



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 3297605 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

*A61K 9/00 (2006.01)*

*A61P 17/00 (2006.01)*

*A61P 29/00 (2006.01)*

*A61K 9/107 (2006.01)*

*A61P 17/06 (2006.01)*

*A61P 31/10 (2006.01)*

*A61K 9/113 (2006.01)*

*A61P 17/08 (2006.01)*

*A61P 37/08 (2006.01)*

*A61K 31/05 (2006.01)*

*A61P 17/10 (2006.01)*

Norwegian Industrial Property Office

---

|      |                                                                      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |
|------|----------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| (45) | Translation Published                                                | 2022.07.18                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |
| (80) | Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent | 2022.05.04                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |
| (86) | European Application Nr.                                             | 16725243.6                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |
| (86) | European Filing Date                                                 | 2016.05.19                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |
| (87) | The European Application's Publication Date                          | 2018.03.28                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |
| (30) | Priority                                                             | 2015.05.21, US, 201562165097 P<br>2016.04.19, US, 201662324450 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                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |
|      | Designated Extension States:                                         | BA; ME                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |
|      | Designated Validation States:                                        | MA                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |
| (73) | Proprietor                                                           | Dermavant Sciences GmbH, Viaduktstrasse 8, 4051 Basel, Sveits                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          |
| (72) | Inventor                                                             | BEDARD, Mary, 20 T. W. Alexander Drive Research Triangle Park, North Carolina 27709, USA<br>DOHERTY, Michael Quinn, 2206 Rhonda Road, Hillsborough, North Carolina 27278, USA<br>LENN, Jon D., 4222 Emperor Boulevard Suite 320, Durham, North Carolina 27703, USA<br>SANTOS, Leandro L., 20 T. W. Alexander Drive Research Triangle Park, North Carolina 27709, USA<br>SONTI, Sujatha D., 20 T. W. Alexander Drive Research Triangle Park, North Carolina 27709, USA<br>THOMAS, Joey Roger, 5 Moore Drive Research Triangle Park, North Carolina 27709-3398, USA<br>WHITEMAN, Justin E., 801 Capitola Drive Suite 3, Durham, North Carolina 27713, USA<br>JAIN, Piyush, 604 Kent Court, Chester Springs PA 19425, USA |
| (74) | Agent or Attorney                                                    | BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |

---

(54) Title **TOPICAL PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS**

(56) References  
Cited: US-A1-2008 206 155, WO-A2-01/42231, US-A1-2010 221 194, US-A1-2005 059 733

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. Topisk farmasøytisk emulsjonssammensetning omfattende:  
3,5-dihydroksy-4-isopropyl-trans-stilben eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav,  
en oljefase i en mengde på ca. 5 til ca. 35 vekt-%, basert på totalvekten av  
5 sammensetningen,  
en vannfase,  
et overflateaktivt middel i en mengde på ca. 1 til ca. 20 vekt-%, basert på totalvekten av  
sammensetningen, og  
en antioksidant;  
10 hvori emulsjonssammensetningen er homogen,  
og hvori oljefasen er i det vesentlige fri for petrolatum.
2. Den topiske farmasøytiske emulsjonssammensetningen ifølge krav 1, hvori  
sammensetningen eventuelt omfatter én eller flere ytterligere dermatologisk akseptable  
15 eksipienser valgt fra et pH-justerende middel, et chelateringsmiddel, et konserveringsmiddel, et  
ko-løsningsmiddel, en penetrasjonsforsterker, et fuktighetsbevarende middel, et  
fortykningsmiddel eller geleringsmiddel eller viskositetsbyggende middel, en duft, et fargestoff  
og blandinger derav.
- 20 3. Den topiske farmasøytiske emulsjonssammensetningen ifølge krav 2, hvori det pH-  
justerende midlet er valgt fra gruppen som består av melkesyre, eddiksyre, maleinsyre, ravsyre,  
sitronsyre, benzosyre, borsyre, sorbinsyre, vinsyre, edetinsyre, fosforsyre, salpetersyre,  
svovelsyre og saltsyre, og blandinger derav.
- 25 4. Den topiske farmasøytiske emulsjonssammensetningen ifølge krav 2 eller 3, hvori det  
chelaterende midlet er valgt fra gruppen som består av sitronsyre, glukuronsyre,  
natriumheksametafosfat, sinkheksametafosfat, etylendiamintetraeddiksyre, fosfonater, salter  
derav og blandinger derav.
- 30 5. Den topiske farmasøytiske emulsjonssammensetningen ifølge krav 2 til 4, hvori  
konserveringsmidlet er valgt fra gruppen som består av benzylalkohol, imidazolidinylurea,  
diazolidinylurea, diklorbenzylalkohol, kloroksylenol, metylparaben, etylparaben,  
propylparaben, butylparaben, fenoksyetanol, sorbinsyre, benzosyre, salter derav og blandinger  
derav.

