



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3235494 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/70 (2006.01)
A61K 31/445 (2006.01)
A61K 47/30 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2020.04.27
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.11.27
(86)	European Application Nr.	15870365.2
(86)	European Filing Date	2015.12.18
(87)	The European Application's Publication Date	2017.10.25
(30)	Priority	2014.12.18, KR, 20140183446
(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	Icure Pharmaceutical Inc., Sehyun Building 21st Floor 7 Saimdang-ro 1-gil Seocho- dong Seocho-gu, Seoul 06649, Sør-Korea
(72)	Inventor	CHOI, Young Kweon, 106-602 Daechi Hyundai Apt. 5 Samseong-ro 64-gil Gangnam-gu, Seoul 06191, Sør-Korea HONG, Dong Hyun, 39-6 Seonqdeok-gil Bongdong-eup, Wanju-gun Jeollabuk-do 55330, Sør-Korea KIM, Seong Soo, 107-404 (Jueun Chongsol Apt.) 32 Jinsa-gil Gongdo-eup, Anseong-si Gyeonggi-do 17564, Sør-Korea
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

(54)	Title	TRANSDERMAL PREPARATION CONTAINING DONEPEZIL AS ACTIVE INGREDIENT
------	-------	--

(56)	References Cited:	CN-A- 102 895 217 KR-A- 20130 098 902 US-A1- 2009 291 127 US-A1- 2010 178 307 KR-A- 20130 022 602 WO-A2-2009/120002 KR-A- 20120 001 844 KR-A- 20090 101 667
------	----------------------	--

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/>

EP NO.: 3235494**Patentkrav**

- 5 **1.** Transdermal sammensetning som inneholder donepezil som en aktiv ingrediens, der den transdermale sammensetningen omfatter:
- (a) et underliggende lag;
- (b) et legemiddelholdig matriselag som omfatter, basert på en totalvekt av det legemiddelholdige matriselaget,
- 10 (b-1) 15-55 vekt-% donepezil eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav,
- (b-2) 25-70 vekt-% av et EVA-basert klebemiddel,
- (b-3) 5-20 vekt-% av minst ett valgt fra gruppen bestående av et pyrrolidonderivat og et alifatisk C₈₋₁₈-derivat, og
- (b-4) 1-10 vekt-% triacetin eller et sitronsyrederivat,
- 15 (c) et polymerklebemiddelmatriselag som omfatter, basert på en totalvekt av polymerklebemiddelmatriselaget, 60 vekt-% eller mer av et akrylklebemiddel, hvori akrylklebemiddelet ikke inneholder en funksjonell gruppe; og
- (d) et frisettingslag.
- 20 **2.** Den transdermale sammensetningen ifølge krav 1, hvori den funksjonelle gruppen ikke har en hydroksylgruppe, en karboksylgruppe, en aminogruppe og en sulfonylgruppe.
- 3.** Den transdermale sammensetningen ifølge krav 1, hvori donepezilen er i en
- 25 form av en fri base, eventuelt
- hvori donepezilen er inneholdt i en mengde på 26-55 vekt-%, basert på en totalvekt av det legemiddelholdige matriselaget.
- 4.** Den transdermale sammensetningen ifølge krav 1, hvori
- 30 klebemiddelmatriselaget ytterligere omfatter et hudpermeasjonsforbedrende middel.
- 5.** Den transdermale sammensetningen ifølge krav 4, hvori det
- 35 hudpermeasjonsforbedrende midlet er minst ett materiale valgt fra gruppen bestående av et pyrrolidonderivat, et alifatisk C₈₋₁₈-derivat, et sitronsyrederivat og triacetin.

