

(19)



SUOMI - FINLAND  
(FI)

PATENTTI- JA REKISTERIHALLITUS  
PATENT- OCH REGISTERSTYRELSEN  
FINNISH PATENT AND REGISTRATION OFFICE

- (10) **FI/EP4110292 T3**
- (12) **EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS  
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT  
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION**
- (45) Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning - **01.03.2024**  
Translation available to the public
- (97) Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för **10.01.2024**  
det europeiska patentet - Date of grant of European patent
- (51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -  
International patent classification  
**A61K 9/10** ( 2006 . 01 )  
**A61P 11/00** ( 2006 . 01 )  
**A61K 31/40** ( 2006 . 01 )  
**A61K 31/519** ( 2006 . 01 )  
**A61K 47/14** ( 2017 . 01 )
- (96) Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan - **EP21709782.3**  
European patent application
- (22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date **26.02.2021**
- (97) Patenttihakemuksen julkiseksitilopäivä - Patentansökans **04.01.2023**  
publiceringsdag - Patent application available to the public
- (86) Kansainvälinen hakemus - Internationell **26.02.2021 PCT/GB2021050496**  
ansökan - International application
- (30) Etuoikeus - Prioritet - Priority  
27.02.2020 GB GB202002786

(73) Haltija - Innehavare - Holder

**1• Verona Pharma PLC**, One Central Square, Cardiff CF10 1FS, (GB)

(72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor

**1• SPARGO, Peter Lionel**, Nash House, Beech Drive Harbledown Park Harbledown, Canterbury Kent CT2 8NR, (GB)

**2• HAYWOOD, Phillip Andrew**, Goldings Silver Street Anstey Buntingford, Hertfordshire SG9 0DH, (GB)

**3• FRENCH, Edward James**, 28 Norman Road, Canterbury Kent CT1 3LX, (GB)

(74) Asiamies - Ombud - Agent

**Zacco Sweden AB**, P.O. Box 5581 Löjtnantsgatan 21, 114 85 Stockholm, (SE)

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

**Nestemäinen farmaseuttinen koostumus, joka käsittää ensifentriiniä ja glykopyrrolaattia**

**LIQUID PHARMACEUTICAL COMPOSITION COMPRISING ENSIFENTRINE AND GLYCOPYRROLATE**

PATENTTIVAATIMUKSET

1. Nestemäinen farmaseuttinen koostumus, joka sopii annettavaksi inhaloimalla ja joka käsittää:
- (i) ensifentriinipartikkeleita;
  - 5 (ii) glykopyrrolaattia; ja
  - (iii) laimenninta, joka laimennin käsittää vettä, jolloin:  
ensifentriinipartikkelien pitoisuus on 0,1–5,0 mg/ml;  
glykopyrrolaatti on liuennut laimentimeen;
  - 10 glykopyrrolaatin pitoisuus on enintään 5,0 mg/ml; ja  
farmaseuttisen nestekoostumuksen pH on 3,0–6,0.
2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen nestemäinen farmaseuttinen koostumus, jolloin farmaseuttisen nestekoostumuksen pH on 3,5–5,0.
3. Patenttivaatimuksen 1 tai patenttivaatimuksen 2 mukainen nestemäinen  
15 farmaseuttinen koostumus, jolloin nestemäinen farmaseuttinen koostumus käsittää lisäksi puskuria, jolloin puskuri on edullisesti sitraattipuskuri, jolloin puskurin pitoisuus on valinnaisesti 10,0–40,0 mg/ml, edullisesti 20,0–30,0 mg/ml.
4. Jonkin edeltävän patenttivaatimuksen mukainen nestemäinen  
20 farmaseuttinen koostumus, jolloin  
glykopyrrolaatin pitoisuus on 0,01–2,0 mg/ml, edullisesti 0,02–0,25 mg/ml; ja/tai  
ensifentriini:glykopyrrolaatti-painosuhte nestemäisessä farmaseuttisessa koostumuksessa on 1:5–200:1, edullisesti 15:1–120:1; ja/tai  
ensifentriinipartikkelien pitoisuus on 0,15–2,5 mg/ml; ja/tai  
25 ensifentriinipartikkelien Dv50 on 0,5–5,0 µm.

**5.** Jonkin edeltävän patenttivaatimuksen mukainen nestemäinen farmaseuttinen koostumus, jolloin glykopyrrolaatti on glykopyrrooniumin farmaseuttisesti hyväksyttävä suola,

jolloin glykopyrrolaatti on edullisesti glykopyrrooniumbromidi tai  
5 glykopyrrooniumkloridi,

jolloin glykopyrrolaatti on edullisemmin glykopyrrooniumbromidi.

