



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 2729151 B1

NORWAY

(19) NO  
(51) Int Cl.  
**A61K 31/7004 (2006.01)**  
**A61P 13/00 (2006.01)**

**Norwegian Industrial Property Office**

---

|      |                                                                            |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |
|------|----------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| (45) | Translation Published                                                      | 2021.07.12                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |
| (80) | Date of The European<br>Patent Office Publication of<br>the Granted Patent | 2021.03.31                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |
| (86) | European Application Nr.                                                   | 12730993.8                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |
| (86) | European Filing Date                                                       | 2012.07.03                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |
| (87) | The European Application's<br>Publication Date                             | 2014.05.14                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |
| (30) | Priority                                                                   | 2011.07.08, US, 201161505598 P                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |
| (84) | Designated Contracting<br>States:                                          | AL ; AT ; BE ; BG ; CH ; CY ; CZ ; DE ; DK ; EE ; ES ; FI ; FR ; GB ; GR ; HR ; HU ;<br>IE ; IS ; IT ; LI ; LT ; LU ; LV ; MC ; MK ; MT ; NL ; NO ; PL ; PT ; RO ; RS ; SE ; SI ;<br>SK ; SM ; TR                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         |
| (73) | Proprietor                                                                 | Boehringer Ingelheim International GmbH, Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am<br>Rhein, Tyskland                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |
| (72) | Inventor                                                                   | BROEDL, Uli, Boehringer Ingelheim GmbHCorporate PatentsBinger Strasse 173,<br>55216 Ingelheim Am Rhein, Tyskland<br>VON EYNATTEN, Maximilian, Boehringer Ingelheim GmbHCorporate PatentsBinger<br>Strasse 173, 55216 Ingelheim Am Rhein, Tyskland<br>JOHANSEN, Odd-Erik, Boehringer Ingelheim GmbHCorporate PatentsBinger<br>Strasse 173, 55216 Ingelheim Am Rhein, Tyskland<br>KLEIN, Thomas, Boehringer Ingelheim GmbHCorporate PatentsBinger Strasse 173,<br>55216 Ingelheim Am Rhein, Tyskland<br>LUIPPOLD, Gerd, Boehringer Ingelheim GmbHCorporate PatentsBinger Strasse<br>173, 55216 Ingelheim Am Rhein, Tyskland |
| (74) | Agent or Attorney                                                          | BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |

---

|      |       |                                                                          |
|------|-------|--------------------------------------------------------------------------|
| (54) | Title | <b>PHARMACEUTICAL COMPOSITION, METHODS FOR TREATING AND USES THEREOF</b> |
|------|-------|--------------------------------------------------------------------------|

|      |                      |                                                                                                                                                                                                                                                                     |
|------|----------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| (56) | References<br>Cited: | WO-A2-2008/055940<br>CHERNEY DAVID Z I ET AL: "Renal Hemodynamic Effect of Sodium-Glucose Cotransporter 2<br>Inhibition in Patients With Type 1 Diabetes Mellitus", CIRCULATION, vol. 129, no. 5, February<br>2014 (2014-02), pages 587-597, ISSN: 0009-7322(print) |
|------|----------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|

VALLON VOLKER ET AL: "Glomerular hyperfiltration in experimental diabetes mellitus: Potential role of tubular reabsorption", JOURNAL OF THE AMERICAN SOCIETY OF NEPHROLOGY, vol. 10, no. 12, December 1999 (1999-12), pages 2569-2576, XP009161748, ISSN: 1046-6673  
YAO CHUN-HSU ET AL: "Discovery of Novel N-beta-D-Xylosylindole Derivatives as Sodium-Dependent Glucose Cotransporter 2 (SGLT2) Inhibitors for the Management of Hyperglycemia in Diabetes", JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, vol. 54, no. 1, January 2011 (2011-01), pages 166-178, XP009161759, ISSN: 0022-2623  
R Grempler ET AL: "Empagliflozin, a novel selective sodium glucose cotransporter-2 (SGLT-2) inhibitor: characterisation and comparison with other SGLT-2 inhibitors Introduction", Diabetes Obesity and Metabolism June, vol. 14, 1 January 2012 (2012-01-01), pages 83-90, XP055228524, DOI: 10.1111/j.1463-1326.2011.01517.x

