



(12) Translation of
european patent specification

(11) NO/EP 2667851 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/06 (2006.01)
A61K 9/00 (2006.01)
A61K 31/568 (2006.01)
A61K 31/58 (2006.01)
A61K 47/10 (2006.01)
A61P 5/26 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2016.09.21
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2016.05.18
(86)	European Application Nr.	12700406.7
(86)	European Filing Date	2012.01.18
(87)	The European Application's Publication Date	2013.12.04
(30)	Priority	2011.01.26, EP, 11152210 2011.01.26, US, 201161436207 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	Ferring BV, Polaris Avenue 144, 2132 JX Hoofddorp, NL-Nederland
(72)	Inventor	GRENIER, Arnaud, 6 rue des Bergers, F-68440 Steinbrunn le Haut, FR-Frankrike CARRARA, Dario, N., Storcheweg 3, CH-4104 Oberwil, CH-Sveits
(74)	Agent or Attorney	Oslo Patentkontor AS, Postboks 7007 Majorstua , 0306 OSLO, Norge

(54) Title **TESTOSTERONE FORMULATIONS**

(56) References
Cited: WO-A2-2004/080413

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 eller transmukosal formulering omfattende:

- 2 vekt% testosteron,
- C₂ til C₄ alkanol,
- 5 - polyalkohol, og
- monoalkyleter av dietylenglykol,

hvor nevnte formulering omfatter fettalkoholer, fettsyrer og fetttestere med en forgrenet eller lineær del med 8 eller flere karbonatomer eller med en forgrenet eller lineær alkoholenhet med 8 eller flere karbonatomer i en total mengde på
10 mindre enn 0,1 vekt%.

2. Formulering ifølge krav 1, ytterligere omfattende minst én av:

- geldannende middel,
- nøytraliseringsmiddel,
- chelaterende middel og
- 15 - oppløsningsmiddel

eller enhver kombinasjon derav.

3. Formulering ifølge krav 1 eller 2, hvor alkanolen er til stede i en mengde mellom 5 – 50 vekt%, polyalkoholen er til stede i en mengde mellom 1 – 30 vekt%, gjennomtrengningsmiddelforsterkeren er til stede i en mengde på mellom 0,2 – 25
20 vekt%, det geldannende middel er til stede i en mengde mellom 0,05 – 4 vekt%, nøytraliseringsmiddelet er til stede i en mengde mellom 0,05 – 1 vekt% og chelateringsmiddelet er til stede i en mengde mellom 0,001 – 5,0 vekt%.

4. Formulering ifølge krav 1 eller 2, hvor alkanolen er valgt fra én eller flere av gruppen bestående av etanol, isopropanol og n-propanol og er foretrukket etanol
25 som er enda mer foretrukket til stede i en mengde på 44,0 vekt%.

5. Formulering ifølge krav 1 eller 2, hvor polyalkoholen er propylenglykol som fortrinnsvis er til stede i en mengde på 20,0 vekt%.

6. Formulering ifølge krav 1 eller 2, hvor én eller begge av dietylenglykol monoetyleter og dietylenglykol monometyleter er til stede.

30 **7.** Formulering ifølge krav 1 eller 2, hvor dietylenglykol monometyleter er til stede i en mengde på 5,0 vekt%.

- 8.** Formulering ifølge krav 2, hvor det geldannende middel er karbomer, fortrinnsvis karbomer C980NF, hvilken karbomer eller karbomer C980NF er enda mer foretrukket til stede i en mengde på 1,20 vekt%.
- 9.** Formulering ifølge krav 2, hvor nøytraliseringsmiddelet er trietanolamin, som
5 fortrinnsvis er til stede i en mengde på 0,35 vekt%.
- 10.** Formulering ifølge krav 2, hvor chelateringsmiddelet er natriumdiedetat som fortrinnsvis er til stede i en mengde på 0,06 vekt%.
- 11.** Formulering ifølge krav 2, hvor oppløsningsmiddelet er vann.
- 12.** Formulering ifølge krav 1, omfattende enten: (1) 2 vekt% testosteron, 44,0
10 vekt% etanol, 20,0 vekt% propylenglykol og 5,0 vekt% dietylenglykol monoetyleter, eller (2) 2 vekt% testosteron, 44,0 vekt% etanol, 20,0 vekt% propylenglykol, 5,0 vekt% dietylenglykol monoetyleter, 1,20 vekt% karbomer, 0,35 vekt% trietanolamin, 0,06 vekt% dinatriumedetat og vann, eller (3) bestående av 2 vekt% testosteron, 44,0 vekt% etanol, 20,0 vekt% propylenglykol, 5,0 vekt%
15 dietylenglykol monoetyleter, 1,20 vekt% karbomer, 0,35 vekt% trietanolamin, 0,06 vekt% dinatriumedetat og vann.
- 13.** Formulering ifølge ethvert av kravene 1 til 12, hvor nevnte formulering er i form av en gel, lotion, krem, spray, aerosol, salve, emulsjon, suspensjon, liposomalt system, lakk, plaster, bandasje, kinntablett, sublingval tablett,
20 suppositorium, vaginal doseringsform eller okklusivt belegg, fortrinnsvis i form av en gel.
- 14.** Formulering ifølge ethvert av kravene 1 til 12, hvor nevnte formulering er tilpasset for transdermal eller transmukosal administrasjon ifølge et skjema som har en periodisitet valgt fra én gang til fem ganger daglig dosering, én gang
25 ukentlig dosering eller dosering hver 14. dag, fortrinnsvis tilpasset én gang daglig transdermal eller transmukosal administrasjon, enda mer foretrukket tilpasset for én gang daglig transdermal eller transmukosal administrasjon til magen eller overarmen hos et pattedyr som har behov for dette.
- 15.** Formulering ifølge ethvert av kravene 1 til 12 for anvendelse som et
30 medikament for transdermal administrasjon til en hud- eller mukosal membran hos et pattedyr, fortrinnsvis et hannpattedyr.

16. Formulering ifølge ethvert av kravene 1 til 12 for anvendelse ved behandling av en sykdom eller lidelse hos et pattedyr assosiert med redusert endogen testosteronproduksjon, hvor formuleringen blir administrert transdermalt til en hud- eller mukosal membran hos nevnte pattedyr og hvor nevnte pattedyr fortrinnsvis er et hannpattedyr.

17. Formulering for anvendelse til behandling av en sykdom eller lidelse ifølge krav 15 eller 16, hvor nevnte sykdom eller lidelse assosiert med redusert endogen testosteronproduksjon er hypogonadisme.

18. Formulering for anvendelse ifølge krav 15 eller 16, hvor nevnte formulering er for administrasjon i kombinasjon med en annen behandling.

19. Sett omfattende minst én beholder omfattende en formulering ifølge ethvert av kravene 1 til 12 samt instruksjoner for anvendelse derav, hvor nevnte beholder fortrinnsvis er tilpasset for utføring en på forhånd bestemt tilmålt mengde av nevnte formulering.