



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2879664 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/00 (2006.01)
A61K 31/415 (2006.01)
A61K 47/32 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.03.08
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.10.07
(86)	European Application Nr.	13766392.8
(86)	European Filing Date	2013.07.31
(87)	The European Application's Publication Date	2015.06.10
(30)	Priority	2012.07.31, US, 201213562686
(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
	Designated Extension States:	BA ; ME
(73)	Proprietor	Egis Gyógyszergyár Zrt., Keresztúri út 30-38, 1106 Budapest, Ungarn
(72)	Inventor	MIKULÁSIK, Endre, Bástya utca 23.1a, H-9900 Körmend, Ungarn SPAITS, Tamás, Képuti liget 4/8, 9900 Körmend, Ungarn SZAKÁLYNÉ SINKA, Ágota, Léka u. 13., 9700 Szombathely, Ungarn
(74)	Agent or Attorney	Budde Schou A/S, Dronningens Tværgade 30, 1302 KØBENHAVN K, Danmark

(54)	Title	TRANSDERMAL FORMULATION CONTAINING COX INHIBITORS
(56)	References Cited:	WO-A2-03/035080 WO-A2-2010/089617 WO-A1-2011/149645 US-A1- 2005 096 371

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. Gelblanding omfattende:

- en selektiv COX-2 inhibitor forbindelse,
- 5 i det minste en løselighetsforbedrer,
- i det minste ett fuktemiddel,
- i det minste ett geldannende middel,
- i det minste ett utfellingsmiddel for å oppnå en pH på 5,5 - 7,5 for det geldannende middel
svullet i vann,
- 10 i det minste ett flyktig siloksanmiddel
- i det minste ett løsningsmiddel, og
- en penetreringsforsterker,

karakterisert ved at den selektive COX-2 inhibitoren er til stede i blandingen i fast partikkelformig form og idet COX-2 inhibitoren er belagt med det flyktige siloksanmidlet, eller

- 15 **karakterisert ved at** den selektive COX-2 inhibitoren er oppløst i blandingen og idet penetreringsforsterkeren er belagt med det flyktige siloksanmidlet.

2. Farmasøytisk blanding ifølge krav 1, omfattende:

- en selektiv COX-2 inhibitor, som danner et flertall av faste partikler;
- 20 idet løsningsmidlet omfatter vann; og
- i det minste ett flyktig siloksanmiddel som belegg på den selektive COX-2 inhibitoren,
- idet de faste partiklene er dispergert i blandingen, og
- idet blandingen omfatter en suspensjon-gel.

- 25 3. Blanding ifølge krav 1, idet løselighetsforbedreren omfatter polyetylenglykol-heksadekyleter.

4. Blanding ifølge krav 1, idet polyetylenglykol-heksadekyleteren omfatter omtrent 5- 10 % av blandingen.

5. Blanding ifølge krav 2, idet løselighetsforbedreren omfatter poly(etylenglykol)-blokk-poly(propylenglykol)-blokk-poly(etylen)glykol.
6. Blanding ifølge krav 4, idet poly(etylenglykol)-blokk-poly(propylenglykol)-blokk-poly(etylen)glykolen omfatter omtrent 5-10 % av blandingen.
7. Blanding ifølge krav 2, idet løselighetsforbedreren omfatter i det minste én av polyetylenglykol heksadekyleter, poly(etylenglykol)-blokk-poly(propylenglykol)-blokk-poly(etylen)glykol, polyetylenglykol 1000, polyoksyetylen (20) sorbitan monostearat, Span 60, og Emulgator 10.
8. Blanding ifølge krav 2, idet løselighetsforbedreren omfatter et polyetylenglykolderivat som har 2 til 25 oksyetylengrupper.
9. Blandingen ifølge krav 2, idet HLB verdien av løselighetsforbedreren er mellom 14 og 20.
10. Blandingen ifølge krav 2, idet løselighetsforbedreren omfatter polyetylenglykol-heksadekyleter og polyetylenglykol 1000.
11. Blandingen ifølge krav 2, idet fuktemidlet omfatter polyetylenglykol.
12. Blandingen ifølge krav 2, idet det geldannende midlet omfatter polymerisert prop-2-en syre-ester.
13. Blandingen ifølge krav 2, idet den polymeriserte prop-2-en syreester omfatter omtrent 0,3-1 % av blandingen.

14. Blandingen ifølge krav 2, idet det flyktige siloksanmidlet omfatter i det minste én av heksametyl-disiloksan og dekametyl-syklopentasiloksan.

5 15. Blandingen ifølge krav 14, idet heksametyl-disiloksanet omfatter omtrent 8- 15 % av blandingen.

16. Blanding ifølge krav 14, idet dekametyl-syklopentasiloksanet omfatter omtrent 4-10 % av blandingen.

10 17. Blandingen ifølge krav 2, idet den selektive COX-2 inhibitoren omfatter celecoxib.

