



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2164467 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/16 (2006.01)
A61K 9/00 (2006.01)
A61K 9/19 (2006.01)
A61K 38/09 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2017.03.13
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2016.12.14
(86)	European Application Nr.	08763237.8
(86)	European Filing Date	2008.06.06
(87)	The European Application's Publication Date	2010.03.24
(30)	Priority	2007.06.06, EP, 07109767 2007.10.27, WO, PCT/IB07/054372
(84)	Designated Contracting States:	AT BE BG CH CY CZ DE DK EE ES FI FR GB GR HR HU IE IS IT LI LT LU LV MC MT NL NO PL PT RO SE SI SK TR
	Designated Extension States:	AL BA RS
(73)	Proprietor	Debiopharm Research & Manufacturing SA, Rue de Levant 146, 1920 Martigny, CH-Sveits
(72)	Inventor	DUCREY, Bertrand, Av. des Neuilles 16, 1920 Martigny, CH-Sveits GARROUSTE, Patrick, Rue de l'Autoroute 54A, 1907 Saxon, CH-Sveits CURDY, Catherine, Muesmattweg 18, 4123 Allschwil, CH-Sveits BARDET, Marie-Anne, Route de Very 2, 1613 Maraçon, CH-Sveits PORCHET, Hervé, ch. du Midi 6, 1053 Cugy, CH-Sveits LUNDSTROM, Eija, 4, Rue des Remparts, 1095 Lutry, CH-Sveits HEIMGARTNER, Frédéric, Rue des Sugiez 16, 2074 Marin-Epagnier, CH-Sveits
(74)	Agent or Attorney	Bryn Aarflot AS, Postboks 449 Sentrum, 0104 OSLO, Norge

(54)	Title	SLOW RELEASE PHARMACEUTICAL COMPOSITION MADE OF MICROPARTICLES
(56)	References Cited:	WO-A-2004/096259 GB-A- 2 257 909 US-A- 5 134 122 US-A- 5 192 741 US-A- 5 225 205 US-A- 5 540 937 US-A1- 2002 013 273 US-A1- 2004 170 665

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. Farmasøytisk preparat fremstilt av mikropartikler for langsom frigjøring av LHRH-agonist triptorelin, karakterisert ved at nevnte preparat omfatter en første gruppe av mikropartikler og en andre gruppe av mikropartikler, hvor

5 a) mikropartiklene i nevnte første gruppe er fremstilt av en kopolymer av PLGA-type som inkorporerer nevnte LHRH-agonist i form av et vannuoppløselig peptidsalt; nevnte kopolymer omfattende minst 85% (molar) av melkesyre og som har egenviskositet på mellom 0,5 og 0,9 dl/g, målt i kloroform ved 25 °C og ved en polymerkonsentrasjon på 0,5 g/dl;

10 b) mikropartiklene av nevnte andre gruppe er fremstilt av en kopolymer av PLGA-type som inkorporerer nevnte LHRH-agonist i form av et vannuoppløselig peptidsalt og som omfatter en mengde av melkesyre på mellom 70% og 80% (molar);

15 mikropartiklene av nevnte første og andre grupper har videre en størrelsesfordeling definert som følger:

- D (v,0,1) er på mellom 10 og 30 mikrometer,
- D (v,0,5) er på mellom 30 og 70 mikrometer,
- D (v,0,9) er på mellom 50 og 110 mikrometer,

20 nevnte farmasøytiske preparat frigjør LHRH-agonisten triptorelin i det minste over et tidsrom som dekker 6. måned etter injeksjon av preparatet.

25 2. Farmasøytisk preparat ifølge krav 1, hvor nevnte kopolymer i første gruppe omfatter minst 85% (molar) av melkesyre og har egenviskositet på mellom 0,55 og 0,75 dl/g.

3. Farmasøytisk preparat ifølge krav 1 eller 2, hvor nevnte mikropartikler av nevnte første gruppe, eller av nevnte andre gruppe, eller av begge grupper, er mikrokuler.

30 4. Farmasøytisk preparat ifølge krav 1 eller 2, hvor nevnte mikropartikler av nevnte første gruppe, eller av nevnte andre gruppe, eller av begge grupper, er mikrogranuler.

5. Farmasøytisk preparat ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 4, hvor egenviskositeten til kopolymeren i nevnte andre gruppe er på mellom 0,5 og 0,9, fortrinnsvis mellom 0,60 og 0,70 dl/g.

35

6. Farmasøytisk preparat ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 5, hvor begge grupper av mikropartikler er i et doseforhold, uttrykt i peptidinnhold, på 50:50.
- 5 7. Farmasøytisk preparat ifølge krav 1 eller 2, hvor minst en av de nevnte grupper av mikropartikler oppnås ved å blande, i en oppløsningsmiddelfri prosess, nevnte PLGA med nevnte vannuoppløselige peptidsalt.
- 10 8. Farmasøytisk preparat ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 7, hvor nevnte vannuoppløselige peptidsalt er triptorelinpamoat.
9. Anvendelse av preparat ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 8 ved fremstilling av medikament for behandling av prostatakreft, karakterisert ved det faktum at nevnte preparat administreres en gang hver 6. måned.
- 15 10. Farmasøytisk preparat ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 8 for anvendelse ved behandling av prostatakreft, hvor nevnte preparat administreres en gang hver 6. måned.