



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3681475 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

A61K 9/00 (2006.01) A61K 31/58 (2006.01) A61P 11/02 (2006.01)

A61K 9/08 (2006.01) A61K 47/38 (2006.01) A61P 11/06 (2006.01)

A61K 31/454 (2006.01) A61K 47/40 (2006.01) A61P 37/08 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

- (45) Translation Published 2021.05.03
- (80) Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent 2020.12.09
- (86) European Application Nr. 18786334.5
- (86) European Filing Date 2018.10.15
- (87) The European Application's Publication Date 2020.07.22
- (30) Priority 2017.10.16, EP, 17382686
- (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
- Designated Validation States: KH ; MA ; MD ; TN
- (73) Proprietor FAES FARMA, S.A., Autonomía, 10, 48940 Leioa - Vizcaya, Spania
- (72) Inventor HERNÁNDEZ HERRERO, Gonzalo, FAES FARMA S.A. Autonomía 10, 48940 Leioa Vizcaya, Spania
GONZALO GOROSTIZA, Ana, FAES FARMA S.A. Autonomía 10, 48940 Leioa Vizcaya, Spania
GARCÍA DOMÍNGUEZ, Neftalí, FAES FARMA S.A. Autonomía 10, 48940 Leioa Vizcaya, Spania
ZAZPE ARCE, Arturo, FAES FARMA S.A. Autonomía 10, 48940 Leioa Vizcaya, Spania
MORÁN POLADURA, Pablo, FAES FARMA S.A. Autonomía 10, 48940 Leioa Vizcaya, Spania
GONZÁLEZ GARCÍA, Tania, FAES FARMA S.A. Autonomía 10, 48940 Leioa Vizcaya, Spania
- (74) Agent or Attorney ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54) Title **AQUEOUS COMPOSITIONS COMPRISING BILASTINE AND MOMETASONE**

(56) References

Cited: EP-A1- 1 894 559, EP-A1- 3 040 334, EP-A1- 3 170 816, US-A1- 2007 082 870
CN-A- 103 784 462, KR-A- 20130 030 606, US-A1- 2006 045 850, CN-A- 103 736 098

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/>

EP3681475

1

Patentkrav

1. Vandig farmasøytisk sammensetning omfattende:

- 5 a) bilastin eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav,
b) mometason eller et farmasøytisk akseptabelt derivat derav valgt fra et ester-, eter- og ketonidderivat,
c) et suspensjonsmiddel,
d) 2-hydroksypropyl- β -syklodekstrin;

10 hvori pH-en i den vandige farmasøytiske sammensetningen er mellom 3,5 og 5,5, og hvori innholdet av 2-hydroksypropyl-P-syklodekstrin er mindre enn 8,5 vekt-%.

15 2. Den vandige farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1, hvori innholdet av bilastin eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav er omfattet mellom 0,2 vekt-% og 0,8 vekt-%.

3. Den vandige farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 eller 2, hvori bestanddelen b) er mometasonfuroat.

20 4. Den vandige farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvori innholdet av 2-hydroksypropyl- β -syklodekstrin er mindre enn 5 vekt-%.

25 5. Den vandige farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, hvori innholdet av 2-hydroksypropyl- β -syklodekstrin er omfattet mellom 1 og 5 vekt-%.

30 6. Den vandige farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5, hvori pH-en i den vandige farmasøytiske sammensetningen er mellom 4,0 og 5,0, foretrukket mellom 4,3 og 4,9.

35 7. Den vandige farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6, hvori suspensjonsmidlet er valgt fra cellulose og/eller cellulosederivater valgt fra celluloseeterderivater, hvori hydroksylgruppene av cellulose har vært

EP3681475

2

delvis eller fullstendig substituert for å tilveiebringe celluloseetere.

5 **8.** Fremgangsmåte for fremstilling av en vandig farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7, omfattende:

a) å fremstille en vandig løsning av 2-hydroksypropyl- β -syklodekstrin, hvori innholdet av 2-hydroksypropyl- β -syklodekstrin er mindre enn 8,5 vekt-%,

10 b) å tilsette bilastin eller et farmasøytisk akseptabelt salt eller solvat derav til den vandige løsningen i trinn a), og å tilsette et buffermiddel for å oppnå en vandig løsning av bilastin som har en pH på mellom 3,5 og 5,5,

15 c) å fremstille en dispersjon av mometason eller et farmasøytisk akseptabelt derivat derav valgt fra et ester-, eter- og ketonidderivat med en surfaktant i rensset vann,

d) å fremstille en vandig suspensjon av et suspensjonsmiddel,

20 e) å tilsette den vandige løsningen i trinn b) til den vandige suspensjonen i trinn d), og etterfølgende å tilsette dispersjonen av mometason fra trinn c), og å homogenisere blandingen under omrøring, eventuelt å tilsette en buffer for å nå en pH på mellom 3,5 og 5,5.

25 **9.** Fremgangsmåten ifølge krav 8, ytterligere omfattende å tilsette et buffermiddel i den vandige løsningen i trinn a) og/eller i trinn b).

10. Fremgangsmåten ifølge krav 8, hvori den vandige løsningen av 2-hydroksypropyl- β -syklodekstrin er en vandig løsning, hvori innholdet av 2-hydroksypropyl- β -syklodekstrin er mindre enn 5 vekt-%.

30 **11.** Vandig farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7, for anvendelse som et medikament.

35 **12.** Vandig farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7, for anvendelse i behandlingen og/eller forebyggingen av en allergisk lidelse eller sykdom valgt fra rhinitt, konjunktivitt og rhinokonjunktivitt.

EP3681475

3

5 **13.** Vandig farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7, for anvendelse i behandlingen og/eller forebyggingen av astma, allergisk og ikke-allergisk rhinitt, ikke-ondartede proliferative og inflammatoriske sykdommer.

10 **14.** Den vandige farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 11 til 13, hvori den vandige farmasøytiske sammensetningen administreres intranasalt.

15. Nesesprayinnretning omfattende den vandige farmasøytiske sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7.