenerasjonen av pankreatiske betaceller og/eller nedgangen i funksjonaliteten til pankreatiske betaceller og/eller for å forbedre og/eller gjenopprette funksjonaliteten til pankreatiske betaceller og/eller gjenopprette funksjonaliteten til pankreatisk insulinsekresjon; eller

- forhindring av, moderering av, utsettelse av eller behandling av sykdommer eller lidelser som skyldes en unormal akkumulering av lever- fett; eller

20 - opprettholdelse av og/eller forbedring av insulinsensitivitet og/eller for behandling eller forhindring av hyperinsulinemi og/eller insulinresistens;

hos en pasient med behov for dette.

25 10. Farmasøytisk preparat for anvendelsen ifølge krav 9, hvori pasienten er et individ som er diagnostisert med én eller flere av tilstandene valgt fra gruppen bestående av overvekt, fedme, visceral fedme og abdominal fedme.

11. Farmasøytisk preparat for anvendelsen ifølge krav 9, hvori pasienten er et individ som viser én, to eller flere av de følgende tilstander:

30 (a) en fastende blodsukker- eller serumglukose-konsentrasjon 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 7,0 %.

5 12. Farmasøytisk preparat for anvendelsen ifølge krav 9, hvori pasienten er et individ hvori én, to, tre eller flere av de følgende tilstander er tilstede:

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

(b) triglycerid-blodnivå ≥ 150 mg/dl,

(c) HDL-kolesterol blodnivå < 40 mg/dl i kvinnelig pasienter og < 50 mg/dl i mannlig pasienter,

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

(e) et fastende blodsukker nivå ≥ 110 mg/dl.

15 13. Farmasøytisk preparat for anvendelsen ifølge krav 9, hvori pasienten har utilstrekkelig glykemisk kontroll til tross for diett og mosjon eller til tross for monoterapi med en antidiabetisk middel, spesielt med metformin.