



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2506844 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/138 (2006.01)
A61K 31/439 (2006.01)
A61K 45/06 (2006.01)
A61P 11/06 (2006.01)
A61P 11/08 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2018.04.16
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2017.12.20
(86)	European Application Nr.	10781527.6
(86)	European Filing Date	2010.11.29
(87)	The European Application's Publication Date	2012.10.10
(30)	Priority	2009.12.01, GB, 0921075
(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	Glaxo Group Limited, 980 Great West Road, Brentford, Middlesex TW8 9GS, GB-Storbritannia
(72)	Inventor	BAKER, Darrell, GlaxoSmithKlineIronbridge Road, Uxbridge Middlesex UB11 1BS, GB-Storbritannia BRUCE, Mark, GlaxoSmithKlineGunners Wood Road, Stevenage Hertfordshire SG1 2NY, GB-Storbritannia CRATER, Glenn, GlaxoSmithKlineFive Moore DriveP O Box 13398Research Triangle Park, North Carolina 27709-3398, US-USA NOGA, Brian, c/o GlaxoSmithKlineFive Moore DriveP O Box 13398Research Triangle Park, North Carolina 27709-3398, US-USA THOMAS, Marian, GlaxoSmithKlinePark Road, Ware Hertfordshire SG12 0DJ, GB-Storbritannia WIRE, Patrick, GlaxoSmithKlineFive Moore DriveP O Box 13398Research Triangle Park, North Carolina 27709-3398, US-USA
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Postboks 449 Sentrum, 0104 OSLO, Norge

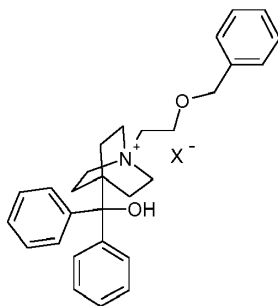
(54)	Title	Combinations of a muscarinic receptor antagonist and a beta-2 adrenoreceptor agonist
(56)	References Cited:	WO-A1-03/024439, WO-A1-2005/037280, WO-A1-2005/115463, LAINE, DRAMANE I. ET AL: "Discovery of Novel 1-Azoniabicyclo[2.2.2]octane Muscarinic Acetylcholine Receptor

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 kombinasjonsprodukt for anvendelse ved behandling av kronisk obstruktiv lungesykdom (COPD) og/eller astma, hvor produktet omfatter

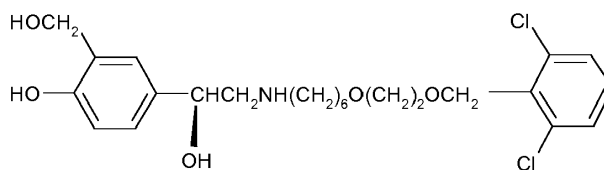
5 a) en forbindelse med formelen:



(Forbindelse (I))

hvor X⁻ er et farmasøytisk akseptabelt anion; og

10 b) en forbindelse med formelen:



15 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav (forbindelse (II)); og videre hvor produktet administreres en gang per dag.

2. Produkt for anvendelse ifølge krav 1, hvor det farmasøytisk aksepterbare anionet for forbindelse (I) er valgt fra gruppen bestående av klorid, bromid, jodid, hydroksyd, sulfat, nitrat, fosfat, acetat, trifluoracetat, fumarat, citrat, tartrat, oksalat, succinat, mandelat, metansulfonat eller p-toluensulfonat.

3. Produkt for anvendelse ifølge krav 1 eller 2, hvor forbindelsen (I) er 4-[hydroksy (difenyl)metyl]-1-{2-[(fenylmetyl)oksy]etyl}-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktanbromid.

4. Produkt for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvor forbindelse (II) er 4-{(1*R*)-2-[(6-{2-[(2,6-diklorbenzyl)oksy]etoksy}heksyl)amino]-1-

hydroksyetyl}-2-(hydroksymetyl)fenoltrifenylacetat.

5. Produkt for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, hvor forbindelse (I) og forbindelse (II) presenteres i en form tilpasset for separat, sekvensiell eller samtidig administrering.

6. Produkt for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5, i en form som er egnet for administrering ved inhalasjon via en medikamentdispenser valgt fra en inhalator for tørrpulver i en beholder, en tørrpulverinhalator i enhetsdose, et forhåndsmålt flerdose tørrpulverinhalator, en nasal inhalator eller en trykksatt doseinhalator.

7. Produkt for anvendelse ifølge krav 6, hvor forbindelse (I) og forbindelse (II) presenteres i separate tørrpulversammensetninger eller en blandet tørrpulversammensetning.

8. Produkt for anvendelse ifølge krav 7, hvor hver sammensetning inneholder en bærer, som er laktose.

9. Produkt for anvendelse ifølge krav 7 eller 8, hvor hver sammensetning inneholder et ternært middel.

10. Produkt for anvendelse ifølge krav 9, hvor det ternære middel er magnesiumstearat, som er tilstede i en mengde på ca. 0,6 vekt% i sammensetningen av forbindelse (I) og/eller en mengde på ca. 1,0 vekt% i en sammensetning av forbindelse (II).

11. Produkt for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 7 til 10, hvor de separate sammensetninger er i enhetsdoseform, og videre hvor enhetsdoseformen er en kapsel, patron eller blisterpakning.

12. Produkt for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 11, hvor forbindelse (I) er tilstede i en mengde på 125 mg/dose (av det frie kation) eller 62,5 mg/dose (av det frie kation).

13. Produkt for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 12, hvor forbindelse (II) er tilstede i en mengde på 25 mg/dose (av den frie base).

14. Produkt for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 13, hvor 4-[hydroksy(difenyl)metyl]-1-{2-[(fenylmetyl)oksy]etyl}-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktanbromid og 4-{(1R)-2-[(6-{2-[(2,6-diklorbenzyl)oksy]etoksy}heksyl)amino]-1-hydroksyetyl}-2-(hydroksymetyl)fenoltrifenylacetat er de eneste aktive bestanddelene.

15. Produkt for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 13, som videre omfatter 6 α ,9 α -difluor-17 α -[(2-furanylkarbonyl)oksy]-11 β -hydroksy-16 α -metyl-3-okso-androsta-1,4-dien-17 β -karbotiosyre-S-fluormetylester (flutikasonfuroat).

16. Produkt for anvendelse ifølge krav 15, hvor 6 α ,9 α -difluor-17 α -[(2-furanylkarbonyl)-oksy]-11 β -hydroksy-16 α -metyl-3-okso-androsta-1,4-dien-17 β -karbotiosyre-S-fluormetylester (flutikasonfuroat) er tilstede i en mengde på 100mcg/dose.

17. Produkt for anvendelse ifølge krav 15 eller 16, omfattende 4-[hydroksy(difenyl)-metyl]-1-{2-[(fenylmetyl)oksy]etyl}-1-azoniabicyklo[2.2.2]oktanbromid, 4-{(1R)-2-[(6-{2-[(2,6-diklorbenzyl)oksy]etoksy}heksyl)amino]-1-hydroksyetyl}-2-(hydroksymetyl)-fenoltrifenylacetat, og 6 α ,9 α -difluoro-17 α -[(2-furanylkarbonyl)oksy]-11 β -hydroksy-16 α -metyl-3-okso-androsta-1,4-dien-17 β -karbotiosyre-S-fluormetylester (flutikasonfuroat).

18. Produkt for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 17, for behandling av kronisk obstruktiv lungesykdom (COPD).