(12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau

162162

(43) International publication date
23 June 2005 (23.06.2005)

PCT

(10) International publication number
WO 2005/055975 A2

(51) International patent classification[7]: A61K 9/00

(21) International application number:
PCT/EP2004/013839

(22) International filing date:
6 December 2004 (06.12.2004)

(25) Language of filing: German

(26) Language of publication: German

(30) Data relating to the priority:
03 028 353.5 10 December 2003 (10.12.2003) EP

(71) Applicant *(for all designated States except US)*: SCHERING AG [DE/DE]; Müllerstrasse 170-178, 13353 Berlin (DE).

(72) Inventors: PODHAISKY, Hans-Peter; Am Planetarium 16, 07745 Jena (DE). BRACHT, Stefan; Meisenweg 16, 07751 Jena (DE).

(74) Joint Representative: CRAMER, Eva-Maria; Jenapharm GmbH & Co. KG, Otto-Schott-Strasse 15, 07745 Jena (DE).

G00002

(81) Designated states *(unless otherwise indicated, for every kind of national protection available)*: AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Designated states *(unless otherwise indicated, for every kind of regional protection available)*: ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), Eurasian (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Published:
— *Without international search report and to be republished upon receipt of that report.*

For an explanation of the two-letter codes and the other abbreviations, reference is made to the explanations ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") at the beginning of each regular edition of the PCT Gazette.

As printed

(54) Title: UV-STABLE, LIQUID OR SEMI-SOLID TRANSDERMAL ADMINISTRATION FORM COMPRISING A PHOTOSENSITIVE ACTIVE INGREDIENT

(54) Bezeichnung: UV-STABILE, FLÜSSIGE ODER HALBFESTE TRANSDERMALE DARREICHUNGSFORM MIT LICHTEMPFINDLICHEM WIRKSTOFF

(57) Abstract: The invention relates to semi-solid and liquid pharmaceutical administration forms for transdermal application, comprising a pharmaceutical active ingredient that is photosensitive in the UV spectrum and at least one UV absorbent adjuvant (UV absorber), the latter being dissolved or dispersed in the administration form. Preferably, the inventive administration form is a transdermal gel, whose gel base is composed of water, alcohol, at least one gel-forming polymer and optionally additional ingredients. Gels of this type are also referred to as hydroalcoholic gels. The invention provides an administration form comprising a photosensitive active ingredient, which permits the application system to be highly stable without the disadvantages that are present during the application of conventional semi-solid transdermal application forms. Thus the harmful accompanying effects, such as e.g. the absorption of light protection substances by the body, which can potentially result from intentional light protection measures, are kept to an absolute minimum.

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft halbfeste und flüssige pharmazeutische Darreichungsformen zur transdermalen Anwendung mit einem im UV-Bereich lichtempfindlichen pharmazeutischen Wirkstoff und mindestens einem UVLicht absorbierenden Hilfsstoff (UV Absorber), wobei dieser in der Darreichungsform gelöst oder dispergiert vorliegt. Vorteilhafterweise betrifft die erfindungsgemässe Darreichungsform transdermale Gele, deren Gelgrundlage aus Wasser, Alkohol, mindestens einem gelbildenden Polymer und ggf. weiteren Inhaltsstoffen zusammengesetzt ist. Solche Gele werden auch als hydroalkoholische Gele bezeichnet. Es wird eine Darreichungsform mit einem lichtempfindlichen pharmazeutischen Wirkstoff bereitgestellt, wobei das Applikationssystem eine hohe Stabilität ohne die bei Anwendung der konventionellen halbfesten transdermalen Applikationsformen bekannten Nachteile realisiert. Dabei werden die aus dem beabsichtigten Lichtschutz für den Anwender möglicherweise resultierende schädlichen Begleitwirkungen, wie z.B. Aufnahme von Lichtschutzstoffen in den Körper, so gering wie möglich gehalten werden.

WO 2005/055975 A2