



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3325487 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/06 (2006.01)
A61K 8/34 (2006.01)
A61K 8/37 (2006.01)
A61K 8/49 (2006.01)
A61K 8/58 (2006.01)
A61K 8/73 (2006.01)
A61K 8/891 (2006.01)
A61K 9/08 (2006.01)
A61K 31/40 (2006.01)
A61K 47/10 (2017.01)
A61K 47/12 (2006.01)
A61K 47/14 (2017.01)
A61K 47/24 (2006.01)
A61K 47/38 (2006.01)
C07D 207/12 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.08.09
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.05.05
(86)	European Application Nr.	16828553.4
(86)	European Filing Date	2016.07.21
(87)	The European Application's Publication Date	2018.05.30
(30)	Priority	2015.07.21, US, 201514805114
(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 AvenueUnits 1002-1004, Bal Harbour, FL 33154, USA KOLENG, John, J., 11113 Alison Park Trail, Austin, TX 78750, USA ANGULO, David, 8706 Sorano Villa Drive, Tampa, FL 33647, 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- 2014 151 255
 US-A1- 2003 064 040

US-B1- 6 433 003

WO-A1-2014/144075

Raj Sakamuri: "ESTERS, ORGANIC" In: "Kirk-Othmer Encyclopedia of Chemical Technology", 19 December 2003 (2003-12-19), John Wiley & Sons, Inc., XP055554355, pages 497-526, * section 5.2; page 503 * * section 7; page 509, line 2 *

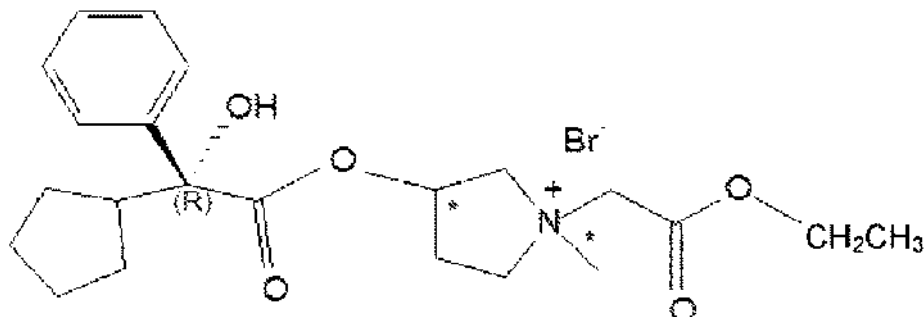
KIRK ET AL.: 'ESTERS, ORGANIC' KIRK-OTHMER ENCYCLOPEDIA OF CHEMICAL TECHNOLOGY, [Online] vol. 9, February 1994, pages 1 - 1, XP055512045 Retrieved from the Internet: <URL:HTTP://VIGOSCHOOLS.ORG/~MMC3/AP%20LAB/AP%20LAB%20DOCUMENTS/ESTERFICATION.PDF>

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 sammensetning, omfattende de følgende ingrediensene:

(a) en forbindelse som har formelen:



(2)

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) vannfri etanol, til stede i en mengde på minst ca. 70 % vekt/vekt eller vekt/volum av sammensetningen;

(c) eventuelt minst én gelerings- eller viskositetsregulerende ingrediens; og

(d) eventuelt minst én ekstra bærer eller hjelpestoff; forutsatt at den topiske sammensetningen er vannfri og omfatter fra ca. 1 til ca. 25 % vekt/vekt eller vekt/volum av forbindelsen av formel (2), idet den vannfrie sammensetningen har større lagringsstabilitet sammenlignet med en sammensetning omfattende et vandig løsningsmiddel eller vandig buffer, hvor ingrediensene er til stede i mengder slik at produktet av en hvilken som helst transforestring er det samme som forbindelsen av formel (2).

2. Sammensetningen ifølge krav 1, omfattende fra ca. 70 til ca. 85 % vekt/vekt eller vekt/volum vannfri etanol.

3. Sammensetningen ifølge krav 1 eller 2, hvori minst én gelerings- eller viskositetsregulerende ingrediens er til stede, fortrinnsvis hvori den gelerings- eller viskositetsregulerende ingrediensen er hydroksypropylcellulose.

4. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1–3, hvori minst én ytterligere bærer eller eksipiens er til stede.

5. Sammensetningen ifølge krav 4, hvori én av den ekstra bæreren eller eksipiensen er isopropylmyristat eller C₁₂-C₁₅-alkyllaktat.

6. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1–5, hvori forbindelsen av formel (2) er valgt fra gruppen som består av:

(ii) (2R)-3-(2-syklopentyl-2-fenyl-2-hydroksyacetoksy)-1-(etoksykarbonylmetyl)-1-metylpyrrolidiniumbromid;

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

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

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

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

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

(viii) (2R,1'S,3'R)-3-(2-syklopentyl-2-fenyl-2-hydroksyacetoksy)-1-(etoksykarbonylmetyl)-1-metylpyrrolidiniumbromid.

7. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1–6, hvori forbindelsen av formel (2) har en konsentrasjon på fra ca. 1 % vekt/volum eller vekt/vekt til ca. 20 % vekt/volum eller vekt/vekt av sammensetningen, fortrinnsvis hvori forbindelsen av formel (2) har en konsentrasjon på fra ca. 2 % vekt/volum eller vekt/vekt til ca. 10 % vekt/volum eller vekt/vekt.

8. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, pakket i en flerdosebeholder som måler en dose på fra ca. 0,5 ml til ca. 1,0 ml av sammensetningen for hver påføring eller pakket i en enkelt- eller enhetsdosebeholder som leverer en enkelt- eller enhetsdose på ca. 0,5 ml til ca. 1,0 ml av sammensetningen for hver påføring.

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

10. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 3–9, videre omfattende sitronsyre.

5 11. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 3–10, videre omfattende heksylenglykol.

12. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 3–11, videre omfattende en 6 % silikongummiblanding i dimetikon.

10

13. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 3–12, videre omfattende minst ett element valgt fra gruppen som består av: dimetikon, fortrinnsvis dimetikon 350 cSt; syklometikon, fortrinnsvis syklometikon 5-NF; myristylpropionat; isopropylmyristat; og C₁₂-C₁₅-alkyllaktat.

15

14. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 3–13, videre omfattende isopropylmyristat.

15. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1–14, for anvendelse i
20 behandlingen av hyperhidrose, hvori sammensetningen skal

administreres topisk i ett én til fire ganger daglig regime til et berørt hudområde til et individ, fortrinnsvis hvori sammensetningen skal administreres topisk til et berørt hudområde til individet, innen 1–2 timer før individets søvnperiode.