



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3746111 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 38/26 (2006.01)
A61K 9/20 (2006.01)
A61K 45/06 (2006.01)
A61K 47/12 (2006.01)
A61P 3/10 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2023.11.27
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.07.19
(86)	European Application Nr.	19702275.9
(86)	European Filing Date	2019.02.01
(87)	The European Application's Publication Date	2020.12.09
(30)	Priority	2018.02.02, EP, 18154913
(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 validation states	MA; TN
(73)	Proprietor	Novo Nordisk A/S, Novo Allé, 2880 Bagsværd, Danmark
(72)	Inventor	PEDERSEN, Betty, Lomstein, Novo Allé,, 2880 Bagsvaerd, Danmark NISSEN, Birgitte, Novo Allé,, 2880 Bagsvaerd, Danmark
(74)	Agent or Attorney	ONSAGERS AS, Postboks 1813, Vika, 0123 OSLO, Norge

(54)	Title	SOLID COMPOSITIONS COMPRISING A GLP-1 AGONIST, A SALT OF N-(8-(2-HYDROXYBENZOYL)AMINO)CAPRYLIC ACID AND A LUBRICANT
(56)	References Cited:	WO-A1-2014/177683 WO-A1-2017/060500 US-A1- 2015 031 606 MELANIE DAVIES ET AL: "Effect of Oral Semaglutide Compared With Placebo and Subcutaneous Semaglutide on Glycemic Control in Patients With Type 2 Diabetes : A Randomized Clinical Trial", JAMA THE JOURNAL OF THE AMERICAN MEDICAL ASSOCIATION, vol. 318, no. 15, 17 October 2017 (2017-10-17), page 1460, XP055492106, US ISSN: 0098-7484, DOI: 10.1001/jama.2017.14752 STEINERT ROBERT E ET AL: "Oral administration of glucagon-like peptide 1 or peptide YY 3-36 affects food intake in healthy male subjects", THE AMERICAN JOURNAL OF CLINICAL NUTRITION, AMERICAN SOCIETY FOR NUTRITION, US, vol. 92, no. 4, 1 October 2010 (2010-10-01), pages 810-817, XP002677085, ISSN: 0002-9165, DOI: 10.3945/AJCN.2010.29663

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/>

FASTE SAMMENSETNINGER OMFATTENDE EN GLP-1-AGONIST OG ET SALT AV N-(8-(2-HYDROKSYBENZOYL)AMINO)KAPRYLSYRE OG ET SMØREMIDDEL

PATENTKRAV

5

1. Farmasøytisk sammensetning omfattende

a) 0,5–50 mg av en GLP-1-agonist og

b) 20–800 mg, slik som 50–500 mg, av et salt av N-(8-(2-hydroksybenzoyl)amino)kaprylsyre og

10

c) 0,6–20 mg, slik som 1–10 mg, smøremiddel,

hvor saltet av N-(8-(2-hydroksybenzoyl)amino)kaprylsyre utgjør minst 95 vekt-% av eksipiensene i sammensetningen.

2. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1, hvor smøremidlet er magnesiumstearat eller glyceryldibehenat.

15

3. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1, hvor smøremidlet er magnesiumstearat.

4. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1, krav 2 eller krav 3 som består av:

20

a) 0,5–50 mg av en GLP-1-agonist,

b) 20–800 mg, slik som 50–500 mg, av et salt av N-(8-(2-hydroksybenzoyl)amino)kaprylsyre og

c) 0,6–20 mg, slik som 1–10 mg, smøremiddel.

25

5. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvor saltet av N-(8-(2-hydroksybenzoyl)amino)kaprylsyre utgjør minst 90 vekt-% av sammensetningen.

6. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvor sammensetningene omfatter 1–8 mg, slik som 2–5 mg eller slik som 2–3 mg magnesiumstearat per 100 mg av saltet av N-(8-(2-hydroksybenzoyl)amino)kaprylsyre.

