



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3785702 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/14 (2006.01)
A61K 31/495 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2022.11.21
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2022.07.20
(86)	European Application Nr.	20161476.5
(86)	European Filing Date	2020.03.06
(87)	The European Application's Publication Date	2021.03.03
(30)	Priority	2019.08.28, EP, 19183309
(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	Alfred E. Tiefenbacher (GmbH & Co. KG), Van-der-Smissen-Strasse 1, 22767 Hamburg, Tyskland
(72)	Inventor	Ogibalov, Ivan, TBD-Biodiscovery Tiigi 61b, 50410 Tartu, Estland Uustare, Ain, TBD-Biodiscovery Tiigi 61b, 50410 Tartu, Estland Fitzner, Ansgar, Unnastraße 21, 20253 Hamburg, Tyskland
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54)	Title	MICROPARTICULATE VARENICLINE CITRATE
------	-------	---

(56)	References	
	Cited:	EP-A1- 3 400 964 WO-A1-02/092597

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/>

EP3785702

1

Patentkrav

- 5 **1.** Mikropartikulært vareniklinsitrat som har et XRPD-diffraksjonsmønster med
topper ved 9,8°, 12,8°, 13,2°, 14,6°, 19,4°, 19,6°, 20,0°, 20,5° og 26,1° ±
0,2° (2θ), og **karakterisert ved** en Dv(50)-verdi på under 50 µm målt ved
laserdiffraksjon.
- 10 **2.** Mikropartikulært vareniklinsitrat ifølge krav 1 som har en Dv(10)-verdi på
mindre enn 20 µm og/eller en Dv(90)-verdi på mindre enn 100 µm.
- 3.** Mikropartikulært vareniklinsitrat ifølge krav 1 som har en Dv(50)-verdi på
under 25 µm.
- 15 **4.** Mikropartikulært vareniklinsitrat ifølge krav 1-3 som har en Dv(10)-verdi på
mindre enn 7 µm og/eller en Dv(90)-verdi på mindre enn 60 µm.
- 5.** Mikropartikulært vareniklinsitrat ifølge kravene 1-4 som har et XRPD-mønster
som vist i fig. 1.
- 20 **6.** Mikropartikulært vareniklinsitrat ifølge kravene 1-5 som har et vanninnhold på
1,5 vekt-% til 5,0 vekt-%, foretrukket på 2,0 vekt-% til 4,0 vekt-%, mest
foretrukket mellom 2,5 vekt-% og 3,8 vekt-%.
- 25 **7.** Mikropartikulært vareniklinsitrat ifølge kravene 1-6 for å redusere følelsene av
sug og abstinens forårsaket av røykeslutt.
- 8.** Fremgangsmåte for fremstillingen av det mikropartikulære vareniklinsitratet
ifølge kravene 1-6, omfattende tilsetningen av en løsning av vareniklin til en
løsning av sitronsyre.
- 30 **9.** Fremgangsmåte for fremstillingen av mikropartikulært vareniklinsitrat ifølge
krav 8, hvori løsemidlet som anvendes i fremstillingen av vareniklinløsningen
og/eller sitronsyreløsningen, omfatter isopropanol og vann.

EP3785702

2

10. Fremgangsmåte for fremstillingen av mikropartikulært vareniklinsitrat ifølge krav 9, hvori isopropanolen og vannet anvendes i et forhold på 50:50-80:20; foretrukket isopropanol og vann anvendes i forholdet 80:20.

5 **11.** Fremgangsmåte for fremstillingen av mikropartikulært vareniklinsitrat ifølge krav 8, omfattende tørking av den oppnådde utfellingen ved en temperatur på 40-50 °C og/eller under redusert trykk på mindre enn 20 000 Pa (150 Torr).

10 **12.** Farmasøytisk sammensetning omfattende mikropartikulært vareniklinsitrat ifølge kravene 1-7.