



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 2948148 B1

NORWAY

(19) NO  
(51) Int Cl.  
**A61K 31/44 (2006.01)**  
**A61K 9/00 (2006.01)**  
**A61K 45/06 (2006.01)**  
**A61P 11/00 (2006.01)**  
**A61P 29/00 (2006.01)**  
**A61P 37/00 (2006.01)**

**Norwegian Industrial Property Office**

---

|      |                                                                            |                                                                                                                                                                                                   |
|------|----------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| (45) | Translation Published                                                      | 2020.12.21                                                                                                                                                                                        |
| (80) | Date of The European<br>Patent Office Publication of<br>the Granted Patent | 2020.07.29                                                                                                                                                                                        |
| (86) | European Application Nr.                                                   | 14705875.4                                                                                                                                                                                        |
| (86) | European Filing Date                                                       | 2014.01.28                                                                                                                                                                                        |
| (87) | The European Application's<br>Publication Date                             | 2015.12.02                                                                                                                                                                                        |
| (30) | Priority                                                                   | 2013.01.28, IN, 354CH2013<br>2013.01.28, IN, 355CH2013                                                                                                                                            |
| (84) | Designated Contracting<br>States:                                          | AL ; AT ; BE ; BG ; CH ; CY ; CZ ; DE ; DK ; EE ; ES ; FI ; FR ; GB ; GR ; HR ; HU ;<br>IE ; IS ; IT ; LI ; LT ; LU ; LV ; MC ; MK ; MT ; NL ; NO ; PL ; PT ; RO ; RS ; SE ; SI ;<br>SK ; SM ; TR |
| (73) | Proprietor                                                                 | Incozen Therapeutics Pvt. Ltd., 450, Alexandria Knowledge Park, Phase I<br>Shameerpet, Hyderabad 500 078, India                                                                                   |
| (72) | Inventor                                                                   | VAKKALANKA, Swaroop Kumar, c/o Incozen Therapeutics Pvt. Ltd.450 Alexandria<br>Knowledge ParkPhase I, ShameerpetHyderabad 500078, India                                                           |
| (74) | Agent or Attorney                                                          | Novagraaf Brevets, Bâtiment O2, 2 rue Sarah Bernhardt CS90017, 92665<br>ASNIÈRES-SUR-SEINE CEDEX, Frankrike                                                                                       |

---

|      |                      |                                                                                                                        |
|------|----------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| (54) | Title                | <b>METHODS OF TREATING AUTOIMMUNE, RESPIRATORY AND INFLAMMATORY<br/>DISORDERS BY INHALATION OF ROFLUMILAST N-OXIDE</b> |
| (56) | References<br>Cited: | WO-A1-2004/047829<br>WO-A1-2006/094942<br>WO-A1-2004/084894<br>WO-A1-95/01338<br>US-A1- 2006 270 667                   |

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. Roflumilast N-oksidi eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme som oppviser en  $d_{50}$  på mindre enn omtrent 6 mikrometer og en  $d_{90}$  på (i) mindre eller lik omtrent 10 mikrometer (ii) mindre enn omtrent 6 mikrometer, eller (iii) mellom omtrent 1 og omtrent 6 mikrometer for anvendelse i behandling av en autoimmun, respiratorisk eller inflammatorisk sykdom eller tilstand i et subjekt med behov for samme som omfatter lunge-administrering i en effektiv mengde.  
5
2. Roflumilast N-oksidi eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme for anvendelse ifølge krav 1, hvori nevnte roflumilast N-oksidi eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme administreres ved inhalering som et tørt pulver, en løsning eller suspensjon.  
10
3. Roflumilast N-oksidi eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme for anvendelse ifølge krav 2, hvori nevnte roflumilast N-oksidi eller farmasøytisk akseptabelt salt av samme administreres som et tørt pulver.  
15
4. Roflumilast N-oksidi eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme for anvendelse ifølge ett av kravene foran, hvori nevnte roflumilast N-oksidi eller farmasøytisk akseptabelt salt av samme administreres som en enkeltdose med  
20
  - (i) 5 µg til 2000 µg;
  - (ii) 20 µg til 1200 µg;
  - (iii) 50 µg til 1000 µg;
  - (iv) 100 µg til 800 µg eller
  - (v) 100 µg, 200 µg, 400 µg eller 600 µg.
- 25
5. Roflumilast N-oksidi eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme for anvendelse ifølge ett av kravene foran, hvori sykdommen eller tilstanden er valgt fra astma, COPD,

kronisk obstruktiv bronchiolitis, akutt bronkitt, kronisk bronkitt, emfysem, allergisk rhinitt og ikke-allergisk rhinitt.