6. Den topiske farmasøytiske emulsjonssammensetningen ifølge krav 2 til 5, hvori oppløsningsmidlet er en blanding av propylenglykol og dietylenglykolmonoetyler.

7. Den topiske farmasøytiske emulsjonssammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori 3,5-dihydroksy-4-isopropyl-trans-stilbenet eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav er i en mengde på fra ca. 0,05 til 2 vekt-%, basert på totalvekten av sammensetningen.

8. Den topiske farmasøytiske emulsjonssammensetningen ifølge krav 1, hvori oljefasen omfatter triglyserider av middels kjede.

9. Den topiske farmasøytiske emulsjonssammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori det overflateaktive midlet omfatter ett eller flere ikke-ioniske overflateaktive midler.

10. Den topiske farmasøytiske emulsjonssammensetningen ifølge krav 9, hvori det ene eller flere ikke-ioniske overflateaktive midlene er valgt fra etoksylerte fettalkoholer, PEG-ricinusoljer, PEG-estere, propylenglykolestere, glyserylestere og derivater, polymere etere, sorbitanderivater, fettalkoholer, emulgerende vokser og blandinger derav.

11. Den topiske farmasøytiske emulsjonssammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori antioksidanten er i en mengde på ca. 0,001 til ca. 5 vekt-%, ca. 0,01 til 1 vekt-%, ca. 0,05 vekt-% eller ca. 0,1 vekt-%, basert på totalvekten av sammensetningen.

12. Den topiske farmasøytiske emulsjonssammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori antioksidanten er valgt fra gruppen som består av propylgallat, butylert hydroksytoluen, tokoferol og blandinger derav.

13. Den topiske farmasøytiske emulsjonssammensetningen ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene, hvori den gjennomsnittlige dråpestørrelsen til oljefasen er ca. 0,05 mikron til ca. 35 mikron, ca. 0,05 mikron til ca. 5 mikron, ca. 0,05 til ca. 1 mikron, eller ca. 0,1 mikron til ca. 0,75 mikron.

**14.** Den topiske farmasøytiske emulsjonssammensetningen ifølge krav 1, hvori sammensetningen omfatter:

3,5-dihydroksy-4-isopropyl-trans-stilben eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav i en mengde på ca. 0,5 vekt-%, basert på totalvekten av sammensetningen;

5 en oljefase omfattende triglyserider av middels kjede i en mengde på ca. 10 vekt-%, basert på totalvekten av sammensetningen;

en rensset vannfase i en mengde på ca. 65,18 vekt-%, basert på totalvekten av sammensetningen;

10 et overflateaktivt middel, hvori det overflateaktive midlet er en blanding på ca. 7,20 vekt-% av den minst ene ikke-ioniske emulgerende voksen NF etter vekt, ca. 1,80 vekt-% steareth-2, ca. 1,10 vekt-% steareth-20, og 1,5 vekt-% polysorbate 80, basert på totalvekten av sammensetningen;

en antioksidant i en mengde på ca. 0,10 %, basert på totalvekten av sammensetningen, hvori antioksidanten er butylert hydroksytoluen;

15 et pH-justerende middel i en mengde på ca. 0,27 vekt-%, basert på totalvekten av sammensetningen, hvori det pH-justerende midlet er en sitrat/-sitronsyrebuffer;

et chelateringsmiddel i en mengde på ca. 0,10 vekt-%, basert på totalvekten av sammensetningen, hvori chelateringsmidlet er dinatriumetylendiamintetraeddiksyre;

20 et konserveringsmiddel i en mengde på ca. 0,25 vekt-%, basert på totalvekten av sammensetningen, hvori konserveringsmidlet er benzosyre; og

et ko-løsningsmiddel, hvori ko-løsningsmidlet er en blanding på ca. 10 vekt-% propylenglykol og ca. 2 vekt-% dietylenglykolmonoetyler, basert på totalvekten av sammensetningen;

25 hvori 3,5-dihydroksy-4-isopropyl-trans-stilbenet eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav løseliggjøres i oljefasen;

hvori oljefasen er i det vesentlige fri for mineralolje.

