



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3487475 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

A61K 9/00 (2006.01)

A61K 9/06 (2006.01)

A61K 31/40 (2006.01)

A61K 47/10 (2017.01)

A61K 47/12 (2006.01)

A61K 47/14 (2017.01)

A61K 47/34 (2017.01)

A61K 47/38 (2006.01)

A61P 43/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2023.10.16
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.06.07
(86)	European Application Nr.	17831882.0
(86)	European Filing Date	2017.07.20
(87)	The European Application's Publication Date	2019.05.29
(30)	Priority	2016.07.21, US, 201662365037 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	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 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	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

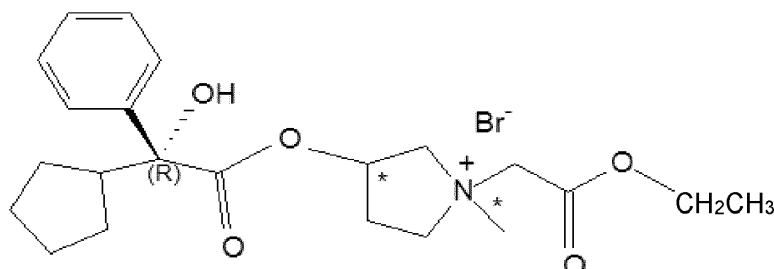
(54)	Title	FORMULATION FOR SOFT ANTICHOLINERGIC ANALOGS
(56)	References Cited:	WO-A1-2017/015485 US-A1- 2007 123 557 US-A1- 2014 275 204 US-A1- 2015 374 621 Raj Sakamuri: "ESTERS, ORGANIC" In: "Kirk-Othmer Encyclopedia of Chemical Technology", 19 December 2003 (2003-12-19), John Wiley & Sons, Inc., XP055554355, pages 497-526, DOI: 10.1002/0471238961.05192005200121.a01.pub2 , * pages 503,509 * LACHENMEIER DIRK W: "Safety evaluation of topical applications of ethanol on the skin and inside the oral cavity", JOURNAL OF OCCUPATIONAL MEDICINE AND TOXICOLOGY, BIOMED CENTRAL LTD, LO, vol. 3, no. 1, 13 November 2008 (2008-11-13), page 26, XP021045193, ISSN: 1745-6673, DOI: 10.1186/1745-6673-3-26

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 sammensetning for behandling, inhibering eller forbedring av overdreven svette, sammensetningen omfattende de følgende ingrediensene:

5 (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'-posisjonen, eller er en blanding derav;

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

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

(d) isopropylmyristat; og

(e) eventuelt minst én ytterligere bærer eller eksipiens

15 forutsatt at den topiske sammensetningen er vannfri og omfatter fra ca. 1 % til ca. 25 % vekt/vekt av forbindelsen av formel (2), hvori resiteringen av uttrykket «ca.» i forhold til en angitt tallverdi modifierer verdien av den angitte mengden med en varians på ±20 % av den angitte tallverdien.

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

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

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

5. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1–4, hvori forbindelsen av formel (2) velges fra gruppen som består av:

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

5 (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;

10 (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

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

6. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1–5, hvori forbindelsen av formel (2) har en konsentrasjon på fra ca. 1 % vekt/volum eller vekt/vekt til ca. 20 %

20 vekt/volum eller vekt/vekt av sammensetningen, fortrinnsvis fra ca. 2 % vekt/volum eller vekt/vekt til ca. 10 % vekt/volum eller vekt/vekt av sammensetningen.

7. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori sammensetningen er pakket

25 (i) i en flerdosebeholder som måler en dose på fra ca. 0,5 ml til ca. 1,0 ml av sammensetningen for hver påføring; eller

(ii) 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.

30 8. 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.

9. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 3–8, hvori den gelerings- eller viskositetskontrollerende bestanddelen er hydroksypropylcellulose.
- 5 10. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 3–9, videre omfattende sitronsyre.
11. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 3–10, videre omfattende heksylenglykol.
- 10 12. Sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, videre omfattende minst ett medlem valgt fra gruppen som består av dimetikon og syklometikon.
13. Sammensetning som definert i et hvilket som helst av kravene 1–12 for anvendelse ved behandling av hyperhidrose, hvori sammensetningen skal administreres topisk til huden i et
15 område av et individ som lider av hyperhidrose, hvorved, sammenlignet med ubehandlede, grunnlinjetilstander, svetteproduksjon reduseres med minst 25 % i minst seks (6) timer etter administrering av sammensetningen.
14. Sammensetning for anvendelse ifølge krav 13, hvori sammensetningen skal
20 administreres topisk før sengetid.
15. Sammensetning for anvendelse ifølge krav 13, hvori sammensetningen skal administreres topisk i en én til fire ganger daglig diett.
- 25 16. Sammensetning for anvendelse ifølge krav 13, hvori sammensetningen skal administreres topisk innen 1–2 timer før individets søvnperiode.
17. Sammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 13–16, hvori svetteproduksjonen er gravimetrisk målt som detaljert i beskrivelsen.