



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3091976 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61P 9/12 (2006.01)
A61K 9/00 (2006.01)
A61K 31/4418 (2006.01)
A61K 31/573 (2006.01)
A61K 47/02 (2006.01)
A61K 47/12 (2006.01)
A61P 11/00 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2024.12.16
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2024.07.24
(86)	European Application Nr.	15735018.2
(86)	European Filing Date	2015.01.09
(87)	The European Application's Publication Date	2016.11.16
(30)	Priority	2014.01.10, US, 201461925791 P 2014.03.12, US, 201461951686 P 2014.04.09, US, 201461977529 P 2014.05.19, US, 201462000473 P
(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	Avalyn Pharma Inc., 245 First Street, 18th Floor, Cambridge, MA 02142, USA
(72)	Inventor	SURBER, Mark, William, 3773 Wellborn Street, San Diego, CA 92103, USA
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54)	Title	AEROSOL PIRFENIDONE AND PYRIDONE ANALOG COMPOUNDS AND USES THEREOF
(56)	References Cited:	US-A1- 2013 310 424 US-A1- 2012 192 861

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. Vandig løsning av pirfenidon for bruk ved behandling av interstitiell lungesykdom hos et individ, hvor behandlingen omfatter forstøvet administrering fra en forstøver gjennom inhalasjon til individet,
5 hvor den vandige løsningen omfatter:
 - vann;
 - pirfenidon i en konsentrasjon fra 4,0 mg/mL til 16,0 mg /mL;
 - en sitratbuffer formulert med natriumsitrat;
 - natriumklorid i en konsentrasjon mellom 100mM og 200 mM; og
 - 10 et smaksmaskeringsmiddel som er natriumsakkarin og som foreligger i en konsentrasjon mellom 0,1 mM og 0,9 mM;
 - hvor konsentrasjonen av natriumsakkarin er mellom 0,1 mM og 0,4 mM ved pirfenidonkonsentrasjoner på 4,0 mg/ml og hvor konsentrasjonen av natriumsakkarin er mellom 0,5 mM og 0,9 mM ved pirfenidonkonsentrasjoner på 16,0 mg/ml;
 - 15 hvor osmolaliteten til den vandige løsningen er fra omtrent 250 mOsmol/kg til omtrent 500 mOsmol/kg,
 - hvor løsningens pH er omtrent 4,0 til omtrent 7,0.
2. Vandig løsning for bruk ifølge krav 1, hvor den forstøvede administreringen leverer pirfenidon
20 med en total pirfenidonutmatingshastighet på minst 0,1 mL/min.
3. Vandig løsning for bruk ifølge krav 1 eller krav 2, hvor: natriumkloridkonsentrasjonen er omtrent 150 mM, hvor "omtrent" angir +/-10% av verdien.
- 25 4. Vandig løsning for bruk ifølge et hvilket som helst av kravene 1-3, hvor sitratbufferen har en konsentrasjon på opptil omtrent 50 mM, hvor "omtrent" angir +/-10% av verdien.
5. Vandig løsning for bruk ifølge krav 4, hvor sitratbufferen har en konsentrasjon på omtrent 5 mM, hvor "omtrent" angir +/-10% av verdien.
30
6. Vandig løsning for bruk ifølge et hvilket som helst av kravene 1-5, hvor pH-verdien er omtrent 5,5.

7. Vandig løsning for bruk ifølge et hvilket som helst av kravene 1-6, hvor den vandige løsningen er en enhetsdose og hvor forstøveren er en forstøver med vibrerende nett.

8. Vandig løsning for bruk ifølge krav 7, hvor væskeforstøveren:

- 5 (i) etter administrering av den inhalerte dosen, oppnår en avsetning i lungene på minst 7% av pirfenidonet som administreres til pattedyret;
- (ii) gir et geometrisk standardavvik (GSD) av avgitt dråpestørrelsesfordeling av den vandige løsningen på omtrent 1,0 til omtrent 2,5;
- (iii) tilveiebringer dråper av den vandige løsningen avgitt med den høyeffektive
- 10 væskeforstøveren med: a) en massemedian aerodynamisk diameter (MMAD) på omtrent 1 μm til omtrent 5 μm ; og/eller b) en volumetrisk midlere diameter (VMD) på omtrent 1 μm til omtrent 5 μm ;
- (iv) tilveiebringer en finpartikkelfraksjon (FPF) av dråper avgitt fra væskeforstøveren på minst omtrent 30%, hvor FPF-fraksjonen representerer prosentandelen av den leverte
- 15 aerosoldosen med dråper mindre enn 5 μm ; og/eller
- (v) gir minst omtrent 25% av den vandige løsningen til et pattedyr.