**6.** Jonkin edeltävän patenttivaatimuksen mukainen nestemäinen farmaseuttinen koostumus, jolloin:

laimennin on vesi, ja nestemäinen farmaseuttinen koostumus käsittää vähintään 80  
10 painoprosenttia laimenninta perustuen nestemäisen farmaseuttisen koostumuksen kokonaispainoon; ja/tai

nestemäinen farmaseuttinen koostumus käsittää lisäksi toonisuuden säätöainetta, jolloin toonisuuden säätöaine on edullisesti natriumkloridi,

jolloin toonisuuden säätöaineen pitoisuus on valinnaisesti vähintään 1,0 mg/ml,  
15 edullisesti 4,0–20,0 mg/ml, edullisemmin 6,0–12,0 mg/ml.

**7.** Jonkin edeltävän patenttivaatimuksen mukainen nestemäinen farmaseuttinen koostumus, jolloin nestemäinen farmaseuttinen koostumus käsittää lisäksi yhtä tai useampaa pinta-aktiivista ainetta, jolloin tämä yksi tai useampi pinta-aktiivinen aine valitaan edullisesti polysorbaatista ja sorbitaanialkyyliesteristä,

20 jolloin tämän yhden tai useamman pinta-aktiivisen aineen pitoisuus on valinnaisesti 0,01–2,0 mg/ml, edullisesti 0,1–1,0 mg/ml.

**8.** Jonkin edeltävän patenttivaatimuksen mukainen nestemäinen farmaseuttinen koostumus, jolloin nestemäinen farmaseuttinen koostumus käsittää:

(i) ensifentriinipartikkeleita;

25 (ii) glykopyrrolaattia;

(iii) laimenninta;

(iv) pinta-aktiivista polysorbaattia;

(v) valinnaisesti pinta-aktiivista sorbitaanialkyyliesteriä;

(vi) sitraattipuskuria; ja

(vii) natriumkloridia.

**9.** Jonkin edeltävän patenttivaatimuksen mukainen nestemäinen farmaseuttinen koostumus, jolloin nestemäinen farmaseuttinen koostumus käsittää:

5 (i) 0,1–2,5 mg/ml ensifentriinipartikkeleita, valinnaisesti 0,5–2,5 mg/ml ensifentriinipartikkeleita;

(ii) 0,01–2,0 mg/ml glykopyrroniumbromidia;

(iii) vettä;

(iv) 0,1–1,0 mg/ml polysorbaatti 20:tä;

10 (v) valinnaisesti 0,01–0,1 mg/ml sorbitaanimonolauraattia;

(vi) 5,0–15,0 mg/ml sitruunahappoa;

(vii) 10,0–20,0 mg/ml trinatriumsitraattia; ja

(viii) 5,0–15,0 mg/ml natriumkloridia.

**10.** Jonkin edeltävän patenttivaatimuksen mukainen nestemäinen  
15 farmaseuttinen koostumus, joka nestemäinen farmaseuttinen koostumus on stabiili vähintään 1 kuukauden ajan ensifentriinin ja glykopyrrolaatin kemiallisen hajoamisen suhteen säilytettynä 25 °C:n lämpötilassa ja 60 %:n suhteellisessa kosteudessa.

**11.** Jonkin edeltävän patenttivaatimuksen mukainen nestemäinen  
20 farmaseuttinen koostumus, joka nestemäinen farmaseuttinen koostumus sopii annettavaksi sumuttimen avulla.

**12.** Sumutin, joka käsittää jonkin edeltävän patenttivaatimuksen mukaista farmaseuttista nestekoostumusta.

**13.** Jonkin patenttivaatimuksen 1–11 mukainen nestemäinen farmaseuttinen  
25 koostumus käytettäväksi ihmis- tai eläinkehon hoidossa.

**14.** Jonkin patenttivaatimuksen 1–11 mukainen nestemäinen farmaseuttinen koostumus käytettäväksi seuraavista valitun sairauden tai tilan hoidossa tai ehkäisyssä: keuhkohtaumatauti (COPD), astma, allerginen astma, heinänuha,

allerginen nuha, bronkiitti, emfyseema, keuhkoputken laajentuma, aikuisen hengitysvaikeusoireyhtymä (ARDS), steroidiresistentti astma, vaikea astma, pediatriinen astma, kystinen fibroosi, keuhkofibroosi, keuhkojen fibroosi, interstitiaali keuhkosairaus, ihohäiriö, atooppinen ihottuma, psoriaasi, silmätulehdus, aivoiskemia, tulehdussairaus ja autoimmuunisairaus.

**15.** Nestemäinen farmaseuttinen koostumus käytettäväksi patenttivaatimuksen 14 mukaisesti, jolloin sairaus tai tila on keuhkohtaumatauti (COPD).