



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3335707 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/138 (2006.01)
A61K 31/439 (2006.01)
A61K 45/06 (2006.01)
A61P 11/06 (2006.01)
A61P 11/08 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2024.07.08
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2024.04.17
(86)	European Application Nr.	17206132.7
(86)	European Filing Date	2010.11.29
(87)	The European Application's Publication Date	2018.06.20
(30)	Priority	2009.12.01, GB, 0921075
(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
	Designated Extension States:	BA ; ME
(62)	Divided application	EP2506844, 2010.11.29
(73)	Proprietor	Glaxo Group Limited, GSK Medicines Research Centre Gunnels Wood Road, Stevenage SG1 2NY, Storbritannia
(72)	Inventor	BAKER, Darrell, GlaxoSmithKline Ironbridge Road, Uxbridge, Middlesex UB11 1BS, Storbritannia BRUCE, Mark, GlaxoSmithKline Gunnels Wood Road, Stevenage, Hertfordshire SG1 2NY, Storbritannia CRATER, Glenn, GlaxoSmithKline P.O. Box 13398 Five Moore Drive, Research Triangle Park, NC North Carolina 27709-3398, USA NOGA, Brian, c/o GlaxoSmithKline P.O. Box 13398 Five Moore Drive, Research Triangle Park, NC North Carolina 27709-3398, USA THOMAS, Marian, GlaxoSmithKline Park Road, Ware, Hertfordshire SG12 0DJ, Storbritannia WIRE, Patrick, GlaxoSmithKline P.O. Box 13398 Five Moore Drive, Research Triangle Park, NC 27709-3398, USA
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge
(54)	Title	COMBINATIONS OF A MUSCARINIC RECEPTOR ANTAGONIST AND A BETA-2 ADRENORECEPTOR AGONIST
(56)	References Cited:	WO-A1-2005/037280 WO-A1-2010/097115

WO-A2-2005/104745

WO-A1-2010/097114

WO-A1-2005/115463

WO-A1-03/024439

JONES P: "Aclidinium Bromide Twice Daily for the Treatment of Chronic Obstructive Pulmonary Disease: A Review", ADVANCES IN THERAPY, vol. 30, no. 4, April 2013 (2013-04), pages 354-368, XP009504915, DOI: 10.1007/S12325-013-0019-2

Anonymous: "FDA approval labelling for TUDORZA PRESSAIR", U.S. Food and Drug Administration, 2012, XP002780228, Retrieved from the Internet:

URL: https://www.accessdata.fda.gov/drugsatfda_docs/label/2012/202450s000lbl.pdf

SCHELFHOUT V J ET AL: "Activity of aclidinium bromide, a new long-acting muscarinic antagonist: a phase I study", BRITISH JOURNAL OF CLINICAL PHARMACOLOGY, vol. 69, no. 5, May 2010 (2010-05), pages 458-464, XP009504914, DOI: 10.1111/J.1365-2125.2010.03622.X

LAINE, DRAMANE I. ET AL: "Discovery of Novel 1-Azoniabicyclo[2.2.2]octane Muscarinic Acetylcholine Receptor Antagonists", JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, 52(8), 2493-2505 CODEN: JMCMAR; ISSN: 0022-2623, 2009, XP002621866,

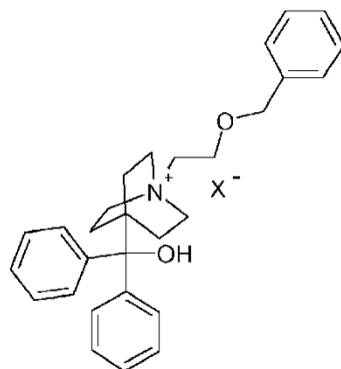
Anonymous: "EU Approval of EKLIRA GENUAIR - Annex I, Summary of product characteristics", European Medicines Agency, 20 July 2012 (2012-07-20), XP002780227, Retrieved from the Internet: URL: https://ec.europa.eu/health/documents/community-register/2012/20120720123594/anx_123594_en.pdf

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/>

5 Patentkrav

1. Farmasøytisk kombinasjonsprodukt for bruk ved behandling av kronisk obstruktiv lungesykdom (KOLS) og/eller astma, hvor produktet foreligger i en form egnet for administrering gjennom inhalasjon og omfatter

a) en forbindelse med formelen:

