



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2373305 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 47/10 (2017.01)
A61K 31/138 (2006.01)
A61K 31/4535 (2006.01)
A61K 47/12 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2017.06.26
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2017.03.15
(86)	European Application Nr.	09764869.5
(86)	European Filing Date	2009.12.09
(87)	The European Application's Publication Date	2011.10.12
(30)	Priority	2008.12.11, EP, 08305924 2008.12.11, US, 121848 P
(84)	Designated Contracting States:	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 SE SI SK SM TR
(73)	Proprietor	Besins Healthcare Luxembourg SARL, 2-8 rue Julien Vesque, 2668 Luxembourg, LU-Luxembourg
(72)	Inventor	MASINI-ETEEVE, Valérie, 4 rue Pierre Loti, F-92340 Bourg La Reine, FR-Frankrike
(74)	Agent or Attorney	Zacco Denmark A/S, Arne Jacobsens Allé 15, DK-2300 KØBENHAVN S, Danmark

(54)	Title	TRANSDERMAL PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS COMPRISING A SERM
------	-------	--

(56)	References Cited:	EP-A- 0 792 640 WO-A-00/35485 WO-A-93/19746 WO-A-97/35571 WO-A-97/46233 WO-A-2007/103294 WO-A-2008/039864 WO-A-2008/070463 WO-A1-99/24041 US-A- 5 904 930 US-A1- 2004 175 416 US-A1- 2008 220 068 YOUNG CHAI LIM ET AL: "Endoxifen (4-hydroxy-N-desmethyl-tamoxifen) has anti-estrogenic effects in breast cancer cells with potency similar to 4-hydroxy-tamoxifen" CANCER CHEMOTHERAPY AND PHARMACOLOGY, SPRINGER, BERLIN, DE, vol. 55, no. 5, 1 May 2005 (2005-05-01), pages 471-478, XP019334143 ISSN: 1432-0843 LEE K-H ET AL: "Quantification of tamoxifen and three metabolites in plasma by high-performance liquid chromatography with fluorescence detection: application to a clinical trial" JOURNAL OF CHROMATOGRAPHY B: BIOMEDICAL SCIENCES & APPLICATIONS, ELSEVIER, AMSTERDAM, NL, vol. 791, no. 1-2, 5 July 2003 (2003-07-05), pages 245-253, XP004428049 ISSN: 1570-0232 MICHAEL D JOHNSON ET AL: "Pharmacological Characterization of 4-hydroxy-N-desmethyl
------	----------------------	--

Tamoxifen, a Novel Active Metabolite of Tamoxifen" BREAST CANCER RESEARCH AND TREATMENT, KLUWER ACADEMIC PUBLISHERS, BO, vol. 85, no. 2, 1 May 2004 (2004-05-01), pages 151-159, XP019274612 ISSN: 1573-7217

UZUKA M ET AL: "The mechanism of estrogen-induced increase in hyaluronic acid biosynthesis, with special reference to estrogen receptor in the mouse skin" BIOCHIMICA ET BIOPHYSICA ACTA - GENERAL SUBJECTS, ELSEVIER SCIENCE PUBLISHERS, NL, vol. 627, no. 2, 17 January 1980 (1980-01-17), pages 199-206, XP025787280 ISSN: 0304-4165 [retrieved on 1980-01-17]

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. Transdermal farmasøytisk sammensetning for transdermal administrering på en hudoverflate, hvori sammensetningen omfatter:

(i) 0,01 til 10 % (vekt/vekt), foretrukket 2 til 5 % (vekt/vekt) endoksifen eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav,

(ii) 60 til 80 % (vekt/vekt) av minst én av monoalkohol, hvori den minst ene monoalkoholen er valgt fra C₂-C₄-monoalkoholer, foretrukket, etanol eller isopropanol,

(iii) 0,1 til 10 % (vekt/vekt) av minst én penetreringsforsterker, hvori den minst ene penetreringsforsterkeren er oleinsyre, og med det forbehold at isopropylmyristat er utelukket,

(iv) 0 til 5 % (vekt/vekt) av minst ett gelatineringsmiddel, foretrukket polyakrylsyrer, cellulosestoffer og blandinger derav,

(v) 0,01 til 30 % (vekt/vekt) av minst ett fuktighetsgivende middel, foretrukket glyserin,

(vi) q.s. 100 % (vekt/vekt) vann.

2. Transdermal farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, hvori den minst ene penetreringsforsterkeren er en blanding av oleinsyre og propylenglykol.

3. Transdermal farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1 for anvendelse i en fremgangsmåte for å administrere en terapeutisk effektiv mengde endoksifen eller det farmasøytisk akseptable saltet derav til en pasient med behov for dette, omfattende transdermal administrering av sammensetningen til en hudoverflate til pasienten.

4. Transdermal farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 3, hvori pasienten lider av en brystlidelse.

5. Transdermal farmasøytisk sammensetning ifølge krav 3, hvori pasienten lider av østrogenubalanse.

6. Transdermal farmasøytisk sammensetning ifølge krav 5, hvori østrogenubalansen er en brystlidelse valgt fra godartede brystsykdommer, gynekomasti, brystkreft, mastalgi og tilstander som innebærer tett brystvev.

7. Dosepakning, enhetsdosepakning eller flerdosepakning inneholdende en transdermal farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1.

5 **8.** Dispenser, eventuelt med håndpumpe, inneholdende en transdermal farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1.

9. Fremgangsmåte for fremstilling av en transdermal farmasøytisk sammensetning ifølge krav 1, omfattende trinnene med å fremstille en blanding omfattende:

- 10 (i) minst én monoalkohol valgt fra C₂-C₄-monoalkoholer,
(ii) endoksifen eller de farmasøytisk akseptable saltene derav,
(iii) et vandig vehikkel,
(iv) minst én penetreringsforsterker, hvori
den minst ene penetreringsforsterkeren er oleinsyre, og med det forbehold at
15 isopropylmyristat er utelukket,
(v) eventuelt minst ett gelatineringsmiddel,
(vi) minst ett fuktighetsgivende middel.