



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2621488 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/198 (2006.01)
A61K 9/00 (2006.01)
A61K 33/06 (2006.01)
A61K 33/14 (2006.01)
A61P 11/00 (2006.01)
A61P 11/10 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2019.04.15
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.11.07
(86)	European Application Nr.	11767877.1
(86)	European Filing Date	2011.09.29
(87)	The European Application's Publication Date	2013.08.07
(30)	Priority	2010.09.29, US, 387855 P 2011.08.26, WO, PCT/US11/049435
(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	Pulmatrix Operating Company, Inc., 99 Hayden Avenue, Lexington, MA 02421, USA
(72)	Inventor	LIPP, Michael M., 45A Flanagan Drive, FraminghamMassachusetts 01701, USA SUNG, Jean C., 259A Putnam Avenue, CambridgeMassachusetts 02139, USA
(74)	Agent or Attorney	TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

(54) Title **CATIONIC DRY POWDERS**

(56) References
Cited: WO-A2-01/13892, WO-A2-2010/111680, JAGDEEP SHUR ET AL: "Cospray-dried unfractionated heparin with L-leucine as a dry powder inhaler mucolytic for cystic fibrosis therapy", JOURNAL OF PHARMACEUTICAL SCIENCES, vol. 97, no. 11, 1 November 2008 (2008-11-01), pages 4857-4868, XP055011201, ISSN: 0022-3549, DOI: 10.1002/jps.21362, Anonymous: "Respiratory Drug Delivery Europe 2011 - In Review", RDD Online , pages 1-2, Retrieved from the Internet: URL:<http://www.rddonline.com/rdd/rdd.php?i d=6> [retrieved on 2015-09-07], WO-A1-2009/140587, WO-A2-2010/111650, US-A1- 2008 127 972, SUNG ET AL.: "iSpense™: formulation and in vitro characterization of a novel dry powder drug delivery technology", RESPIRATORY DRUG DELIVERY EUROPE, 3 May 2011 (2011-05-03), - 6 May 2011 (2011-05-06), pages 411-413,

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. Tørrpulver som kan pustes inn som omfatter sprøytetørkede tørrpartikler som kan pustes inn som omfatter

- 5 a) et kalsiumsalt som har en oppløselighet på $\geq 0,5$ g/l i vann; hvori kalsiumsaltet tilveiebringer kalsiumion i en mengde mellom 0,1 og 2,9 vekt-% av tørrpartikkelen, og
b) et farmasøytisk akseptabelt middel,
hvor tørrpulveret som kan pustes inn ikke inneholder et fosfolipid, og hvori tørrpartiklene som kan pustes inn er sprøytetørket, har en volummedian geometrisk diameter (VMGD)
10 på 10 mikrometer (mikron) eller mindre og et dispersjonsbarhetsforhold (1 bar/4 bar) på mindre enn 1,5 målt ved 1 bar- og 4 bar-dispersjonsinnstillingene ved laserdiffraksjon (RODOS/HELOS-system) målt i avsnitt [0274], og hvori tørrpartiklene som kan pustes inn har en tappetthet på mer enn 0,4 g/ml (g/cc), målt i avsnitt [0273] ved hjelp av en SOTAX-tappetthetstester.

15

2. Tørrpulver som kan pustes inn ifølge krav 1, hvori

(i) tørrpulveret som kan pustes inn har en volummedian geometrisk diameter (VMGD) på 5,0 mikrometer (mikron) eller mindre, eller

- 20 (ii) tørrpulveret som kan pustes inn har en finpartikkelfraksjon (FPF) på mindre enn 5,6 mikrometer (mikron) på minst 45 %, målt i avsnitt [0258-259], eller

(iii) tørrpulveret som kan pustes inn har en massemedian aerodynamisk diameter (MMAD) på 5 mikrometer (mikron) målt i avsnitt [0247], eller

(iv) molekylvektforholdet mellom kalsiumion- og kalsiumsaltet er større enn 0,1.

- 25 **3.** Tørrpulveret som kan pustes inn ifølge et hvilket som helst av kravene 1 eller 2, hvori tørrpulveret består av sprøytetørkede tørrpartikler som kan pustes inn.

4. Tørrpulveret som kan pustes inn ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori tørrpulveret som kan pustes inn videre omfatter minst en farmasøytisk akseptabel eksipiens, eventuelt hvori den minst ene farmasøytisk akseptable eksipiensen er til stede i en mengde på 50 vekt-% eller hvori den minst ene farmasøytisk akseptable eksipiensen er til stede i en mengde på ≤ 50 vekt-% og omfatter leucin, eller hvori den minst ene farmasøytisk akseptable eksipiensen er til stede i en mengde på ≤ 50 vekt-% og omfatter maltodekstrin eller mannitol.

35

5. Tørrpulveret ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori

- (i) det farmasøytisk aktive midlet er et antibiotikum, en langtidsvirkende beta-2-agonist (LABA), en langtidsvirkende muskarinantagonist (LAMA), et kortikosteroid eller en hvilken som helst kombinasjon derav, eller
- (ii) det farmasøytisk aktive midlet er et makromolekyl, eller
- 5 (iii) det farmasøytisk aktive midlet er et antistoff.

6. Tørrpulveret ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori tørrpartiklene som kan pustes inn er ytterligere **karakterisert av** en kapselutsendt pulvermasse (CEPM) på minst 70 % ved utsendelse fra en tørrpulverinhalator under

10 følgende forhold: en total inhalasjonsenergi på mindre enn 0,28 Joule ved anvendelse av en kapsel som består av 50 mg av tørrpulveret som kan pustes inn.

7. Tørrpulveret som kan pustes inn ifølge et hvilket som helst foregående krav, hvori kalsiumsaltet er kalsiumlaktat.

15

8. Tørrpulver som kan pustes inn ifølge et hvilket som helst av kravene 1-7 for anvendelse i terapi.

9. Effektiv mengde av et tørrpulver som kan pustes inn ifølge et hvilket som helst av

20 kravene 1-7 for anvendelse ved behandling av en luftveissykdom, hvori luftveissykdommen er astma, luftveishyperresponsivitet, sesongallergisk allergi, bronkiektase, kronisk bronkitt, emfysem, kronisk obstruktiv lungesykdom, eller cystisk fibrose.

10. Effektiv mengde av et tørrpulver som kan pustes inn ifølge et hvilket som helst av

25 kravene 1-7 for anvendelse ved behandling eller forebygging av en luftveissykdom, hvori luftveissykdommen er astma, luftveishyperresponsivitet, sesongallergisk allergi, bronkiektase, kronisk bronkitt, emfysem, kronisk obstruktiv lungesykdom eller cystisk fibrose.

11. Effektiv mengde av et tørrpulver som kan pustes inn ifølge et hvilket som helst av

30 kravene 1-7 for anvendelse ved behandling eller forebygging av en smittsom sykdom i luftveiene.