18. Blandingen ifølge krav 2, idet den selektive COX-2 inhibitoren omfatter omtrent 0,5-10 % av blandingen.

15 19. Blandingen ifølge krav 2, idet utfellingsmidlet omfatter NaOH.

20. Blandingen ifølge krav 2, idet utfellingsmidlet omfatter omtrent 0,5- 1,2 % av blandingen.

20 21. Blandingen ifølge krav 2, idet løsningsmidlet består hovedsakelig av et vannbasert løsningsmiddel.

22. Blandingen ifølge krav 2, omfattende

celecoxib i en mengde av 2 %;

mentol i en mengde av 1 %; polyetylglykol-heksadekyleter i en mengde av 5 %;

25 polyetylglykol 1000 i en mengde av 10 %;

polymerisert prop-2-en syreester i en mengde av 0,5 %;

en 10 % NaOH-løsning i en mengde av 1 %

heksametyl-disiloksan i en mengde av 5 %; dekametyl-syklopentasiloksan i en mengde av 5 %;
og
renset vann.

- 5 23. Farmasøytisk blanding ifølge krav 1, videre omfattende:
et løsningsmiddel omfattende vann; og
idet blandingen omfatter en løsningsgel.
- 10 24. Blandingen ifølge krav 23, idet løselighetsforbedreren omfatter polyetylenglykol-
heksadekyleter.
25. Blandingen ifølge krav 23, idet polyetylenglykol-heksadekyleteren omfatter omtrent 5-10
% av blandingen.
- 15 26. Blandingen ifølge krav 23 eller 24, idet løselighetsforbedreren omfatter poly(etylenglykol)-
blokk-poly(propylenglykol)-blokk-poly(etylen)glykol.
27. Blandingen ifølge krav 26, idet poly(etylenglykol)-blokk-poly(propylenglykol)-blokk-
poly(etylen)glykolen omfatter omtrent 5-10 % av blandingen.
- 20 28. Blandingen ifølge krav 23, idet løselighetsforbedreren omfatter i det minste én av
polyetylenglykol heksadekyleter, poly(etylenglykol)-blokk-poly(propylenglykol)-blokk-
poly(etylen)glykol, polyetylenglykol 1000, polyoksyetylen (20) sorbitan monostearat, Span 60,
eller Emulgator 10.
- 25 29. Blandingen ifølge krav 23, **karakterisert ved at** HLB -verdien av løselighetsforbedreren er
mellom 14 og 20.

30. Blandingen ifølge krav 23 idet løselighetsforbedreren omfatter polyetylenglykol heksadekyleter og polyetylenglykol 1000.

5 31. Blandingen ifølge krav 23, idet løselighetsforbedreren omfatter polyetylenglykol heksadekyleter, polyetylenglykol 1000, og poly(etylenglykol)-blokk-poly(propylenglykol)-blokk-poly(etylen)glykol.

32. Blandingen ifølge krav 23, idet fukte midlet omfatter polyetylenglykol.

10 33. Blandingen ifølge krav 23, idet det geldannende midlet omfatter polymerisert prop-2-en syreester.

34. Blandingen ifølge krav 23, idet den polymeriserte prop-2-en syreesteren omfatter omtrent 0,3-1 % av blandingen.

15 35. Blandingen ifølge krav 23, idet det flyktige siloksanmidlet omfatter i det minste én av heksametyl disiloksan og dekametyl-syklopentasiloksan.

20 36. Blandingen ifølge krav 34, idet heksametyl-disiloksanet omfatter omtrent 8- 15 % av blandingen.

37. Blandingen ifølge krav 34, idet dekametyl-syklopentasiloksanet omfatter omtrent 4-10 % av blandingen.

25 38. Blandingen ifølge krav 23, idet den selektive COX-2 inhibitoren omfatter celecoxib.

39. Blandingen ifølge krav 23, idet den selektive COX-2 inhibitoren omfatter omtrent 0,5-10 % av blandingen.

40. Blandingen ifølge krav 23, idet utfellingsmidlet omfatter NaOH.

5

41. Blandingen ifølge krav 23, idet utfellingsmidlet omfatter omtrent 0,5- 1,2 % av blandingen.

42. Blandingen ifølge krav 23, idet løsningsmidlet består hovedsakelig av en vannbasert løsningsmiddel.

10

43. Blandingen ifølge krav 23, omfattende

celecoxib i en mengde av 2 %;

mentol i en mengde av 0,66 %;

polyetylglykol heksadekyleter i en mengde av 7 %;

15 poly(etylglykol)-blokk-poly(propylenglykol)-blokk-poly(etylen)glykol i en mengde av 7 %;

polyetylglykol 1000 i en mengde av 10 %;

polymerisert prop-2-en syreester i en mengde av 0,5 %;

en 10 % NaOH-løsning i en mengde av 1 %;

20 heksametyldisiloksan i en mengde av 5 %; og

renset vann.