- 6.** Den transdermale sammensetningen ifølge krav 1 til 5, hvori pyrrolidonderivatet er minst ett valgt fra gruppen bestående av N-sykloheksyl-2-pyrrolidon, 1-butyl-3-dodekyl-2-pyrrolidon, 1,5-dimetyl-2-pyrrolidon, 1-etyl-2-pyrrolidon, 1-heksyl-4-metyloksykarbonyl-2-pyrrolidon, 1-heksyl-2-pyrrolidon, 1-(2-hydroksyetyl)pyrrolidon, 3-hydroksy-N-metyl-2-pyrrolidon, 1-lauryl-4-metyloksykarbonyl-2-pyrrolidon, N-metyl-2-pyrrolidon, N-kaprylyl-2-pyrrolidon og N-dodekyl-2-pyrrolidon, foretrukket hvori pyrrolidonderivatet er N-dodekyl-2-pyrrolidon.
- 7.** Den transdermale sammensetningen ifølge krav 1 eller 5, hvori det alifatiske C₈₋₁₈-derivatet er minst ett valgt fra gruppen bestående av laurylalkohol, oleylalkohol, lauryllaktat, glyserolmonolaurat, glyserolmonooleat, isopropylmyristat, sorbitanmonolaurat, sorbitanmonooleat, propylenglykolmonolaurat, propylenglykolmonooleat, oleylmakrogolglycerid, oleinsyre, lauroylmakrogolglycerid, linoleoyl makrogolglycerid, propylenglykolkaprylat/kaprat, propylenglykolmonokaprylat og sorbitanmonostearat, eventuelt hvori det alifatiske derivatet er glycerolmonooleat eller isopropylmyristat.
- 8.** Den transdermale sammensetningen ifølge krav 1 eller 5, hvori sitronsyrederivatet er minst ett valgt fra gruppen bestående av acetyltrietylcitrat, dietylcitrat, tributylcitrat, trietylcitrat og acetyltributylcitrat.
- 9.** Den transdermale sammensetningen ifølge krav 8, hvori sitronsyrederivatet er trietylcitrat.
- 10.** Den transdermale sammensetningen ifølge krav 1, hvori innholdet vinylacetat (VA) i polyetylenvinylacetat (EVA) anvendt i EVA- klebemiddelet er 4-50 vekt-%, eventuelt hvori innholdet vinylacetat (VA) i polyetylenvinylacetat (EVA) anvendt i EVA- klebemiddelet er 35-45 vekt-%.
- 11.** Den transdermale sammensetningen ifølge krav 1, hvori klebemiddelmatriselaget ikke inneholder donepezil.
- 12.** Transdermal sammensetning for anvendelse i en fremgangsmåte for administrering av donepezil i et individ, der fremgangsmåten omfatter:

(1) å feste til huden til et individ en transdermal sammensetning som omfatter donepezil som en aktiv ingrediens, hvori den transdermale sammensetningen omfatter:

(a) et underliggende lag;

5 (b) et legemiddelholdig matriselag som omfatter, basert på en totalvekt av det legemiddelholdige matriselaget,

(b-1) 15-55 vekt-% donepezil eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav,

(b-2) 25-70 vekt-% av et EVA-basert klebemiddel,

10 (b-3) 5-20 vekt-% av minst ett valgt fra gruppen bestående av et pyrrolidonderivat og et alifatisk C₈₋₁₈-derivat, og

(b-4) 1-10 vekt-% triacetin eller et sitronsyrederivat;

(c) et polymerklebemiddelmatriselag som omfatter, basert på en totalvekt av polymerklebemiddelmatriselag, 60 vekt-% eller mer av et akrylklebemiddel, hvori akrylklebemiddelet ikke inneholder en funksjonell gruppe; og

15 (d) et frisettingslag; og

(2) å holde den transdermale sammensetningen festet til huden til individet i en tid som er tilstrekkelig for å levere donepezil til individet.

20 **13.** Transdermal sammensetning for anvendelse ifølge krav 12, hvori tiden er 1 til 10 dager.

14. Sett som omfatter en transdermal sammensetning, hvori den transdermale sammensetningen omfatter:

(a) et underliggende lag;

25 (b) et legemiddelholdig matriselag som omfatter, basert på en totalvekt av det legemiddelholdige matriselaget,

(b-1) 15-55 vekt-% donepezil eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav,

(b-2) 25-70 vekt-% av et EVA-basert klebemiddel,

30 (b-3) 5-20 vekt-% av minst ett valgt fra gruppen bestående av et pyrrolidonderivat og et alifatisk C₈₋₁₈-derivat, og

(b-4) 1-10 vekt-% triacetin eller et sitronsyrederivat;

(c) et polymerklebemiddelmatriselag som omfatter, basert på en totalvekt av polymerklebemiddelmatriselag, 60 vekt-% eller mer av et akrylklebemiddel, hvori akrylklebemiddelet ikke inneholder en funksjonell gruppe; og

35 (d) et frisettingslag.