



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3116498 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 47/10 (2017.01)
A61K 9/08 (2006.01)
A61K 31/40 (2006.01)
A61K 31/56 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2019.05.13
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.12.12
(86)	European Application Nr.	15762178.0
(86)	European Filing Date	2015.03.12
(87)	The European Application's Publication Date	2017.01.18
(30)	Priority	2014.03.13, US, 201461952505 P 2014.05.22, US, 201414285488
(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	Bodor Laboratories, Inc., 4400 Biscayne Boulevard Suite 980, Miami, FL 33137, USA
(72)	Inventor	BODOR, Nicholas S., 10225 Collins Avenue Units 1002/1004, Bal Harbour, Florida 33154, USA KOLENG, John J., 11113 Alison Park Trail, Austin, Texas 78750, USA ANGULO, David, 2600 SW 3rd Avenue Suite 350, Miami, Florida 33129, USA
(74)	Agent or Attorney	Nordic Patent Service A/S, Bredgade 30, 1260 KØBENHAVN K, Danmark

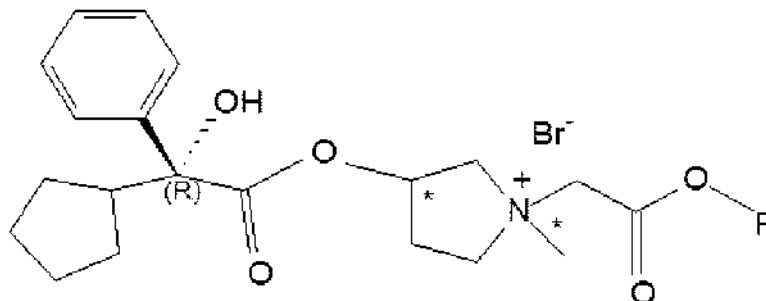
(54)	Title	FORMULATION FOR SOFT ANTICHOLINERGIC ANALOGS
(56)	References Cited:	US-A1- 2009 227 590, US-A1- 2009 291 960, US-A- 5 292 530, US-A1- 2009 263 341, US-A1- 2006 210 504, WO-A1-2014/144075, US-A1- 2012 237 573

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. Topisk vannfri gelsammensetning, sammensetningen omfatter følgende bestanddeler:

(a) en forbindelse med formel:



5

(2)

hvor R er metyl eller etyl, forbindelsen har den R-stereoisomere konfigurasjonen i 2-posisjonen og den R-, S- eller RS-stereoisomere konfigurasjonen i 1'- og 3'-posisjonene, eller er en blanding derav;

(b) etanol som et ikke-vandig løsningsmiddel for forbindelsen med formel (2), til stede i en mengde på 70-99,9 vekt-% av sammensetningen;

(c) minst en gelerings- eller viskositetsbestemmende bestanddel; og

(d) eventuelt minst en ytterligere bærer eller eksipiens;

hvor den topiske vannfrie gelsammensetningen omfatter fra 0,1 til 30 vekt-% av forbindelsen med formel (2).

2. Sammensetningen ifølge krav 1, hvor minst en ytterligere bærer eller eksipiens er til stede.

3. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-2, hvor forbindelsen med formel (2) er valgt fra gruppen som består av:

(a) (2R,3'R)-3-(2-syklopentyl-2-fenyl-2-hydroksyacetoksy)-1-(etoksykarbonylmetyl)-1-metylpyrrolidiniumbromid;

(b) (2R,3'S)-3-(2-syklopentyl-2-fenyl-2-hydroksyacetoksy)-1-(etoksykarbonylmetyl)-1-metylpyrrolidiniumbromid;

(c) (2R,1'R,3'S)-3-(2-syklopentyl-2-fenyl-2-hydroksyacetoksy)-1-(etoksykarbonylmetyl)-1-metylpyrrolidiniumbromid;

(d) (2R,1'S,3'S)-3-(2-syklopentyl-2-fenyl-2-hydroksyacetoksy)-1-(etoksykarbonylmetyl)-1-metylpyrrolidiniumbromid;

(e) (2R,1'R,3'R)-3-(2-syklopentyl-2-fenyl-2-hydroksyacetoksy)-1-(etoksykarbonylmetyl)-

1-metylpyrrolidiniumbromid;

