



(12) **Translation of
european patent specification**

(11) **NO/EP 2605778 B1**

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/568 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2015.07.27
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2015.03.25
(86)	European Application Nr.	11754615.0
(86)	European Filing Date	2011.08.09
(87)	The European Application's Publication Date	2013.06.26
(30)	Priority	2010.08.16, GB, 201013701
(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	Innotesto Bvba, Grootreesdijk 22, 2460 Kasterlee, BE-Belgia
(72)	Inventor	MERKUS, Franciscus, Wilhelmus, Henricus, Maria, Grootreesdijk 22, B-2460 Kasterlee, BE-Belgia
(74)	Agent or Attorney	Bryn Aarflot AS, Postboks 449 Sentrum, 0104 OSLO, Norge

(54)	Title	TESTOSTERONE SOLUTIONS FOR THE TREATMENT OF TESTOSTERONE DEFICIENCY
(56)	References Cited:	EP-A1- 1 872 774 WO-A1-00/21503 WO-A1-2005/039531 WO-A2-97/38662 SALAHIAN B ET AL: "PHARAMACOKINETICS, BIOELICACY, AND SAFETY OF SUBLINGUAL TESTOSTERONE CYCLODEXTRIN IN HYPOGONADAL MEN: COMPARISON TO TESTOSTERONE ENENTHATE-A CLINICAL RESEARCH CENTER STUDY", JOURNAL OF CLINICAL ENDOCRINOLOGY AND METABOLISM, THE ENDOCRINE SOCIETY, US, vol. 80, no. 12, 1 December 1995 (1995-12-01), pages 3567-3575, XP001069851, ISSN: 0021-972X, DOI: 10.1210/JC.80.12.3567 WANG C ET AL: "SUBLINGUAL TESTOSTERONE REPLACEMENT IMPROVES MUSCLE MASS AND STRENGTH, DECREASES BONE RESORPTION, AND INCREASES BONE FORMATION MARKERS IN HYPOGONADAL MEN-A CLINICAL RESEARCH CENTER STUDY", JOURNAL OF CLINICAL ENDOCRINOLOGY AND METABOLISM, THE ENDOCRINE SOCIETY, US, vol. 81, no. 10, 1 January 1996 (1996-01-01), pages 3654-3662, XP000916279, ISSN: 0021-972X, DOI: 10.1210/JC.81.10.3654 LEICHTNAM M L ET AL: "Identification of penetration enhancers for testosterone transdermal delivery from spray formulations", JOURNAL OF CONTROLLED RELEASE, ELSEVIER, AMSTERDAM, NL, vol. 113, no. 1, 12 June 2006 (2006-06-12) , pages 57-62, XP024957535, ISSN: 0168-3659, DOI: 10.1016/J.JCONREL.2006.03.008 [retrieved on 2006-06-12]

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. En løsning av testosteron for anvendelse ved behandling av testosteronmangel i et hannkjønn ved oromukosal administrering, karakterisert ved at nevnte behandling
5 omfatter oromukosal administrering av en dose på 10-500µL av nevnte løsning til nevnte hannkjønn hver 1-4 timer, idet dosene blir administrert to, tre eller 4-10 ganger pr. dag, mens pasienten er våken, hvor hver dose omfatter 100 til 1000µg testosteron og hvor dosene blir administrert i form av en spray, dråper eller med en dosepenn.
- 10 2. En testosteronløsning for anvendelse ifølge krav 1, karakterisert ved at nevnte behandling omfatter administrering av 2-3 doser om morgenen og hvis nødvendig 2-3 ytterligere doser om ettermiddagen.
- 15 3. En testosteronløsning for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 2, karakterisert ved at hver dose omfatter 10-250µL av nevnte testosteronløsning eller 25-100µL av nevnte testosteronløsning.
- 20 4. En testosteronløsning for anvendelse ifølge hvilket som helst av kravene 1-3, karakterisert ved at testenosteronløsningen har en testosteronkonsentrasjon i området 0,1-1% (vekt/volum).
- 25 5. En testosteronløsning for anvendelse i henhold til hvilket som helst av de foregående krav ved behandling av primær, sekundær eller aldersrelatert hypogonadisme eller tilstander assosiert med disse så som hypofyseale sykdommer, seksuell dysfunksjon, redusert muskelmasse og muskelstyrke, nedtrykket stemningsleie, osteoporose eller redusert kognitiv funksjon.
- 30 6. En vandig testosteronløsning for anvendelse i henhold til hvilket som helst av de foregående krav, omfattende 0,01 - 1% vekt/volum testosteron i et vandig løsningsmiddel omfattende et tilfeldig metylert beta-cyklodekstrin kompleksdannende middel for nevnte testosteron.
- 35 7. En vandig testosteronløsning for anvendelse i henhold til hvilket som helst av de foregående krav, idet nevnte løsning omfatter 0-15% vekt/volum etanol; 0,1 - 1,0% vekt/volum av testosteron kompleksbundet i tilfeldig metylert beta-cyklodekstrin; og

vann.

8. En vandig testosteronløsning ifølge krav 7, hvor det tilfeldig metylerte beta-cyklodekstrin har en grad av substitusjon i området 1,5 til 2,0.

5

9. En vandig testosteronløsning ifølge hvilket som helst av kravene 6-8, hvor det vandige løsningsmidlet omfatter 1-10% vekt/volum tilfeldig metylert beta-cyklodekstrin.

10

10. En vandig testosteronløsning ifølge hvilket som helst av kravene 6-9, hvor det vandige løsningsmidlet videre omfatter en C2-C5 alkohol så som etanol eller isopropanol i en mengde fra 10-25% volum/volum.

15

11. En ikke-vandig testosteronløsning for anvendelse ifølge hvilket som helst av kravene 1-5, omfattende 0,1-1,0% vekt/volum av testosteron i et ikke-vandig løsningsmiddel omfattende 4-35% volum/volum av en C2-C5 alkohol og et annet farmasøytisk akseptabelt ikke-vandig løsningsmiddel.

20

12. En ikke-vandig testosteronløsning for anvendelse ifølge krav 11, karakterisert ved at nevnte ikke-vandige løsningsmiddel er valgt fra isopropyl myristat, isopropyl palmitat, isopropyl stearat, andre farmasøytisk akseptable estere av C8-C22 fettsyrer og C2-C6 alkoholer og vegetabilske oljer.

25

13. En ikke-vandig testosteronløsning for anvendelse ifølge krav 11 eller krav 12, omfattende isopropyl myristat og dimetyl isosorbid.

30

14. En ikke-vandig testosteronløsning for anvendelse ifølge hvilket som helst av kravene 11-13, hvor nevnte ikke-vandige løsningsmiddel omfatter 4-35% volum/volum etanol og et annet ikke-vandig løsningsmiddel i en mengde tilstrekkelig for å nå 100% volum/volum.

35

15. En ikke-vandig testosteronløsning for anvendelse ifølge hvilket som helst av kravene 1-5, omfattende 0,01-1,0% vekt/volum testosteron, 0-15% vekt/volum etanol og isopropyl myristat opptil 100% volum/volum.