



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2833864 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/20 (2006.01)
A61K 9/16 (2006.01)
A61K 9/28 (2006.01)
A61K 9/48 (2006.01)
A61K 31/4545 (2006.01)
A61P 29/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21) Translation Published 2019.03.18

(80) Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent 2018.12.19

(86) European Application Nr. 13714618.9

(86) European Filing Date 2013.04.02

(87) The European Application's Publication Date 2015.02.11

(30) Priority 2012.04.04, EP, 12163078

(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 Alkahest, Inc., 125 Shoreway Road, Suite D, San Carlos, CA 94070, USA

(72) Inventor FETSCHER, Alfred, Boehringer Ingelheim GmbH Corporate Patents Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim Am Rhein, Tyskland
SCHER, Jochen Matthias, Boehringer Ingelheim GmbH Corporate Patents Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim Am Rhein, Tyskland

(74) Agent or Attorney CURO AS, Vestre Rosten 81, 7075 TILLER, Norge

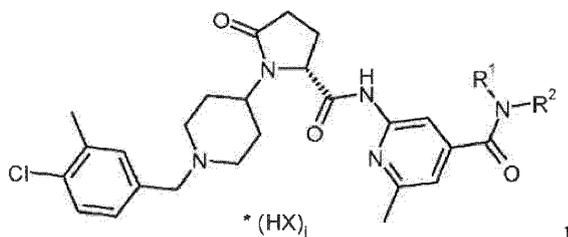
(54) Title **PHARMACEUTICAL FORMULATIONS COMPRISING CCR3 ANTAGONISTS**

(56) References Cited: WO-A1-2010/115836

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 blanding, som en aktiv bestanddel omfatter en forbindelse med formel 1



hvor

5 R¹ er H, C₁₋₆-alkyl, C₀₋₄-alkyl-C₃₋₆-sykloalkyl, C₁₋₆-haloalkyl;

R² er H, C₁₋₆-alkyl;

X er et anion valgt fra gruppen bestående av klorid eller ½ dibenzoyltartrat j er 1 eller 2,

et første fortynningsmiddel, et andre fortynningsmiddel, et desintegreringsmiddel, et smøremiddel og valgfritt et bindemiddel, hvori den farmasøytiske blandingen omfatter

10 10-90 % aktiv bestanddel,

5-70 % første fortynningsmiddel,

5-30 % andre fortynningsmiddel,

0-30 % bindemiddel,

1-12 % desintegreringsmiddel, og

15 0,1-3 % smøremiddel,

hvor det første og det andre fortynningsmidlet er valgt fra gruppen bestående av cellulosepulver, vannfritt dibasisk kalsiumfosfat, dibasisk kalsiumfosfat-dihydrat, erythritol, lav-substituert hydroksypropyl-cellulose, mannitol, pregelatinisert stivelse eller xylitol,

hvor minst ett av nevnte første og andre fortynningsmiddel er vannfritt dibasisk kalsiumfosfat, og

20

hvor den farmasøytiske blandingen i doseringsformen er en filmbelagt tablett som omfatter 2-4% filmbelegg.

2. Farmasøytisk blanding ifølge krav 1, hvor

R¹ er H, metyl;

25 R² er H, metyl;

X er et anion valgt fra gruppen bestående av klorid eller $\frac{1}{2}$ dibenzoyltartrat;

j er 1 eller 2.

3. Farmasøytisk blanding ifølge kravene 1 eller 2, hvori X er klorid og j er 2.
4. Farmasøytisk blanding ifølge ett av kravene 1 til 3, omfatter et ekstra desintegreringsmiddel.
- 5 5. Farmasøytisk blanding ifølge ett av kravene 1 til 4, omfatter et ekstra glidemiddel.
6. Farmasøytisk blanding ifølge ett av kravene 1 til 5, hvori smøremidlet er talkum, polyetylenglykol, kalsiumbehenat, kalsiumstearat, hydrogenert castorolje eller magnesiumstearat.
7. Farmasøytisk blanding ifølge kravene 1 til 6, hvori bindemidlet er kopovidon (ko-polymerisater av vinylpyrrolidon med andre vinylderivater), hydroksypropyl-metylcellulose (HPMC), hydroksypropyl-cellulose (HPC) eller polyvinyl-pyrrolidon (Povidon).
- 10 8. Farmasøytisk blanding ifølge ett av kravene 1 til 7, hvori desintegreringsmidlet er krysskarmelosenatrium.
9. Farmasøytisk blanding ifølge ett av kravene 1 til 8, hvori det valgfrie glidemidlet er kolloidal silisiumdioksid.
- 15 10. Farmasøytisk blanding ifølge krav 4, hvori det ekstra desintegreringsmidlet er krysspovidon.
11. Farmasøytisk blanding ifølge krav 1, hvori filmbelegget omfatter et filmdannende middel, en mykner, et glidemiddel og valgfritt ett eller flere pigmenter.
12. Farmasøytisk blanding ifølge krav 11, hvori filmbelegget omfatter Polyvinyl-alkohol (PVA) eller hydroksypropyl-metylcellulose (HPMC), polyetylenglykol (PEG), talkum, titan-dioksid og jernoksid.