



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2981255 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

A61K 31/155 (2006.01)

A61K 31/7048 (2006.01)

A61P 3/10 (2006.01)

A61K 31/522 (2006.01)

A61K 45/06 (2006.01)

A61P 9/10 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

- (45) Translation Published 2022.12.12
- (80) Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent 2022.09.14
- (86) European Application Nr. 14715274.8
- (86) European Filing Date 2014.04.03
- (87) The European Application's Publication Date 2016.02.10
- (30) Priority 2013.04.10, CA, 2812016
2013.04.05, US, 201361808807 P
2013.05.14, US, 201361823041 P
2013.06.17, US, 201361835809 P
2013.06.17, US, 201361835811 P
2014.02.20, US, 201461942301 P
- (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 Boehringer Ingelheim International GmbH, Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, Tyskland
- (72) Inventor BROEDL, Uli Christian, Boehringer Ingelheim GmbH Corporate Patents Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim Am Rhein, Tyskland
CHERNEY, David, Boehringer Ingelheim (Canada) Ltd. 5180 South Service Road, Burlington, Ontario L7L 5H4, Canada
DAIBER, Andreas, Universitätsmedizin Johannes Gutenberg Universität Mainz Langenbeckstrasse 1, 55131 Mainz, Tyskland
VON EYNATTEN, Maximilian, Boehringer Ingelheim GmbH Corporate Patents Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim Am Rhein, Tyskland
JOHANSEN, Odd-Erik, Oddenveien 21, 1363 Høevik, Norge
KIM, Gabriel Woojai, Boehringer Ingelheim GmbH Corporate Patents Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim Am Rhein, Tyskland
MAYOUX, Eric Williams, Boehringer Ingelheim GmbH Corporate Patents Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim Am Rhein, Tyskland
MUENZEL, Thomas, Universitätsmedizin Johannes Gutenberg Universität Mainz Langenbeckstrasse 1, 55131 Mainz, Tyskland
PERKINS, Bruce A., Boehringer Ingelheim (Canada) Ltd. 5180 South Service Road, Burlington, Ontario L7L 5H4, Canada
SALSALI, Afshin, Boehringer Ingelheim USA Corp./o VP IP Legal 900 Ridgebury Road P.O. Box 368, Ridgefield, Connecticut 06877-0368, USA
SOLEYMANLOU, Nima, Boehringer Ingelheim (Canada) Ltd. 5180 South Service Road, Burlington, Ontario L7L 5H4, Canada
WOERLE, Hans-Juergen, Boehringer Ingelheim GmbH Corporate Patents Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim Am Rhein, Tyskland

(74) Agent or Attorney

BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54) Title **THERAPEUTIC USES OF EMPAGLIFLOZIN**

(56) References

Cited:

