



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3273942 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/70 (2006.01)
A61K 31/593 (2006.01)
A61K 31/661 (2006.01)
A61P 17/06 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.09.20
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.06.16
(86)	European Application Nr.	16720351.2
(86)	European Filing Date	2016.03.16
(87)	The European Application's Publication Date	2018.01.31
(30)	Priority	2015.03.27, EP, 15161262 2015.07.09, EP, 15176101
(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
	Designated Validation States:	MA ; MD
(73)	Proprietor	Leo Pharma A/S, Industriparken 55, 2750 Ballerup, Danmark
(72)	Inventor	PETERSSON, Karsten, c/o LEO Pharma A/SIndustriparken 55, 2750 Ballerup, Danmark ENGELL, Karen Margrethe, c/o LEO Pharma A/SIndustriparken 55, 2750 Ballerup, Danmark JANSSON, Jörgen, c/o LEO Pharma A/SIndustriparken 55, 2750 Ballerup, Danmark NIELSEN, Kim Troensegaard, c/o LEO Pharma A/SIndustriparken 55, 2750 Ballerup, Danmark ERIKSSON, André Huss, c/o LEO Pharma A/SIndustriparken 55, 2750 Ballerup, Danmark MOORE, Anne, c/o University College CorkWestern Road, Cork, Irland VUCEN, Sonja, c/o University College CorkWestern Road, Cork, Irland O'SULLIVAN, Caroline, c/o University College CorkWestern Road, Cork, Irland CREAN, Abina, c/o University College CorkWestern Road, Cork, Irland

(74) Agent or Attorney Nordic Patent Service A/S, Bredgade 30, 1260 KØBENHAVN K, Danmark

(54) Title **MICRONEEDLE PATCH FOR DELIVERING AN ACTIVE INGREDIENT TO THE SKIN**

(56) References

Cited: WO-A2-2012/066506
 US-A1- 2015 057 505
 AU-A1- 2014 200 648
 WO-A1-00/64450
 US-A1- 2011 276 028
 US-A1- 2009 182 306

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. Mikronållappsammensetning omfattende én eller flere mikronåler hver omfattende
(a) en avsmalnet spissdel som inneholder en terapeutisk aktiv ingrediens dispergert i
5 en matriks av en biologisk nedbrytbar polymer i stand til å tilveiebringe vedvarende frigjøring av den terapeutisk aktive ingrediensen i løpet av en periode på minst to dager etter innsetting av mikronålen eller mikronålene i huden, hvori den biologisk nedbrytbare polymeren er polymelkesyre eller et esterterminert polylaktid, polyglykolsyre eller et esterterminert polyglykolid, eller polymelke-ko-glykolsyre eller en esterterminert polylaktid-
10 ko-glykolid, og
(b) en hurtigløselig mikronålbaksidelagdel som inneholder en vannløselig polymer som ligger over spissdelen,
mikronålen eller mikronålene festes til og strekker seg fra en klebende overflate på et avtagbart underlag,
15 hvori den terapeutisk aktive ingrediensen frigjøres fra mikronålene i løpet av en periode på 2–14 dager etter innsetting av mikronålen eller mikronålene i huden.
2. Lappsammensetning ifølge krav 1, omfattende 2–100 mikronåler per cm², f.eks. 5–75 mikronåler, 10–50 mikronåler, 15–30 mikronåler eller 20–25 mikronåler per cm².
20
3. Lappsammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1–2, hvori den biologisk nedbrytbare polymeren har en molekylvekt på >5000, slik som en molekylvekt på 7000–17000, 24000–38000, 38000–54000, 54000–69000 eller 76000–116000.
- 25 4. Lappsammensetning ifølge krav 2 eller 3, hvori forholdet mellom laktid og glykolid er mellom 85:15 og 50:50, slik som 85:15, 82:18, 75:25, 65:35 eller 50:50.
5. Lappsammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1–4, hvori den biologisk nedbrytbare polymermatriksen videre omfatter en antioksidant, f.eks. butylhydroksytoluen,
30 butylhydroksyanisol eller α - tokoferol, eller en blanding derav.
6. Lappsammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1–5, hvori den vannløselige polymeren er valgt fra gruppen som består av polyvinylpyrrolidon, et sukker slik som sukrose eller trehalose, dekstran, karboksymetylcellulose og natriumalginat.

