



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2349204 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/00 (2006.01)
A61K 9/16 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2018.10.15
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.04.11
(86)	European Application Nr.	09783687.8
(86)	European Filing Date	2009.10.02
(87)	The European Application's Publication Date	2011.08.03
(30)	Priority	2008.10.02, EP, 08382040 2008.10.09, US, 104113 P
(84)	Designated Contracting States:	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 ; SE ; SI ; SK ; SM ; TR
	Designated Extension States:	AL; BA; RS
(73)	Proprietor	Laboratorios Liconsa, S.A., Gran Via Carles III 98 Ed. Trade, 08028 Barcelona, Spania
(72)	Inventor	AMIGHI, Karim, Clos Alberto Santos Dumont 8, 1150 Brussels, Belgia SERENO GUERRA, Antonio, C. Pasiewijk 21, 1820 Melsbroeck, Belgia
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

(54)	Title	INHALABLE PARTICLES COMPRISING TIOTROPIUM
(56)	References Cited:	EP-A- 1 508 330, WO-A-2007/075858, WO-A-2009/007687, MALCOLMSON R J ET AL: "DRY POWDER FORMULATIONS FOR PULMONARY DELIVERY" PHARMACEUTICAL SCIENCE AND TECHNOLOGY TODAY, ELSEVIER TRENDS JOURNALS, CAMBRIDGE, GB, vol. 1, no. 9, 1 December 1998 (1998-12-01), pages 394-398, XP001205507 ISSN: 1461-5347, US-A1- 2002 081 266, US-A1- 2004 042 970, WO-A2-2009/095681

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

5 **1.** Inhalerbare partikler omfattende en stabilisert vannfri amorf form av tiotropium med et stabiliseringsmiddel, som er laktose, hvori den stabiliserte amorfe formen av tiotropium med stabiliseringsmiddelet omfatter en matriks i hvilken tiotropium er dispergert i en molekylær tilstand, eller hvori den stabiliserte amorfe formen av tiotropium med stabiliseringsmiddelet omfatter amorft tiotropium dispergert på stabiliseringsmiddelets overflate, og hvori
10 partiklene er blandet med én eller flere grove eksipienter med en gjennomsnittlig partikkelstørrelse på 15 til 250 µm.

15 **2.** Inhalerbare partikler ifølge krav 1, hvori tiotropium omfatter tiotropiumbromid.

3. Inhalerbare partikler ifølge hvilket som helst av kravene 1 - 2, med en gjennomsnittlig aerodynamisk partikkelstørrelse på opptil 10 µm.

20 **4.** Inhalerbare partikler ifølge krav 1, hvori den grove eksipienten er laktose.

5. Farmasøytisk sammensetning omfattende inhalerbare partikler ifølge hvilke som helst av kravene 1 eller 4.

25 **6.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 5, hvori innholdet av tiotropiumbase er fra 0,02 til 0,8 %.

7. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge hvilket som helst av kravene 5 - 6 i form av en kapsel for inhalering.

30 **8.** Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 7, hvori kapselen omfatter hydroksypropylmetylcellulose.

9. Fremgangsmåte for fremstilling av inhalerbare partikler ifølge hvilke som helst av kravene 1 - 4, omfattende følgende trinn:

35 a) å løse opp eller dispergere stabiliseringsmiddelet i et flyktig vannblandbart løsemiddel eventuelt inneholdende vann for å danne en løsning eller en suspensjon;

b) å løse opp et tiotropiumsalt eller et solvat derav eller en hvilken som helst fast form derav i et flyktig vannblandbart løsemiddel eventuelt inneholdende vann;

c) å blande løsningen fra trinn b) og løsningen eller suspensjonen fra trinn a);

5 d) å sprøytetørke løsningen/suspensjonen fra trinn c) for å oppnå de ønskede partiklene; og

e) å blande partiklene fra trinn d) med én eller flere grove eksipienter med en gjennomsnittlig partikkelstørrelse på 15 til 250 μm .

10 **10.** Fremgangsmåten ifølge krav 9, hvori når en suspensjon dannes i trinn a), inneholder ikke det anvendte løsemiddelet vann, og stabiliseringsmiddelet er i form av partikler med en gjennomsnittlig partikkelstørrelse på 1 - 9 μm .

15 **11.** Inhalerbare partikler som definert i hvilke som helst av kravene 1 - 4 for anvendelse i behandling av astma eller kronisk obstruktiv lungesykdom.