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 sammensetning omfattende SGLT2-hemmeren 1-klor-4-( $\beta$ -D-glukopyranos-1-yl)-2-[4-((S)-tetrahydrofuran-3-yloxy)-benzyl]-benzen for anvendelse  
5 i en metode for å forebygge, bremse progresjonen av, forsinke eller behandle nyrehyperfiltrativ skade hos en pasient diagnostisert med type 1 diabetes mellitus med behov for det.
2. Farmasøytisk sammensetning omfattende SGLT2-hemmeren 1-klor-4-( $\beta$ -D-glukopyranos-1-yl)-2-[4-((S)-tetrahydrofuran-3-yloxy)-benzyl]-benzen for anvendelse  
10 i en metode for å forebygge, bremse progresjonen av, forsinke eller behandle nyrehyperfiltrering hos en pasient diagnostisert med type 1 diabetes mellitus.
3. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse i en fremgangsmåte ifølge krav 1 eller  
15 2, hvor pasienten er et individ diagnostisert med eller som viser én eller flere av følgende tilstander:
- (a) diabetes mellitus;
  - (b) medfødt eller ervervet obstruktiv uro/nefropati;
  - (c) progressiv kronisk nyresykdom (CKD);
  - 20 (d) akutt nyresvikt (ARF);
  - (e) nyretransplantasjonsmottakere;
  - (f) nyretransplantasjondonorer; eller
  - (g) unilaterale helt eller delvis nefrektomiserte pasienter.
- 25
4. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse i en fremgangsmåte ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, hvor pasienten har en GFR lik eller høyere enn 125 ml/min/1,73 m<sup>2</sup>.
- 30
5. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse i en fremgangsmåte ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, hvor pasienten har en GFR lik eller høyere enn 140 ml/min/1,73 m<sup>2</sup>.
- 35
6. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse i en fremgangsmåte ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, hvor pasienten:
- (1) er et individ diagnostisert med én eller flere av tilstandene valgt fra gruppen bestående av overvekt, fedme, visceral fedme og abdominal fedme; eller

(2) er et individ som viser én, to eller flere av følgende tilstander:

- (a) en fastende blodsukker- eller serumglukosekonsentrasjon høyere enn 100 mg/dL, spesielt høyere enn 125 mg/dL;
- (b) en postprandial plasmaglukose lik eller høyere enn 140 mg/dL;
- 5 (c) en HbA1c-verdi lik eller høyere enn 6,0%, lik eller høyere enn 6,5%, eller lik eller høyere enn 8,0%; eller

(3) er et individ der én, to, tre eller flere av følgende tilstander er til stede:

- (a) fedme, visceral fedme og/eller abdominal fedme,
- (b) triglyseridblodnivå  $\geq 150$  mg/dL,
- 10 (c) HDL-kolesterol blodnivå  $<40$  mg/dL hos kvinnelige pasienter og  $<50$  mg/dL hos mannlige pasienter,
- (d) et systolisk blodtrykk  $\geq 130$  mm Hg og et diastolisk blodtrykk  $\geq 85$  mm Hg,
- (e) et fastende blodsukkernivå  $\geq 100$  mg/dL; eller

(4) er et individ med sykelig fedme.

15

7. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse i en fremgangsmåte ifølge hvilket som helst av de foregående krav, hvori den farmasøytiske sammensetningen i tillegg omfatter én eller flere farmasøytisk akseptable bærere.

20

8. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse i en fremgangsmåte ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, hvor den farmasøytiske sammensetningen omfatter SGLT-2-hemmeren i et område fra 1 mg til 25 mg.

25

9. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse i en fremgangsmåte ifølge hvilket som helst av de foregående krav, hvor den farmasøytiske sammensetningen omfatter 1 mg, 2,5 mg, 5 mg, 7,5 mg, 10 mg, 12,5 mg, 15 mg, 20 mg eller 25 mg av SGLT-2-hemmeren.