



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2506830 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/00 (2006.01)
A61K 9/107 (2006.01)
A61K 47/02 (2006.01)
A61K 47/24 (2006.01)
A61K 47/36 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2017.01.02
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2016.08.24
(86)	European Application Nr.	10785299.8
(86)	European Filing Date	2010.12.02
(87)	The European Application's Publication Date	2012.10.10
(30)	Priority	2009.12.03, US, 266207 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	NOVARTIS AG, Lichtstrasse 35, 4056 Basel, CH-Sveits
(72)	Inventor	KETELSON, Howard Allen, 5018 Bradford Drive, DallasTexas 75235, US-USA MEADOWS, David L., 714 Saddlebrook Drive, ColleyvilleTexas 76034, US-USA
(74)	Agent or Attorney	Zacco Norway AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

(54) Title **OPHTHALMIC EMULSION**

(56) References
Cited: WO-A1-99/06023
 GB-A- 1 593 954
 US-A- 5 278 151
 US-A- 5 578 586
 US-A1- 2009 270 345

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.** Oftalmisk emulsjon, der emulsjonen omfatter:

vann som danner en vandig fase;

5 olje som danner en oljefase;

en hydrofil surfaktant som har en HLB-verdi på minst 8;

en hydrofob surfaktant som har en HLB-verdi på under 8;

en ladet fosfolipid;

borat; og

10 en mukoadhesiv galaktomannanpolymer;

hvori:

i. oljefasen er i dråper innenfor den vandige fasen, og dråpene har en
gjennomsnittlig diameter som ikke er større enn omkring 1000 nm, men som er
minst 10 nm, hvori den gjennomsnittlige diameteren er tilsvarende 90 % av den
15 kumulative undermålfordelingen av volum målt ved anvendelse av en Microtrac
S3500 Partikkelanalysator (programvareversjon 10.3.1); og

ii. boratet og galaktomannanpolymeren opptrer i fellesskap for å danne en gel
ved inndrypping av emulsjonen i et individs øye.

20 **2.** Emulsjon ifølge krav 1, hvori oljen er et hydrokarbon valgt fra mineralolje,
parafinolje og petrolatum.

3. Emulsjon ifølge krav 1 eller 2, hvori oljen er minst 0,1 vekt-volum-% og ikke
mer enn 5 vekt-volum-%, foretrukket minst 0,8 vekt-volum-% og ikke mer enn
25 1,5 vekt-volum-%, av emulsjonen.

4. Emulsjon ifølge krav 1, 2 og 3, hvori den hydrofile surfaktanten finnes i
emulsjonen i en mengde som minst 0,08 vekt-volum-% og finnes i emulsjonen i
en mengde som ikke er mer enn 0,8 vekt-volum-%, foretrukket hvori den
30 hydrofile surfaktanten finnes i emulsjonen i en mengde som er minst 0,14 vekt-
volum-% og finnes i emulsjonen i en mengde som ikke er mer enn 0,44 vekt-
volum-%.

5. Emulsjon ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, hvori den
35 hydrofile surfaktanten er polyoksyetylen-40-stearat.

6. Emulsjon ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, hvori den

hydrofobe surfaktanten finnes i emulsjonen i en mengde som minst 0,11 vekt-volum-% og finnes i emulsjonen i en mengde som ikke er mer enn 2,0 vekt-volum-%, foretrukket hvori den hydrofobe surfaktanten finnes i emulsjonen i en mengde som er minst 0,16 vekt-volum-% og finnes i emulsjonen i en mengde som ikke er mer enn 0,62 vekt-volum-%.

5

7. Emulsjon ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, hvori den hydrofobe surfaktanten er en sorbitantristearat.

10

8. Emulsjon ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, hvori den mukoadhesive galaktomannanpolymeren er valgt fra gruppen bestående av guar og hydroksypropylguar.

15

9. Emulsjon ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, hvori den mukoadhesive galaktomannanpolymeren finnes i emulsjonen i en konsentrasjon på minst 0,01 vekt-volum-%, men ikke mer enn 1,0 vekt-volum-%, foretrukket minst 0,01 vekt-volum-%, men ikke mer enn 0,08 vekt-volum-%.

20

10. Emulsjon ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, hvori den ladede fosfolipiden er en anionisk fosfolipid kalt dimyristoylfosfatidylglyserol.

11. Emulsjon ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, hvori fosfolipiden finnes i emulsjonen i en konsentrasjon fra 0,05 til 7,0 vektprosent.

25

12. Emulsjon ifølge hvilket som helst av de foregående kravene ytterligere omfattende et borat/polyol-buffersystem.

13. Emulsjon ifølge hvilket som helst av de foregående kravene omfattende en polymer katernær ammoniakkforbindelse som et anti-mikrobielt konserveringsmiddel.

30

14. Emulsjon ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, hvori oljefasen er i dråper innenfor den vandige fasen, og dråpene har en gjennomsnittlig diameter som ikke er større enn 500 nm, men som er minst 100 nm, hvori den gjennomsnittlige diameteren er tilsvarende 90 % av den kumulative undermålfordelingen av volum målt ved anvendelse av en Microtrac S3500 Partikkelanalysator (programvareversjon 10.3.1).

35

15. Emulsjon ifølge hvilket som helst av kravene 1–14 for anvendelse i en fremgangsmåte, omfattende:

inndrypping av emulsjonen i et øye på et pattedyr.

5

16. Emulsjon ifølge krav 15, hvori pattedyret er et menneske, og emulsjonen inndryppes som dråper fra en øyedråpeteller.

17. Fremgangsmåte for å danne en emulsjon ifølge hvilket som helst av krav 1–14, omfattende:

10

å danne en første sammenblanding ved å blande oljen og surfaktantene ved en forhøyet temperatur for å danne en oljefasesammenblanding;

å danne en andre sammenblanding ved å blande den anionisk fosfolipiden i rensset vann ved en forhøyet temperatur for å danne en vannfasesammenblanding;

15

å blande oljefasesammenblandingen og vannfasesammenblandingen ved en forhøyet temperatur og deretter homogenisere oljefaseblandingen med vannfaseblandingen for å danne en innledende emulsjon; og

å danne en tredje sammenblanding ved å blande galaktomannanpolymeren med vann og justere pH etter behov for å danne en galaktomannanpolymerslurry; og
å blande galaktomannanpolymerslurrien med den innledende emulsjonen for å danne en polymerforsterket emulsjon; og

20

å danne en fjerde emulsjon ved å blande hvilken som helst kombinasjon av følgende for å danne en saltløsning: borat, polyol, konserveringsmiddel og hvilke som helst andre ingredienser; og

25

å blande saltløsningen med den forsterkede emulsjonen etterfulgt av tilsetning av en tilstrekkelig mengde (Q.S.) vann og pH-justering.