**15.** Den topiske farmasøytiske emulsjonssammensetningen ifølge krav 1, hvori sammensetningen omfatter:

30 3,5-dihydroksy-4-isopropyl-trans-stilben eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav i en mengde på ca. 1,0 vekt-%, basert på totalvekten av sammensetningen;

en oljefase omfattende triglyserider av middels kjede i en mengde på ca. 10 vekt-%, basert på totalvekten av sammensetningen;

en rensset vannfase i en mengde på ca. 64,68 vekt-%, basert på totalvekten av sammensetningen;

et overflateaktivt middel, hvori det overflateaktive midlet er en blanding på ca. 7,20 vekt-% av den minst ene ikke-ioniske emulgerende voksen NF etter vekt, ca. 1,80 vekt-% steareth-2, ca. 1,10 vekt-% steareth-20, og 1,5 vekt-% polysorbate 80, basert på totalvekten av sammensetningen;

en antioksidant i en mengde på ca. 0,10 %, basert på totalvekten av sammensetningen, hvori antioksidanten er butylert hydroksytoluen;

et pH-justerende middel i en mengde på ca. 0,27 vekt-%, basert på totalvekten av sammensetningen, hvori det pH-justerende midlet er en sitrat/-sitronsyrebuffer;

et chelateringsmiddel i en mengde på ca. 0,10 vekt-%, basert på totalvekten av sammensetningen, hvori chelateringsmidlet er dinatriumetylendiamintetraeddiksyre;

et konserveringsmiddel i en mengde på ca. 0,25 vekt-%, basert på totalvekten av sammensetningen, hvori konserveringsmidlet er benzosyre; og

et ko-løsningsmiddel, hvori ko-løsningsmidlet er en blanding av ca. 10 vekt-% propylenglykol og ca. 2 vekt-% dietylenglykolmonoetyler, basert på totalvekten av sammensetningen;

hvori 3,5-dihydroksy-4-isopropyl-trans-stilbenet eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav løseliggjøres i oljefasen;

hvori oljefasen er i det vesentlige fri for mineralolje.

**16.** Sammensetning ifølge et hvilket som helst av de foregående kravene for anvendelse i behandlingen av en dermatologisk tilstand eller lidelse.

**17.** Sammensetning for anvendelse ifølge krav 16, hvori den dermatologiske tilstanden eller lidelsen er valgt fra gruppen som består av psoriasis, psoriasisartritt, eksfoliativ dermatitt, pityriasis rosea, lichen planus, lichen nitidus, porokeratose, pemphigus, bulløs pemfigoid, epidermamolysis bullosa acquisita, pustulære utbrudd i håndflatene eller sålen, hårsykdommer, negler, rosacea, perioral dermatitt eller follikulære syndromer, plateepitelkarsinom, basalcellekarsinom, keratoakantom, godartede epitelsvulster, merkelcellekarsinom, pigmentforstyrrelser, albinisme, hypomelanoser, hypermelanoser, melanocytisk nevi, melanom, erythema elevatum diutinum, eosinofiler, granuloma faciale, pyoderma gangrenosum, ondartet atrofisk papulose, fibrøse lesjoner i dermis og bløtvev, Kaposi sarkom, pannikulitt, lipodystrofi, angioødem, transplantat-mot-vert, allergisk kontaktdermatitt,

autosensibiliserende dermatitt, atopisk dermatitt, seboreisk dermatitt, termisk skade, strålingsdermatitt, liktorn, kallus, akutt og kronisk UV-stråling, fotosensibilisering, spedalskhet, borreliose, onykomykose, tinea pedra, røde hunder, meslinger, herpes simplex, EBV (Epstein-Barr-virus), HPV (humant papillomavirus) og vorter.

5

**18.** Sammensetning ifølge et hvilket som helst av kravene 1–16 for anvendelse i terapi.