WO-A1-2011/039337, WO-A1-2012/107476, WO-A1-2012/062698,
 S. CERNEA ET AL: "-Cell Protection and Therapy for Latent Autoimmune Diabetes in Adults",
 DIABETES CARE, vol. 32, no. suppl_2, 29 October 2009 (2009-10-29), pages S246-S252,
 XP055128102, ISSN: 0149-5992, DOI: 10.2337/dc09-S317
 "Annex 1 - Summary of product Characteristics - Jardiance", European Medicines Agency ,
 2019, pages 1-47, Retrieved from the Internet: URL:https://www.ema.europa.eu/en/documents
 /product-information/jardiance-epar-produce t-information_en.pdf
 FITCHETT DAVID ET AL: "Heart failure outcomes with empagliflozin in patients with type 2
 diabetes at high cardiovascular risk: results of the EMPA-REG OUTCOME (R) trial",
 EUROPEAN HEART JOURNAL,, vol. 37, no. 19, 26 January 2016 (2016-01-26), pages 1526-
 1534, DOI: 10.1093/EURHEARTJ/EHV728
 DATABASE EMBASE [Online] ELSEVIER SCIENCE PUBLISHERS, AMSTERDAM, NL; June
 2012 (2012-06), JELSING, JACOB (CORRESPONDENCE) ET AL: "The sodium glucose
 cotransporter-2 (SGLT-2) inhibitor empagliflozin has a durable effect on the restoration of
 glucose homeostasis by preserving beta-cell mass in Zucker diabetic fatty rats.", XP002726980,
 retrieved from STN Database accession no. 0050781595 & JELSING, JACOB
 (CORRESPONDENCE) ET AL: "The sodium glucose cotransporter-2 (SGLT-2) inhibitor
 empagliflozin has a durable effect on the restoration of glucose homeostasis by preserving beta-
 cell mass in Zucker diabetic fatty rats.", DIABETES, (JUNE 2012) VOL. 61, SUPP. SUPPL. 1,
 PP. A261. ABSTRACT NUMBER: 1018-P. MEETING INFO: 72ND SCIENTIFIC SESSIONS OF
 THE AMERICAN DIABETES ASSOCIATION. PHILADELPHIA, PA, UNITED STATES. 08 JUN
 2012-12 JUN 2012 ISSN: 0012-1797, September 2012 (2012-09),
 DATABASE EMBASE [Online] ELSEVIER SCIENCE PUBLISHERS, AMSTERDAM, NL; October
 2012 (2012-10), JELSING, J. (CORRESPONDENCE) MAYOUX, E. ET AL: "Empagliflozin, a
 novel sodium glucose cotransporter-2 inhibitor, improves glucose homeostasis and preserves
 pancreatic beta cell mass in db/db mice.", XP002726979, retrieved from STN Database
 accession no. 0050872772 & JELSING, J. (CORRESPONDENCE) MAYOUX, E. ET AL:
 "Empagliflozin, a novel sodium glucose cotransporter-2 inhibitor, improves glucose homeostasis
 and preserves pancreatic beta cell mass in db/db mice.", DIABETOLOGIA, (OCTOBER 2012)
 VOL. 55, SUPP. SUPPL. 1, PP. S317. MEETING INFO: 48TH ANNUAL MEETING OF THE
 EUROPEAN ASSOCIATION FOR THE STUDY OF DIABETES, EASD 2012. BERLIN,
 GERMANY. 01 OCT 2012-05 OCT 2012 ISSN: 0012-186X, October 2012 (2012-10),

