



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2600830 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/00 (2006.01)
A61K 31/44 (2006.01)
A61P 11/06 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

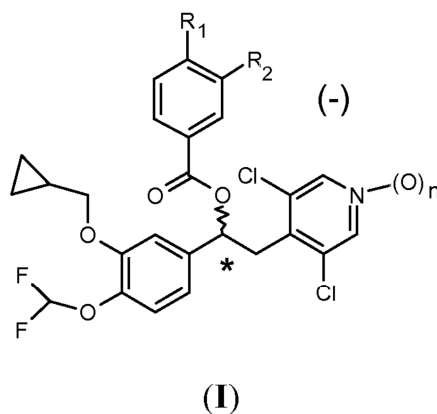
(21)	Translation Published	2018.06.25
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.02.21
(86)	European Application Nr.	11741172.8
(86)	European Filing Date	2011.07.27
(87)	The European Application's Publication Date	2013.06.12
(30)	Priority	2010.08.03, EP, 10171748
(84)	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
(73)	Proprietor	Chiesi Farmaceutici S.p.A., Via Palermo, 26/A, 43100 Parma, IT-Italia
(72)	Inventor	COCCONI, Daniela, Via Palermo 26/A, I-43100 Parma, IT-Italia SCHIARETTI, Francesca, Via Palermo 26/A, I-43100 Parma, IT-Italia BILZI, Roberto, c/o Chiesi Farmaceutici S.p.a. Via Palermo 26/A, I-43100 Parma, IT-Italia
(74)	Agent or Attorney	OSLO PATENTKONTOR AS, Postboks 7007 M, 0306 OSLO, Norge

(54)	Title	DRY POWDER FORMULATION COMPRISING A PHOSPHODIESTERASE INHIBITOR
(56)	References Cited:	EP-A1- 2 070 913, WO-A2-2009/018909, WO-A1-2006/131452, EP-A1- 2 216 327

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. Inhalerbar tørr pulverformulering omfattende mikroniserte partikler av en forbindelse av den generelle formel (I) som (-)-enantiomer,



5 hvor:

n er 0 eller 1;

R_1 og R_2 kan være like eller forskjellige og er valgt fra gruppen bestående av:

10 - lineær eller forgrenet C_1 - C_6 alkyl, eventuelt substituert med ett eller flere halogenatomer;

- OR_3 hvor R_3 er en forgrenet eller lineær C_1 - C_6 alkyl eventuelt substituert med ett eller flere halogenatomer eller C_3 - C_7 cykloalkylgrupper; og

- $HNSO_2R_4$ hvor R_4 er en lineær eller forgrenet C_1 - C_4 alkyl eventuelt substituert med ett eller flere halogenatomer;

15 hvor minst én av R_1 og R_2 er $HNSO_2R_4$;

samt grove bærerpartikler laget av et fysiologisk akseptabelt farmakologisk inert materiale med en massediameter på 150 til 400 mikron;

hvor nevnte forbindelse administreres ved en terapeutisk effektiv enkelt dose omfattende mellom 300 μ g og 2000 μ g.

20 **2.** Inhalerbart pulver ifølge krav 1, hvor enkeltdosen omfatter mellom 300 μ g og 600 μ g.

3. Inhalerbart pulver ifølge krav 2, hvor enkeltdosen er 400 μ g eller 600 μ g.

4. Inhalerbart pulver ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvor forbindelsen av formel (I) er (-)-3-cyklopropylmetoksy-4-metansulfonylamino-

benzosyre 1-(3-cyklopropylmetoksy-4-difluormetoksy-fenyl)-2-(3,5-diklor-1-oksy-pyridin-4-yl)-etylester (C2).

- 5.** Inhalerbart pulver ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, hvor det fysiologisk akseptable farmakologisk inerte materialet er et krystallinsk sukker valgt fra gruppen bestående av glukose, arabinose, maltose, sakkarose, dekstroser og laktose eller en polyalkohol valgt fra gruppen bestående av mannitol, maltitol, laktitol og sorbitol.
- 6.** Inhalerbart pulver ifølge krav 5, hvor sukkeret er laktose.
- 7.** Inhalerbart pulver ifølge krav 6, hvor sukkeret er α -laktose-monohydrat.
- 8.** Inhalerbart pulver ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7, hvor de grove bærerpartiklene har en massediameter som ligger mellom 212 og 355 mikron.
- 9.** Inhalerbart pulver ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, videre omfattende ett eller flere ytterligere materialer valgt fra gruppen bestående av aminosyrer, vannoppløselige overflateaktive midler, smøremidler og glidemidler.
- 10.** Inhalerbart pulver ifølge krav 9, hvor det ytterligere materialet er et smøremiddel.
- 11.** Inhalerbart pulver ifølge krav 10, hvor det ytterligere materialet er magnesiumstearat.
- 12.** Inhalerbart pulver ifølge krav 11, hvor magnesiumstearatet er til stede i en mengde som ligger mellom 0,01 og 2 vekt% basert på den totale vekten av formuleringen.
- 13.** Inhalerbart pulver ifølge krav 12, hvor mengde av magnesiumstearat ligger mellom 0,02 og 1 % w/w.
- 14.** Inhalerbart pulver ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, ytterligere omfattende finoppdelte partikler av et fysiologisk akseptabelt farmakologisk inert materiale med en MMD lik eller mindre enn 15 mikron.

- 15.** Tørrpulver-inhalator omfattende en inhalerbar tørr pulverformulering ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 14.
- 16.** Inhalerbar tørr pulverformulering ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 14 for anvendelse til forebygging og/eller behandling av en respiratorisk sykdom.
- 5 **17.** Inhalerbar tørr pulverformulering ifølge krav 16, hvor sykdommen er astma og kronisk obstruktiv lungesykdom (KOLS).
- 18.** Forpakning omfattende en inhalerbar tørr pulverformulering ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 14 og en tørrpulver-inhalator.