



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3431072 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 8/37 (2006.01)
A61K 8/06 (2006.01)
A61K 9/00 (2006.01)
A61K 9/08 (2006.01)
A61K 9/107 (2006.01)
A61K 31/40 (2006.01)
A61K 47/10 (2017.01)
A61K 47/14 (2017.01)
A61Q 15/00 (2006.01)
A61Q 19/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45) Translation Published 2020.02.17

(80) Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent 2019.11.06

(86) European Application Nr. 17181684.6

(86) European Filing Date 2017.07.17

(87) The European Application's Publication Date 2019.01.23

(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 Dr. August Wolff GmbH & Co. KG Arzneimittel, Sudbrackstrasse 56, 33611 Bielefeld, Tyskland

(72) Inventor Christians, Thorsten, Dr. August Wolff GmbH & Co. KG Sudbrackstrasse 56, 33611 Bielefeld, Tyskland
Knie, Ulrich, Dr. August Wolff GmbH & Co. KG Sudbrackstrasse 56, 33611 Bielefeld, Tyskland
Abels, Christoph, Dr. August Wolff GmbH & Co. KG Sudbrackstrasse 56, 33611 Bielefeld, Tyskland

(74) Agent or Attorney ZACCO NORWAY AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

(54) Title **OIL IN WATER EMULSION**

(56) References Cited: WO-A2-2012/103038
US-A1- 2017 087 088
US-A1- 2015 196 490

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.** Olje-i-vann-emulsjon omfattende

minst ett glykopyrronium- (GP) salt og et emulgatorsystem,

5 hvori emulsjonen som emulgatorsystem omfatter en kombinasjon av:

makrogolglyserolmonostearat,

glyserolmonostearat og

en blanding av cetyl- og stearylalkoholer med minimum 40,0 vekt-%
stearylalkohol.

10

2. Olje-i-vann-emulsjonen ifølge krav 1 omfattende

a) en dispergert/indre oljefase;

b) en kontinuerlig/ytre vannfase inneholdende glykopyrronium- (GP) saltet; og

c) emulgatorsystemet.

15

3. Olje-i-vann-emulsjonen ifølge krav 1 og/eller krav 2, hvori GP-saltet er valgt fra gruppen bestående av GP-bromid, GP-acetat og GP-tosylat.

4. Olje-i-vann-emulsjonen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvori GP-saltet er en racemisk blanding av (3R)-3-[(2S)-(2-syklopentyl-2-hydroksy-2-fenylacetyl)oksy]-1,1-dimetylpyrrolidiniumbromid og (3S)-3-[(2R)-(2-syklopentyl-2-hydroksy-2-fenylacetyl)oksy]-1,1-dimetylpyrrolidiniumbromid eller

20

en racemisk blanding av (3R)-3-[(2S)-(2-syklopentyl-2-hydroksy-2-fenylacetyl)oksy]-1,1-dimetylpyrrolidiniumtosylat og (3S)-3-[(2R)-(2-syklopentyl-2-hydroksy-2-fenylacetyl)oksy]-1,1-dimetylpyrrolidiniumtosylat.

25

5. Olje-i-vann-emulsjonen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, hvori GP-saltet er inneholdt i en mengde på 0,05 til 5 vekt-%, foretrukket på 0,1 til 3 vekt-%, mer foretrukket på 0,2 til 2 vekt-% og enda mer foretrukket på 0,5 til 1,5 vekt-%, basert på den totale emulsjonens vekt.

30

6. Olje-i-vann-emulsjonen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5 omfattende som emulgatorsystem en kombinasjon av

makrogol-20-glyserolmonostearat,

35

glyserolmonostearat 40-55 og

cetostearylalkohol.

7. Olje-i-vann-emulsjonen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6 omfattende en mengde på 4,0 til 10,0 vekt-%, foretrukket på 5,0 til 9,0 vekt-%, mer foretrukket på 6,0 til 8,0 vekt-% og enda mer foretrukket på 6,5 til 7,5 vekt-% av makrogolglyserolmonostearat,

5 en mengde på 1,5 til 7,5 vekt-%, foretrukket på 2,5 til 6,5 vekt-%, mer foretrukket på 3,5 til 5,5 vekt-% og enda mer foretrukket på 4,0 til 5,0 vekt-% glyserolmonostearat og

10 en mengde på 5,0 til 11,0 vekt-%, foretrukket på 6,0 til 10,0 vekt-%, mer foretrukket på 7,0 til 9,0 vekt-% og enda mer foretrukket på 7,5 til 8,5 vekt-% av blandingen av henholdsvis cetyl- og stearylalkoholer, basert på den totale emulsjonens vekt.

8. Olje-i-vann-emulsjonen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7, hvori emulgatorsystemet omfatter

15 en mengde på 21 til 51 vekt-%, foretrukket på 26 til 46 vekt-%, mer foretrukket på 31 til 41 vekt-% og enda mer foretrukket på 33 til 38 vekt-% makrogolglyserolmonostearat,

20 en mengde på 8 til 38 vekt-%, foretrukket på 13 til 33 vekt-%, mer foretrukket på 18 til 28 vekt-% og enda mer foretrukket på 21 til 26 vekt-% glyserolmonostearat, og

en mengde på 26 til 56 vekt-%, foretrukket på 31 til 51 vekt-%, mer foretrukket på 36 til 46 vekt-% og enda mer foretrukket på 38 til 44 vekt-% av blandingen av cetyl- og stearylalkoholer, basert på emulgatorsystemets vekt.

25 **9.** Olje-i-vann-emulsjonen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8 for anvendelse som medikament.

30 **10.** Olje-i-vann-emulsjonen for anvendelse ifølge krav 9, hvori den kliniske lidelsen som skal behandles, er valgt fra gruppen bestående av primær og sekundær hyperhidrose, gustatorisk svetting assosiert med Freys syndrom, gustatorisk svetting assosiert med diabetisk autonom nevropati, og eksessiv svetting.

35 **11.** Olje-i-vann-emulsjonen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 9 og/eller 10, hvori emulsjonen påføres topisk på huden til et pattedyr, foretrukket 1-4 ganger daglig, mer foretrukket 1-2 ganger daglig, enda mer foretrukket 1 gang daglig før sengetid, mest foretrukket 2-3 per uke.

12. Farmasøytisk sammensetning omfattende olje-i-vann-emulsjonen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8 og én eller flere farmasøytisk akseptable eksipienter.

5

13. Kosmetisk sammensetning omfattende olje-i-vann-emulsjonen ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8 og én eller flere kosmetisk akseptable eksipienter.

10

14. Ikke-terapeutisk anvendelse av olje-i-vann-emulsjonen som definert i et hvilket som helst av kravene 1 til 8 som et kosmetisk middel, foretrukket for topisk påføring på huden til et pattedyr, særlig for å redusere svetting hos individer som opplever vanlig svetting og/eller eksessiv svetting.