6. Roflumilast N-oksidi eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme for anvendelse ifølge ett av kravene foran, hvori nevnte roflumilast N-oksidi eller farmasøytisk akseptabelt salt av samme administreres i kombinasjon med en langt-virkende  $\beta$ 2-agonist, en M3-antagonist, et kortikosteroid, hvori

(i) den langt-virkende  $\beta$ 2 agonist er valgt fra carmoterol, GSK-642444, indacaterol, milveterol, arformoterol, formoterol, salbutamol, formoterol, levalbuterol, terbutalin, AZD-3199, BI-1744-CL, LAS-100977, bambuterol, isoproterenol, procaterol, clenbuterol, reproterol, fenoterol, ASF-1020,

(ii) M3-antagonisten er valgt fra aclidinium, tiotropium, ipratropium og oxitropium,

(iii) kortikosteroidet er valgt fra gruppen bestående av dexametason, fluticason, fluticason-furoat, prednisolon, betametason, budesonid, mometason, mometason-furoat, triamcinolon-acetonid, ciclesonid, TPI- 1020, beclometason, beclometason-dipropionat, prednison, deflazacort, hydrokortison, QAE-397, flunisolid; og enhver kombinasjon av samme.

7. Roflumilast N-oksidi eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme for anvendelse ifølge ett av kravene foran, omfatter lunge-administrering av omtrent 600 til omtrent 1000  $\mu$ g av roflumilast N-oksidi eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

8. Roflumilast N-oksidi eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme for anvendelse ifølge ett av kravene foran, omfatter lunge-administrering av omtrent 600 til omtrent 800  $\mu$ g av roflumilast N-oksidi eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

9. Roflumilast N-oksidi eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme for anvendelse ifølge ett av kravene foran, hvori  $d_{90}$  for roflumilast N-oksidi eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme er mellom omtrent 0,5 og omtrent 5 mikrometer.

10. Farmasøytisk blanding som omfatter roflumilast N-oksidi og, valgfritt, én eller flere farmasøytisk akseptable bærere og/eller hjelpestoffer, hvori blandingen administreres ved inhalering og roflumilast N-oksidi eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme har en  $d_{50}$  på mindre enn omtrent 6 mikrometer og hvori  $d_{90}$  for roflumilast N-oksidi er (i) omtrent 10 mikrometer eller mindre, (ii) mindre enn omtrent 6 mikrometer eller (iii) mellom omtrent 1 og omtrent 6 mikrometer.
11. Farmasøytisk blanding ifølge krav 10 i en form egnet for administrering med en inhalator med tilmålt dose (MDI) eller en inhalator for tørt pulver (DPI).
12. Farmasøytisk blanding ifølge krav 10, hvori den farmasøytiske blandingen er i form av et inhalerbart tørt pulver som omfatter mikroniserte partikler av roflumilast N-oksidi eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme som en aktiv bestanddel og partikler av en fysiologisk akseptabel farmakologisk-inert fast bærer.
13. Farmasøytisk blanding ifølge krav 10, hvori den farmasøytiske blandingen er i form av en aerosol som omfatter roflumilast N-oksidi eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme som en aktiv bestanddel, et drivmiddel og, valgfritt, én eller flere av tilblandede løsningsmidler, farmasøytisk akseptable bærere og/eller hjelpestoffer.
14. Farmasøytisk blanding ifølge ett av kravene 10-13, omfatter videre en langt-virkende  $\beta_2$ -agonist, en M3-agonist, et kortikosteroid, hvori
- (i) den langt-virkende  $\beta_2$ -agonist er valgt fra carmoterol, GSK-642444, indacaterol, milveterol, arformoterol, formoterol, salbutamol, formoterol, levalbuterol, terbutalin, AZD-3199, BI-1744-CL, LAS-100977, bambuterol, isoproterenol, procaterol, clenbuterol, reproterol, fenoterol, ASF-1020,
  - (ii) M3-antagonisten er valgt fra aclidinium, tiotropium, ipratropium og oxitropium,

(iii) nevnte kortikosteroid er valgt fra gruppen bestående av dexametason, fluticason, fluticason-furoat, prednisolon, betametason, budesonid, mometason, mometason- furoat, triamcinolon-acetonid, ciclesonid, TPI- 1020, beclometason, beclometason- dipropionat, prednison, deflazacort, hydrokortison, QAE-397, flunisolid; og enhver kombinasjon av samme.

15. Farmasøytisk blanding ifølge ett av kravene 10-14, hvori nevnte roflumilast N-oksidi eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme er vannfri, en oppløsning, eller et hydrat.

16. Farmasøytisk blanding ifølge ett av kravene 10-15, hvori den farmasøytiske blandingen omfatter omtrent 600 til omtrent 1000 µg roflumilast N-oksidi eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

17. Farmasøytisk blanding ifølge ett av kravene 10-16, hvori den farmasøytiske blandingen omfatter omtrent 600 til omtrent 800 µg roflumilast N-oksidi eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme.

18. Farmasøytisk blanding ifølge ett av kravene 10-17, hvori  $d_{90}$  for roflumilast N-oksidi eller et farmasøytisk akseptabelt salt av samme er mellom omtrent 0,5 og omtrent 5 mikrometer.