30

7. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvor GLP-1-agonisten er et GLP-1-peptid substituert med en fettsyre eller en fettdisyre.

35

8. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvor GLP-1-agonisten er semaglutid.

9. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene 1–6, hvori GLP-1-agonisten er $N^{\epsilon 26}$ -{2-[2-(2-[2-(2-{(S)-4-karboksy-4-[10-(4-karboksyfenoksy)dekanoylamino]butyrylamino}-etoksy)etoksy]acetylamino}etoksy)etoksy]acetyl}, $N^{\epsilon 37}$ -{2-[2-(2-[2-(2-{(S)-4-karboksy-4-[10-(4-karboksyfenoksy)dekanoylamino]butyrylamino}etoksy)etoksy]acetylamino}-etoksy)etoksy]-acetyl}-[Aib⁸,Arg³⁴,Lys³⁷]GLP-1(7-37)-peptid (GLP-1-agonist B).
10. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene 1–6, hvori GLP-1-agonisten er $N^{\epsilon 27}$ -[2-[2-[2-[2-[2-[2-[(4S)-4-karboksy-4-[10-(4-karboksyfenoksy)dekanoylamino]butanoyl]-amino]etoksy]etoksy]acetyl]amino]etoksy]etoksy]-acetyl], $N^{\epsilon 36}$ -[2-[2-[2-[2-[2-[2-[(4S)-4-karboksy-4-[10-(4-karboksyfenoksy)dekanoylamino]butanoyl]amino]etoksy]etoksy]acetyl]-amino]etoksy]etoksy]acetyl]-[Aib⁸,Glu²²,Arg²⁶,Lys²⁷,Glu³⁰,Arg³⁴,Lys³⁶]-GLP-1-(7-37)-peptidyl-Glu-Gly (GLP-1-agonist C).
11. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori saltet av N-(8-(2-hydroksybenzoyl)amino)kaprylsyre er natrium-N-(8-(2-hydroksybenzoyl)amino)kaprylat (SNAC).
12. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori sammensetningen omfatter minst ett granulat omfattende saltet av N-(8-(2-hydroksybenzoyl)amino)kaprylsyre.
13. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 12, hvori det minst ene granulatet videre omfatter smøremidlet.
14. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 12 eller 13, hvori det minst ene granulatet videre omfatter GLP-1-agonisten.
15. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene 12–14, hvori det minst ene granulatet fremstilles ved tørrgranulering, slik som ved valsekompaktering.
16. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 12–15, hvori sammensetningen omfatter en ekstragranulær del.

17. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 16, hvori den ekstragranulære delen av sammensetningen omfatter et smøremiddel eller glidemiddel, slik som magnesiumstearat og/eller GLP-1-agonisten.
- 5 18. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene 1–7 og 11–17, hvori en doseringsenhet omfatter;
- a) 0,5–20 mg semaglutid,
 - b) 50–400 mg SNAC og
 - c) 1–10 mg smøremiddel.
- 10 19. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene 1–7 og 11–17, hvori en doseringsenhet omfatter;
- a) 1–10 mg semaglutid,
 - b) 50–300 mg SNAC og
 - 15 c) 1–10 mg magnesiumstearat.
- 20 20. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene 1–7 og 11–17, hvori en doseringsenhet omfatter;
- a) 0,5–20 mg av GLP-1-agonisten C,
 - 20 b) 50–400 mg SNAC og
 - c) 1–10 mg smøremiddel.
- 25 21. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene 1–7 og 11–17, hvori en doseringsenhet omfatter;
- a) 1–10 mg av GLP-1-agonisten C,
 - b) 50–300 mg SNAC og
 - c) 1–10 mg magnesiumstearat.
- 30 22. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori sammensetningen er en fast sammensetning, slik som en tablett for oral administrering.
- 35 23. Farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene for anvendelse i medisin.
24. Farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av diabetes og/eller fedme.