7. Lappsammensetning ifølge krav 6, hvori den vannløselige polymeren er polyvinylpyrrolidon.
- 5 8. Lappsammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1–7, hvori baksidelagdelen omfatter en mykner, f.eks. glyserol, polyetylglykol, dibutylsebacat, dietylftalat, trietylglyserin eller trietylcitrat.
9. Lappsammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1–8, hvori baksidelagdelen
10 ligger over basen av spissdelen på en slik måte at hver mikronål separeres fra de andre mikronålene på lappen og danner en diskret enhet når underlaget fjernes ved påføring av lappen på huden.
10. Lappsammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1–9, hvori mikronålene er
15 enten koniske eller pyramidale således omfattende et antall langsgående rygger for å lette innsettingen av mikronålene i huden.
11. Lappsammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1–10, hvori den terapeutisk aktive ingrediensen er valgt fra gruppen som består av en vitamin D-analog, en
20 glukokortikoidreseptormodulator, ingenol eller et ingenolderivat, en kalsineurininhibitor, en JAK-inhibitor, en PDE4-inhibitor, et ikke-steroidalt anti-inflammatorisk middel, et antibiotikum, et soppdrepende middel eller en lokalbedøvelse eller blandinger derav.
12. Lappsammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1–11, omfattende én eller
25 flere mikronåler hver omfattende
- (a) en avsmalnet spissdel som inneholder én eller flere terapeutisk aktive ingredienser valgt fra gruppen som består av kalsipotriol og en betametasonester dispergert i en matriks av en biologisk nedbrytbar polymer valgt fra gruppen som består av et esterterminert polylaktid, et esterterminert polyglykolid og et esterterminert polylaktid-ko-glykolid, og
- 30 (b) en hurtigløselig mikronålbaksidelagdel som inneholder en vannløselig polymer som ligger over spissdelen,
- mikronålen eller mikronålene festes til og strekker seg fra en klebende overflate på et avtagbart underlag.

13. Lappsammensetning ifølge krav 12, hvori betametasonesteren er betametasondipropionat eller betametasonvalerat, særlig betametasondipropionat.
- 5 14. Lappsammensetning ifølge krav 12 eller 13, omfattende 0,08-30 µg kalsipotriol per cm².
15. Lappsammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 12-14 omfattende 1-60 µg av betametasondipropionat per cm².
- 10 16. Lappsammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 12-15, hvori den biologisk nedbrytbare polymeren er et esterterminert polylaktid-ko-glykolid.
- 15 17. Lappsammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 12-16, hvori den biologisk nedbrytbare polymeren har en molekylvekt på >5000, slik som en molekylvekt på 7000-17000, 24000-38000, 38000-54000, 54000-69000 eller 76000-116000.
18. Lappsammensetning ifølge krav 16 eller 17, hvori forholdet mellom laktid og glykolid er mellom 85:15 og 50:50, slik som 85:15, 82:18, 75:25, 65:35 eller 50:50.
- 20 19. Lappsammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 12-18, hvori baksidelaget omfatter kalsipotriol og/eller en betametasonester dispergert i matriksen til den vannløselige polymeren.
- 25 20. Lappsammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 12-19, hvori den vannløselige polymeren er polyvinylpyrrolidon.
21. Mikronållappsammensetning for anvendelse ved behandling av en hudtilstand, sammensetningen omfattende én eller flere mikronåler hver omfattende
- 30 (a) en avsmalnet spissdel som inneholder en terapeutisk aktiv ingrediens dispergert i en matriks av en biologisk nedbrytbar polymer i stand til å tilveiebringe vedvarende frigjøring av den terapeutisk aktive ingrediensen i løpet av en periode på minst to dager etter innsetting av mikronålen eller mikronålene i huden, hvori den biologisk nedbrytbare polymeren er polymelkesyre eller et esterterminert polylaktid, polyglykolsyre eller et esterterminert polyglykolid, eller polymelke-ko-glykolsyre eller en esterterminert polylaktid-

ko-glykolid, og

(b) en hurtigløselig mikronålbaksidelagdel som inneholder en vannløselig polymer som ligger over spissdelen,

mikronålen eller mikronålene festes til og strekker seg fra en klebende overflate på et

5 avtagbart underlag

hvor den terapeutisk aktive ingrediensen frigjøres fra mikronålene i løpet av en periode på 2–14 dager etter innsetting av mikronålen eller mikronålene i huden.

22. Lappsammensetning for anvendelse ifølge krav 21, hvor den biologisk nedbrytbare
10 polymeren har en molekylvekt på >5000, slik som en molekylvekt på 7000–17000, 24000–38000, 38000–54000, 54000–69000 eller 76000–116000.

23. Lappsammensetning for anvendelse ifølge krav 21 eller 22, hvor forholdet mellom
laktid og glykolid er mellom 85:15 og 50:50, slik som 85:15, 82:18, 75:25, 65:35 eller 50:50.
15

24. Lappsammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 21–23, hvor den vannløselige polymeren er valgt fra gruppen som består av polyvinylpyrrolidon, et sukker slik som sukrose eller trehalose, dekstran, karboksymetylcellulose og natriumalginat.

20 25. Lappsammensetning for anvendelse ifølge krav 24, hvor den vannløselige polymeren er polyvinylpyrrolidon.

26. Lappsammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 21–25, hvor den terapeutisk aktive ingrediensen er valgt fra gruppen som består av en vitamin D-analog, en glukokortikoidreseptormodulator, ingenol eller et ingenolderivat, en
25 kalsineurininhibitor, en JAK-inhibitor, en PDE4-inhibitor, et ikke-steroidalt anti-inflammatorisk middel, et antibiotikum, et soppdrepende middel eller en lokalbedøvelse eller blandinger derav.

30 27. Lappsammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 21–26, hvor hudtilstanden er psoriasis, aktinisk keratose, plateepitelkarsinom, basalcellekarsinom, kontaktdermatitt, atopisk dermatitt, eksem, håndeksem, vorter, kjønnsvorter, alopecia, akne, rosacea eller hudinfeksjoner.