(f) (2R,1'S,3'R)-3-(2-syklopentyl-2-fenyl-2-hydroksyacetoksy)-1-(etoksykarbonylmetyl)-1-metylpyrrolidiniumbromid;

(g) (2R,3'R)-3-(2-syklopentyl-2-fenyl-2-hydroksyacetoksy)-1-metyl-1-

5 metoksykarbonylmetylpyrrolidiniumbromid;

(h) (2R,3'S)-3-(2-syklopentyl-2-fenyl-2-hydroksyacetoksy)-1-metyl-1-metoksykarbonylmetylpyrrolidiniumbromid;

(i) (2R,1'R,3'R)-3-(2-syklopentyl-2-fenyl-2-hydroksyacetoksy)-1-metyl-1-metoksykarbonylmetylpyrrolidiniumbromid;

10 (j) (2R,1'R,3'S)-3-(2-syklopentyl-2-fenyl-2-hydroksyacetoksy)-1-metyl-1-metoksykarbonylmetylpyrrolidiniumbromid;

(k) (2R,1'S,3'R)-3-(2-syklopentyl-2-fenyl-2-hydroksyacetoksy)-1-metyl-1-metoksykarbonylmetylpyrrolidiniumbromid; og

(l) (2R,1'S,3'S)-3-(2-syklopentyl-2-fenyl-2-hydroksyacetoksy)-1-metyl-1-

15 metoksykarbonylmetylpyrrolidiniumbromid.

4. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-3, hvori forbindelsen med formel (2) er i en konsentrasjon på fra 1 til 20 vekt-% eller vekt/volum-% av sammensetningen.

5. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-3, hvori forbindelsen med formel (2) er i en konsentrasjon på fra 2 til 10 vekt-% eller vekt/volum-% av sammensetningen.

20 6. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, pakket inn i en flerdosebeholder som måler en dose på fra 0,5 ml til 1,0 ml av sammensetningen som omfatter 3 til 6 vekt-% eller vekt/volum-% av forbindelsen per behandlet område.

7. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-5, pakket inn i en enkelt- eller enhetsdosebeholder som leverer en enkelt- eller enhetsdose på fra 0,5 ml til 1,0 ml av sammensetningen som omfatter 3 til 6 vekt-% eller vekt/volum-% av forbindelsen per behandlet område.

8. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori forbindelsen med formel (2) er (2R,3'R)-3-(2-syklopentyl-2-fenyl-2-hydroksyacetoksy)-1-(etoksykarbonylmetyl)-1-metylpyrrolidiniumbromid.

30 9. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-8, hvori den gelerings- eller viskositetsbestemmende bestanddelen er hydroksypropylcellulose.

10. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-3, som videre omfatter sitronsyre.

11. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-3, som omfatter en eller flere

topiske eksipienser valgt fra gruppen som består av alkoholer, aloeveragel, heksylenglykol, propylenglykol, dimetikon, prostaglandin E, allantoin, glyserin, oljer med vitamin A og E, mineralolje, PPG2, myristylpropionatlaktose, dekstrose, sukrose, sorbitol, mannitol, stivelser, gummi arabicum, kalsiumfosfat, alginater, tragakant, gelatin, kalsiumsilikat, mikrokrySTALLinsk cellulose, polyvinylpyrrolidon, cellulose og metylcellulose.

12. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-3, hvori sammensetningen består av:

10 vekt-% (2R,3'R)-3-(2-syklopentyl-2-fenyl-2-hydroksyacetoksy)-1-(etoksykarbonylmetyl)-1-metylpyrrolidiniumbromid;

1,25 vekt-% hydroksypropylcellulose;

10 vekt-% heksylenglykol;

2,5 vekt-% Dimetikonolblanding 20;

0,1 vekt-% sitronsyre; og

76,15 vekt-% etanol som den vannfrie vehikkelen.

13. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1-11, for anvendelse ved behandling av hyperhidrose, hvori sammensetningen skal administreres topisk til et berørt hudområde til et individ.

14. Sammensetningen for anvendelse ifølge krav 13, hvori sammensetningen skal administreres i et regime på en til fire ganger daglig.

15. Sammensetningen for anvendelse ifølge krav 14, hvori sammensetningen skal administreres innen 1-2 timer før individet skal sove.