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.** Empagliflozin for bruk i en fremgangsmåte for å forebygge, redusere risikoen for eller forsinke forekomsten av en kardiovaskulær hendelse hos en pasient med type 2 eller type 1 diabetes mellitus eller med pre-diabetes som omfatter administrering av empagliflozin, valgfritt i kombinasjon med ett eller flere andre terapeutiske stoffer, til pasienten hvor den kardiovaskulære hendelsen er valgt fra kardiovaskulær død og hjertesvikt som krever sykehusinnleggelse.
- 2.** Empagliflozin for bruk i en fremgangsmåte for å behandle en metabolsk sykdom og forebygging, redusere risikoen for eller forsinke forekomsten av en kardiovaskulær hendelse hos en pasient, omfattende administrering av empagliflozin, valgfritt i kombinasjon med en eller flere andre terapeutiske substanser, til pasienten hvori nevnte metabolske lidelse er type 2 eller type 1 diabetes mellitus eller pre-diabetes, og hvor nevnte kardiovaskulære hendelse er valgt fra kardiovaskulær død og hjertesvikt som krever sykehusinnleggelse.
- 3.** Empagliflozin for bruk ifølge krav 1 eller 2, hvori empagliflozin administreres oralt i en total daglig mengde på 10 mg eller 25 mg.
- 4.** Empagliflozin for bruk ifølge krav 1, hvori fremgangsmåten er for å forhindre, redusere risikoen for eller forsinke forekomsten av en kardiovaskulær hendelse valgt fra kardiovaskulær død og hjertesvikt som krever sykehusinnleggelse hos en pasient med type 2 diabetes mellitus, omfattende administrering av empagliflozin oralt i en total daglig mengde på 10 mg eller 25 mg, valgfritt i kombinasjon med en eller flere andre terapeutiske substanser, til pasienten.
- 5.** Empagliflozin for bruk ifølge krav 4, hvori fremgangsmåten er for å forhindre, redusere risikoen for eller forsinke forekomsten av kardiovaskulær død hos en pasient med type 2 diabetes mellitus, omfattende administrering av empagliflozin oralt i en total daglig mengde på 10 mg eller 25 mg, valgfritt i kombinasjon med ett eller flere andre terapeutiske stoffer, til pasienten.
- 6.** Empagliflozin for bruk ifølge krav 4, hvori fremgangsmåten er for å forhindre, redusere risikoen for eller forsinke forekomsten av hjertesvikt som krever sykehusinnleggelse hos en pasient med type 2 diabetes mellitus, omfattende administrering av empagliflozin oralt i en total daglig mengde på 10 mg eller 25 mg, valgfritt i kombinasjon med en eller flere andre terapeutiske substanser, til pasienten.
- 7.** Empagliflozin for bruk ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, hvori nevnte pasient har eller er i fare for en kardiovaskulær sykdom.
- 8.** Empagliflozin for bruk ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, hvori nevnte pasient har eller er i fare for en kardiovaskulær sykdom valgt fra hjerteinfarkt, hjerneslag, perifer arteriell okklusiv sykdom.
- 9.** Empagliflozin for bruk ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, hvori pasienten er en pasient med type 2 eller type 1 diabetes mellitus eller med pre-diabetes med en eller flere kardiovaskulære risikofaktorer valgt fra A), B), C) og D):

- A) tidligere eller eksisterende vaskulær sykdom valgt fra hjerteinfarkt, koronararteriesykdom, perkutan koronar intervensjon, koronararterie-bypass-transplantasjon, iskemisk eller hemorragisk hjerneslag, kongestiv hjertesvikt og perifer okklusiv arteriell sykdom,
- B) høy alder ≥ 60 -70 år, og
- C) en eller flere kardiovaskulære risikofaktorer valgt fra

- avansert type 2 diabetes mellitus > 10 års varighet,
- hypertensjon,
- vanlig daglige sigarettøyking,
- dyslipidemi,
- overvekt,
- alder $\geq$ 40,
- metabolsk syndrom, hyperinsulinemi eller insulinresistens, og
- hyperurikemi, erektil dysfunksjon, polycystisk ovariesyndrom, søvnapné eller familiehistorie med vaskulær sykdom eller kardiomyopati hos førstegradsslektning;

D) ett eller flere av følgende:

- bekreftet historie med hjerteinfarkt,
- ustabil angina med dokumentert flerkars koronarsykdom eller positiv stresstest,
- multivaskulær perkutan koronar intervensjon,
- multivaskulær koronararterie-bypass-transplantering (CABG),
- historie med iskemisk eller hemorragisk hjerneslag,
- perifer okklusiv arteriell sykdom.

10. Empagliflozin for bruk ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, hvori de en eller flere andre terapeutiske substanser er valgt fra andre antidiabetiske substanser.

11. Empagliflozin for bruk ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, hvori fremgangsmåten omfatter administrering av empagliflozin i kombinasjon med metformin, med linagliptin eller med metformin og linagliptin.

12. Empagliflozin for bruk ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, hvori de en eller flere andre terapeutiske substanser er valgt fra aktive substanser som senker blodsukkernivået, aktive substanser som senker totalkolesterolet, LDL-kolesterol, ikke-HDL-kolesterol og/ eller Lp(a)-nivå i blodet, aktive stoffer som øker HDL-kolesterolnivået i blodet, aktive stoffer som senker blodtrykket, aktive stoffer som er indisert ved behandling av aterosklerose eller fedme, blodplatehemmende midler, antikoagulerende midler, og vaskulære endotelbeskyttende midler.