



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2934544 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/573 (2006.01)
A61K 9/00 (2006.01)
A61K 9/08 (2006.01)
A61K 31/58 (2006.01)
A61K 47/02 (2006.01)
A61K 47/10 (2017.01)
A61P 11/00 (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.	13808056.9
(86)	European Filing Date	2013.12.18
(87)	The European Application's Publication Date	2015.10.28
(30)	Priority	2012.12.21, EP, 12199302 2013.10.25, EP, 13190393
(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	Boehringer Ingelheim Vetmedica GmbH, Binger Strasse 173, 55216 Ingelheim am Rhein, Tyskland
(72)	Inventor	AVEN, Michael, Boehringer Ingelheim GmbHCorporate PatentsBinger Straße 173, 55216 Ingelheim Am Rhein, Tyskland ALBRECHT, Balazs, Boehringer Ingelheim GmbHCorporate PatentsBinger Straße 173, 55216 Ingelheim Am Rhein, Tyskland FRANZMANN, Benjamin, Boehringer Ingelheim GmbHCorporate PatentsBinger Straße 173, 55216 Ingelheim Am Rhein, Tyskland HAUSMANN, Matthias, Boehringer Ingelheim GmbHCorporate PatentsBinger Straße 173, 55216 Ingelheim Am Rhein, Tyskland LAMAR, Janine, Boehringer Ingelheim GmbHCorporate PatentsBinger Straße 173, 55216 Ingelheim Am Rhein, Tyskland LANG, Ingo, Boehringer Ingelheim GmbHCorporate PatentsBinger Straße 173, 55216 Ingelheim Am Rhein, Tyskland
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54) Title **PHARMACEUTICAL FORMULATION COMPRISING CICLESONIDE**

(56) References

Cited: US-A1- 2004 266 869, US-A1- 2006 069 073, US-A1- 2006 293 293, DIETZEL K ET AL:
"Ciclesonide: An on-site-activated steroid (New drugs for Asthma, Allerg and COPD.)",
PROGRESS IN RESPIRATORY RESEARCH, KARGER, BASEL, CH, vol. 31, 1 January 2001
(2001-01-01), pages 91-93, XP008089200, ISSN: 1422-2140, US-A1- 2012 058 980, J.
DAUVILLIER ET AL: "Effect of Long-Term Fluticasone Treatment on Immune Function in Horses
with Heaves", JOURNAL OF VETERINARY INTERNAL MEDICINE, vol. 25, no. 3, 1 May 2011
(2011-05-01), pages 549-557, XP055057584, ISSN: 0891-6640, DOI: 10.1111/j.1939-
1676.2011.0717.x, US-A1- 2007 134 165

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/>

P A T E N T K R A V

1. Farmasøytisk formulering av ciklesonid omfattende/inneholdende
(i) den aktive substansen ciklesonid eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav,
5 (ii) minst én farmakologisk akseptabel syre,
hvor formuleringen er en etanolisk oppløsning eller en oppløsning inneholdende en
blanding av etanol og vann, og
hvor $-\log_{10}[\text{H}^+]$ ligger i området fra 4,0 til 4,6 og
hvor den farmasøytiske formulering av ciklesonid er som følger:

10

Ingrediens	Innhold
Ciklesonid	0,7 - 3,1 g/100 ml
Saltsyre	Ad $[\text{H}^+] = 10^{-3,5}$ til 10^{-5} mol/l
90% volum/volum etanol/vann	Ad 100 ml

2. Farmasøytisk formulering ifølge krav 1, hvori formuleringen er en oppløsning
for inhalering.

15

3. Farmasøytisk formulering ifølge ett av kravene 1 eller 2, hvori formuleringen
administreres via en (hest) inhalatoranordning.

4. Fremgangsmåte for fremstilling av den farmasøytiske formulering av ciklesonid
20 ifølge krav 1 omfattende de følgende trinn:

- a. oppløsning av ciklesonid i et løsningsmiddel omfattende etanol og vann,
b. tilsetning av en fast mengde saltsyre (HCl), fortrinnsvis som en 0,1 eller 1,0 molar
løsning, for å oppnå en verdi av $\log_{10}[\text{H}^+]$ i området fra 4,0 til 4,6.

- 25 5. Fremgangsmåte ifølge krav 4, hvor andelen etanol i løsningsmidlet i trinn a) er
90% volum/volum etanol.

6. Fremgangsmåte ifølge krav 4 eller 5, hvori ciklesonid først oppløses i etanol og
mengden vann som er nødvendig for å oppnå den ønskede
30 løsningsmiddelsammensetningen tilsettes deretter.

7. Fremgangsmåte ifølge krav 4 til 6 omfattende de ytterligere trinnene:

- c. blanding inntil det dannes en homogen løsning,
- d. eventuelt filtrering av løsningen, fortrinnsvis gjennom ett eller flere filtre med en porestørrelse på maksimalt 1,0 μm for minst ett av filtrene, mest foretrukket maksimalt 0,2 μm ,
- 5 e. eventuelt fylling av oppløsningen i beholdere som er egnet for langtidslagring og for anvendelse med passende inhalator.

8. Farmasøytisk formulering av ciklesonid som kan oppnås ved en fremgangsmåte ifølge krav 4 til 7.

10

9. Inhalasjonskit bestående av en farmasøytisk formulering ifølge ett av kravene 1 til 3 eller 8, en (hest) inhalatoranordning, fortrinnsvis en trykksatt doseinhalator eller en vandig/etanolisk dråpeinhalator, slik som Respimat® inhalatoren eller en annen inhalator ved anvendelse av Respimat® aerosolgenererende teknologi, egnet
15 for forstøvning av denne farmasøytiske formuleringen, en adapter for anvendelse i hester, og eventuelt en instruksjonsbrosjyre eller informasjon og rettleiding for anvendelse.

20