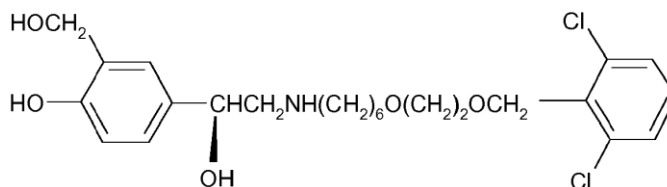


Forbindelse (1)

hvor

X⁻ er et farmasøytisk akseptabelt anion; og

b) en forbindelse med formelen:



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav (forbindelse (II)), hvor forbindelse (I) og forbindelse (II) presenteres i separate tørrpulversammensetninger eller en blandet tørrpulversammensetning som inneholder laktose som en bærer og magnesiumstearat som et ternært middel; og videre hvor produktet blir administrert én gang om dagen.

2. Produkt for bruk ifølge krav 1 hvor, for forbindelse (I), det farmasøytisk akseptable anionet er valgt fra gruppen bestående av klorid, bromid, jodid, hydroksid, sulfat, nitrat, fosfat, acetat, trifluoracetat, fumarat, citrat, tartrat, oksalat, suksinat, mandelat, metansulfonat eller p-toluensulfonat.

- 5 3. Produkt for bruk ifølge krav 1 eller krav 2 hvor forbindelse (I) er 4-[hydroksy(difenyl)metyl]-1-{2-
[(fenylmetyl)oksy]etyl}-1-azoniabisyklo[2,2.2]oktanbromid.
4. Produkt for bruk ifølge ethvert av kravene 1 til 3, hvor forbindelse (II) er 4-{{(1*R*)-2-[(6-{2-[(2,6-
diklorbenzyl)oksy]etoksy}heksyl)amino]-1-hydroksyetyl}-2-(hydroksymetyl)fenoltrifenylacetat.
- 10 5. Produkt for bruk ifølge ethvert av kravene 1 til 4, hvor 4-[hydroksy(difenyl)metyl]-1-{2-
[(fenylmetyl)oksy]etyl}-1-azoniabisyklo[2,2.2]oktanbromid og 4-{{(1*R*)-2-[(6-{2-[(2,6-
diklorbenzyl)oksy]etoksy}heksyl)amino]-1-hydroksyetyl}-2-(hydroksymetyl)fenoltrifenylacetat er de
eneste virkestoffene.
- 15 6. Produkt for bruk ifølge ethvert av kravene 1 til 5, hvor forbindelse (I) og forbindelse (II)
presenteres i en form tilpasset for separat, sekvensiell eller samtidig administrering.
7. Produkt for bruk ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6 hvor de separate eller blandede
20 sammensetningene foreligger i enhetsdoseform, og videre hvor enhetsdoseformen er i en kapsel,
patron eller blisterpakning.
8. Produkt for bruk ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7 hvor forbindelse (I) foreligger i en
mengde på 125 mcg/dose (av det frie kationet) eller 62,5 mcg/dose (av det frie kationet).
- 25 9. Produkt for bruk ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8 hvor forbindelse (II) foreligger i en
mengde på 25 mcg/dose (av den frie basen).
10. Produkt for bruk ifølge ethvert av kravene 1 til 9, videre omfattende 6 α ,9 α -difluor-17 α -[(2-
30 furanylkarbonyl)oksy]-11 β -hydroksy-16 α -metyl-3-okso-androsta-1,4-dien-17 β -karbotiosyre-*S*-
fluormetylester (flutikasonfuroat).
11. Produkt for bruk ifølge krav 10, omfattende 4-[hydroksy(difenyl)metyl]-1-{2-
[(fenylmetyl)oksy]etyl}-1-azoniabisyklo[2,2.2]oktanbromid, 4-{{(1*R*)-2-[(6-{2-[(2,6-
35 diklorbenzyl)oksy]etoksy}heksyl)amino]-1-hydroksyetyl}-2-(hydroksymetyl)fenoltrifenylacetat og
6 α ,9 α -difluor-17 α -[(2-furanylkarbonyl)oksy]-11 β -hydroksy-16 α -metyl-3-okso-androsta-1,4-dien-17 β -
karbotiosyre-*S*-fluormetylester (flutikasonfuroat).

- 5 12. Produkt for bruk ifølge krav 10 eller krav 11, hvor $6\alpha,9\alpha$ -difluor- 17α -[(2-furanylkarbonyl)oksy]- 11β -hydroksy- 16α -metyl-3-okso-androsta-1,4-dien- 17β -karbotiosyre-S-fluormetylester (flutikasonfuroat) foreligger i en mengde på 100mcg/dose.