



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2500014 B1

NORWAY

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

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2019.01.28
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.08.08
(86)	European Application Nr.	12172232.6
(86)	European Filing Date	2008.06.06
(87)	The European Application's Publication Date	2012.09.19
(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
(62)	Divided application	EP2164467, med inndato 2008.06.06
(73)	Proprietor	Debiopharm International SA, Chemin Messidor 5-7 Forum "après-demain" Case postale 5911, 1002 Lausanne, Sveits
(72)	Inventor	Ducrey, Bertrand, Av. des Neuilles 16, 1920 Martigny, Sveits Garrouste, Patrick, Rue de l'Autoroute 54A, 1907 Saxon, Sveits Curdy, Catherine, Muesmatweg 18, 4123 Allschwil, Sveits Bardet, Marie-Anne, Route du Very 2, 1613 Maraçon, Sveits Porchet, Hervé, ch. du Midi 6, 1053 Cugy, Sveits Lundstrom, Eija, Route de Lavaux 49, 1095 Lutry, Sveits Heimgarten, Frédéric, Rue des Sugiez 16, 2074 Marin-Epagnier, Sveits
(74)	Agent or Attorney	Debiopharm International SA, Forum "après-demain" Chemin Messidor 5-7 CP 5911, 1002 LAUSANNE, Sveits

(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-A1- 2004 170 665, US-A- 5 225 205, US-A- 5 540 937, US-A1- 2002 013 273, US-A- 5 192 741

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 en LHRH-agonist triptorelin, karakterisert ved at nevnte preparat omfatter en første gruppe av mikropartikler og en andre gruppe av mikropartikler, hvor

a) mikropartiklene i nevnte første gruppe er fremstilt av en kopolymer av PLGA-type som inkorporerer triptorelin i form av et vannuopløselig peptidsalt; nevnte kopolymer omfatter 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;

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

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,

og hvor triptorelin frigjøres i en viktig mengde innen timer etter injeksjon i et individ, og oppviser deretter en konstant og signifikant frigjøring inntil 6 måneder etter injeksjon.

2. Farmasøytisk preparat ifølge krav 1, hvor nevnte kopolymer i den første gruppen omfatter minst 85% (molar) melkesyre og har en 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 den andre gruppen eller av begge grupper er mikrokuler.

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

5. Farmasøytisk preparat ifølge et 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.

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.

7. Farmasøytisk preparat ifølge krav 1 eller 2, hvor minst én av nevnte grupper av mikropartikler oppnås ved å blande, i en oppløsningsmiddelfri prosess, nevnte PLGA med nevnte vannuoppløselige peptidsaltet.

8. Farmasøytisk preparat ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7, hvor det vannløselige peptidsaltet er triptorelinpamoat.

9. Farmasøytisk preparat ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8 for anvendelse ved behandling av prostatakreft, hvor nevnte preparat administreres en gang hver 6. måned.