



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3524230 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

A61K 9/00 (2006.01)

A61K 9/48 (2006.01)

A61K 9/16 (2006.01)

A61K 31/4545 (2006.01)

A61K 9/20 (2006.01)

A61P 1/04 (2006.01)

A61K 9/28 (2006.01)

A61P 17/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2022.01.31
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.08.11
(86)	European Application Nr.	18213458.5
(86)	European Filing Date	2013.04.02
(87)	The European Application's Publication Date	2019.08.14
(30)	Priority	2012.04.04, EP, 12163078
(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
(62)	Divided application	EP2833864, 2013.04.02
(73)	Proprietor	Alkahest, Inc., 125 Shoreway Road, Suite D, San Carlos, CA 94070, USA
(72)	Inventor	FETSCHER, Alfred, Boehringer Ingelheim GmbH, Corporate Patents Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim Am Rhein, Tyskland SCHER, Jochen Matthias, Boehringer Ingelheim GmbH, Corporate Patents Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim Am Rhein, Tyskland
(74)	Agent or Attorney	Novagraaf Brevets, Bâtiment O2, 2 rue Sarah Bernhardt CS90017, 92665 ASNIÈRES-SUR-SEINE CEDEX, Frankrike

(54) Title **PHARMACEUTICAL FORMULATIONS COMPRISING CCR3 ANTAGONISTS**

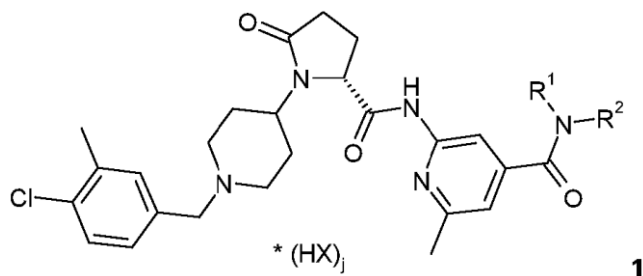
(56) References
Cited:

WO-A1-2012/045803, WO-A1-2010/115836
AMERIO PAOLO ET AL: "Eotaxins and CCR3 receptor in inflammatory and allergic skin diseases: therapeutical implications", CURRENT DRUG TARGETS. INFLAMMATION AND ALL, BENTHAM SCIENCE PUBLISHERS, HILVERSUM, NL, vol. 2, no. 1, 1 March 2003 (2003-03-01), pages 81-94, XP009139038, ISSN: 1568-010X
LIANNE I. WILLEMS ET AL: "Small molecule antagonists for chemokine CCR3 receptors", MEDICINAL RESEARCH REVIEWS, 1 January 2009 (2009-01-01), pages n/a-n/a, XP055598161, US ISSN: 0198-6325, DOI: 10.1002/med.20181
GERBER B O ET AL: "Functional expression of the eotaxin receptor CCR3 in T lymphocytes co-localizing with eosinophils", CURRENT BIO, CURRENT SCIENCE, GB, vol. 7, no. 11, 1 November 1997 (1997-11-01), pages 836-843, XP004671726, ISSN: 0960-9822, DOI: 10.1016/S0960-9822(06)00371-X

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. Farmasøytisk sammensetning omfattende som en aktiv ingrediens, en forbindelse av formel 1



hvor

R₁ er H, C₁₋₆-alkyl, C₀₋₄-alkyl-C₃₋₆-sykloalkyl, C₁₋₆-haloalkyl;

R₂ er H, C₁₋₆-alkyl;

X er et anion valgt fra gruppen bestående av klorid eller ½

dibenzoyltartrat

j er 1 eller 2,

og første fortynner, andre fortynner, bindemiddel, disintegrant og smøremiddel
og eventuelt bindemiddel,

hvor den farmasøytiske sammensetningen omfatter

10–90 % aktiv ingrediens

5–70 % første fortynner,

5–30 % andre fortynner,

0–30 % bindemiddel,

1–12 % disintegrant, og

0,1–3 % smøremiddel

hvor den første og andre fortynneren velges fra gruppen bestående av

cellulosepulver, vannfritt dibasisk kalsiumfosfat, dibasisk kalsiumfosfatdihydrat,

erytritol, lav substituert hydroksypropylcellulose, mannitol, pregelatinisert

stivelse eller xylitol,

hvor i minst én av den første og den andre fortynneren er vannfritt dibasisk kalsiumfosfat, og

hvor i den farmasøytiske sammensetningen er i doseringsform med filmdrasjerte tabletter omfattende 2–4 % filmbelegg til anvendelse i forebyggelse eller
5 behandling av følgende sykdommer: atopisk dermatitt, ulcerøs kolitt, dermatitt, allergisk kontakteksem og urtikaria.

2. Den farmasøytiske sammensetningen til anvendelse ifølge krav 1, hvor i

10 R_1 er H, metyl;
 R_2 er H, metyl;
X er et anion valgt fra gruppen bestående av klorid eller $\frac{1}{2}$ dibenzoyltartrat;
j er 1 eller 2.

15 3. Den farmasøytiske sammensetningen til anvendelse ifølge krav 1 eller 2, hvor i X er klorid og j er 2.

20 4. Den farmasøytiske sammensetningen til anvendelse ifølge ett av kravene 1 til 3, omfattende glidemiddel i tillegg.

5. Den farmasøytiske sammensetningen til anvendelse ifølge ett av kravene 1 til 3, hvor i smøremidlet er talkum, polyetyleneglykol, kalsiumbehenat, kalsiumstearat, hydrogenert lakserolje eller magnesiumstearat.

25 6. Den farmasøytiske sammensetningen til anvendelse ifølge ett av kravene 1 til 5, hvor i bindemidlet er kopovidon (kopolymerisater av vinylpyrrolidon med andre vinylderivater), hydroksypropylmetylcellulose (HPMC), hydroksypropylcellulose (HPC) eller polyvinylpyrrolidon (povidon).

30 7. Den farmasøytiske sammensetningen til anvendelse ifølge ett av kravene 1 til 6, hvor i disintegranten er kryskarmellosenatrium.

8. Den farmasøytiske sammensetningen til anvendelse ifølge ett av kravene 6 til 7, hvori det eventuelle glidemidlet i tillegg er kolloidalt silikondioksid.
- 5 9. Den farmasøytiske sammensetningen til anvendelse ifølge ett av kravene 1 til 8, hvori den farmasøytiske sammensetningen omfatter
- 10 30–70 % aktiv ingrediens
5–70 % første fortynner,
5–30 % andre fortynner,
0–30 % bindemiddel,
1–12 % disintegrant, og
0,1–3 % smøremiddel.
- 15 10. Den farmasøytiske sammensetningen til anvendelse ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, omfattende en disintegrant i tillegg.
11. Den farmasøytiske sammensetningen til anvendelse ifølge krav 10, hvori disintegranten i tillegg er krosppovidon.
- 20 12. Den farmasøytiske sammensetningen til anvendelse ifølge krav 1, hvori filmbelegget omfatter et filmdannende middel, en mykner, et glidemiddel og eventuell ett eller flere pigmenter, eventuelt hvori filmbelegget omfatter polyvinylalkohol (PVA) eller hydroksypropylmetylcellulose (HPMC),
25 polyetylglykol (PEG), talkum, titandioksid og jernoksid.