



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3043773 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/10 (2006.01)
A61K 31/335 (2006.01)
A61K 31/58 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.10.04
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.06.30
(86)	European Application Nr.	14781946.0
(86)	European Filing Date	2014.09.04
(87)	The European Application's Publication Date	2016.07.20
(30)	Priority	2013.09.13, IN, 2975MU2013
(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	Glenmark Specialty S.A., Avenue Léopold-Robert 37, 2300 La Chaux-de-Fonds, Sveits
(72)	Inventor	DHUPPAD, Ulhas, Bunglow No. B-3Coral Apt.Resi 1 -PhaseShahu NagarMotwani Factory RoadNashik Road, NashikMaharashtra 422101, India KATKURWAR, Ashok, B-10 Ishwar Paradise ApartmentAshoka margBehind Fem CinemaNashik road, NashikMaharashtra 422011, India GUPTA, Yashwant, Flat No. 2Antriksh ApartmentTagor NagarFront of Ambedkar NagarNashik Road, NashikMaharashtra 422006, India ANKAM, Rajesh, Flat No. 204E WingDream NestDGP NagarNashik Road, NashikMaharashtra 422101, India DHATRAK, Chandrakant, S. No. 11/1-4Plot No.9Sadguru Krupa BanglooNear Charandas MarketJail RoadNashik Road, NashikMaharashtra 422101, India
(74)	Agent or Attorney	Budde Schou A/S, Dronningens Tværgade 30, 1302 KØBENHAVN K, Danmark

(54)	Title	STABLE FIXED DOSE PHARMACEUTICAL COMPOSITION COMPRISING MOMETASONE AND OLOPATADINE FOR NASAL ADMINISTRATION
------	-------	--

(56) References

Cited:

US-A1- 2007 099 883

WO-A2-2011/141929

US-A1- 2004 097 474

US-B2- 7 977 376

WO-A1-2014/092346

WO-A1-2009/003199

WO-A2-01/26658

WO-A2-2012/094283

FOR THE MOMETASONE FUROATE NASAL SPRAY WITH LORATADINE STUDY GROUP ET

AL: "Clinical benefits of combination treatment with mometasone furoate nasal spray and loratadine vs monotherapy with mometasone furoate in the treatment of seasonal allergic rhinitis", ANNALS OF ALLERGY, ASTHMA & IMMUNOLOGY, ELSEVIER, AMSTERDAM, NL, vol. 100, no. 3 1 March 2008 (2008-03-01), pages 264-271, XP026960010, ISSN: 1081-1206 [retrieved on 2008-03-01]

ANDREWS CHARLES P ET AL: "Efficacy and safety of twice-daily and once-daily olopatadine-mometasone combination nasal spray for seasonal allergic rhinitis", ANNALS OF ALLERGY, ASTHMA & IMMUNOLOGY, ELSEVIER, AMSTERDAM, NL, vol. 124, no. 2 15 November 2019 (2019-11-15), page 171, XP085992043, ISSN: 1081-1206, DOI: 10.1016/J.ANAI.2019.11.007 [retrieved on 2019-11-15]

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. Stabil vandig farmasøytisk sammensetning i fast dose for nasal
5 administrering til et menneske, sammensetningen er en suspensjon som
omfatter a) 0,001 % v/v til 0,075 % v/v mometason eller dets salt i
partikkelform; b) 0,5 % v/v til 0,8 % v/v olopatadin eller dets salt i oppløst
form; og c) hydrokolloid i en mengde på minst 0,1 % v/v og tilstrekkelig
til å forhindre faseatskillelse i minst 24 timer ved omgivelsesbetingelse.
10
2. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1, hvori mometasonet
eller dets salt og olopatadinet eller dets salt er til stede i et vektforhold
på 1:3 til 1:106.
- 15 3. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1 eller 2, hvori
mometasonsaltet er mometasonfuroat og olopatadinsaltet er
olopatadinhydroklorid.
4. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av
20 kravene 1–3, hvori mometasonet eller dets salt har en gjennomsnittlig
partikkelstørrelse i området på 1 µm til 20 µm.
5. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av
kravene 1–4, hvori sammensetningen har en pH på 3,3–4,1, og en
25 osmolalitet i området på 200 mOsm/kg til 400 mOsm/kg.
6. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1, sammensetningen
omfattende 0,025 % v/v til 0,05 % v/v mometason eller dets salt, og
0,6 % v/v til 0,7 % v/v olopatadin eller dets salt, hvori hydrokolloiden
30 velges fra listen omfattende karboksymetylcellulosenatrium og
xantangummi.

7. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 6, hvori sammensetningen omfatter enten 0,025 % v/v mometasonfuroat eller 0,05 % v/v mometasonfuroat og 0,665 % v/v olopatadinhydroklorid; og hydrokolloidet inkluderer xantangummi, karboksymetylcellulosenatrium eller begge.
8. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 6 eller krav 7, hvori sammensetningen videre omfatter et farmasøytisk akseptabelt hjelpemiddel valgt fra gruppen omfattende chelateringsmidler, konserveringsmidler, buffere, overflateisotoniske midler, smakstilsettende midler, antioksidanter, fuktmidler, pH-justerende midler og blandinger derav.
9. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 8, hvori:
- A) chelateringsmidlet velges fra gruppen bestående av edetatdinatrium (EDTA), edetattrinatrium, edetattetranatrium, dietylenaminpentaacetat, og en hvilken som helst kombinasjon av ethvert av de foregående, og chelateringsmidlet er til stede i området på 0,002 % v/v til 0,5 % v/v;
- B) konserveringsmidlet velges fra gruppen bestående av benzylalkohol, kvarternære ammoniakkhalider fenylkarbinol, timerosal, og enhver kombinasjon av ethvert av de foregående, og konserveringsmidlet er til stede i området på 0,005 til 0,2 % v/v;
- C) bufferen velges fra gruppen bestående av sitronsyre, eddiksyre, fumarsyre, hydroklorinsyre, eplesyre, salpetersyre, fosforsyre, propionsyre, svovelsyre, vinsyre, fosfatsalter og enhver kombinasjon av enhver av de foregående; og
- D) overflatemidlet velges fra gruppen bestående av polyetoksylerede sorbitanderivater, polyoksyetylen-vegetabilsk olje, polyoksyetylen-sorbitanmonolaurat, natriumoleat og enhver kombinasjon av ethvert av de foregående.

10. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 6, hvori enten:
sammensetningen omfatter

- 5 (1) 0,025 % v/v mometasonfuroatmonohydrat,
(2) 0,665 % v/v olopatadinhydroklorid,
(3) hydrokolloid valgt fra listen omfattende 0,3 % v/v av
xantangummi og 0,5 % v/v karboksymetylcellulosenatrium,
(4) 0,02 % v/v benzalkoniumklorid,
(5) 0,4 % v/v natriumklorid,
10 (6) 0,01 % v/v di-natriumedetat,
(7) 0,94 % v/v natriumfosfatheptahydrat, og
(8) 0,01 % v/v polysorbat 80; eller

sammensetningen omfatter

- 15 (1) 0,050 % v/v mometasonfuroatmonohydrat,
(2) 0,665 % v/v olopatadinhydroklorid,
(3) hydrokolloid som er 0,3 % v/v av xantangummi eller 0,5 % v/v
karboksymetylcellulosenatrium,
(4) 0,02 % v/v benzalkoniumklorid,
(5) 0,4 % v/v natriumklorid,
20 (6) 0,01 % v/v di-natriumedetat,
(7) 0,94 % v/v natriumfosfatheptahydrat, og
(8) 0,01 % v/v polysorbat 80.

11. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av
25 kravene 1–10, hvori sammensetningen er en vandig sammensetning
omfattende:

- 30 (1) 0,025 % v/v mometasonfuroatmonohydrat,
(2) 0,665 % v/v olopatadinhydroklorid,
(3) 1,2 % v/v av en blanding av mikrokrySTALLISK cellulose og
karboksymetylcellulosenatrium.
(4) 0,5 % v/v karboksymetylcellulosenatrium,
(5) 0,02 % v/v benzalkoniumklorid,
(6) 0,41 % v/v natriumklorid,

- (7) 0,01 % v/v di-natriumedetat,
- (8) 0,94 % v/v natriumfosfatheptahydrat, og
- (9) 0,01 % v/v polysorbat 80.

- 5 **12.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av
kravene 6–11, hvori sammensetningen har en pH på 3,5–3,9, en
osmolalitet i området 250 mOsm/kg til 350 mOsm/kg.
- 10 **13.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av
kravene 6–12, hvori sammensetningen har en gjennomsnittlig
partikkelstørrelse i området på fra 1 µm til 20 µm.
- 15 **14.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av
kravene 1–13, hvori sammensetningen har en viskositet i området på
20 cps til 150 cps.
- 20 **15.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av
kravene 1–14, hvori sammensetningen inneholdes i en beholder, og når
levert som en nasal spray har et spraymønster som har en lengste akse
på 15–75 mm, en korteste akse på 10–65 mm og en elliptisitet på 1–2.
- 25 **16.** Stabil suspensjon egnet for nasal administrering til et menneske,
omfattende
- 30 (a) vandig løsemiddel,
 (b) partikler av mometasonfuroat suspendert i løsemidlet,
 partiklene har en gjennomsnittlig partikkelstørrelse på fra 1 til
 20 µm,
 (c) olopatadinhydroklorid oppløst i løsemidlet, og
 (d) hydrokolloid til stede i en mengde på minst 0,1 % v/v og
 tilstrekkelig til å forhindre faseatskillelse i minst 24 timer ved
 omgivelsesbetingelser, suspensjonen har en viskositet i området
 på 20 cps til 150 cps;

alternativt videre omfattende et chelateringsmiddel, et konserveringsmiddel, en buffer, et overflatemiddel, et isotonsitetsmiddel og alternativt et pH-justerende middel.

- 5 **17.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1–3 og 5–15 eller suspensjonen ifølge krav 16, for anvendelse i behandlingen av rinitt hos et menneske.