



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2709633 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/795 (2006.01)
A61K 9/00 (2006.01)
A61K 38/16 (2006.01)
A61P 15/02 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2019.12.09
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.09.04
(86)	European Application Nr.	11865925.9
(86)	European Filing Date	2011.07.14
(87)	The European Application's Publication Date	2014.03.26
(30)	Priority	2011.05.16, US, 201161486700 P
(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	Starpharma Pty Ltd, PO Box 2022, Preston, VIC 3072, Australia
(72)	Inventor	PAULL, Jeremy Robert Arthur, 3 Keogh Street, Burwood, Victoria 3125, Australia FAIRLEY, Jacinth Kincaid, 62 Kooyongkoot Road, Hawthorn, Victoria 3122, Australia PRICE, Clare Frances, 12 Sherbrooke Avenue, Elsternwick, Victoria 3185, Australia LEWIS, Gareth Rhys, 1/188 Charman Road, Cheltenham, Victoria 3192, Australia
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54)	Title	METHOD OF TREATMENT OR PROPHYLAXIS OF BACTERIAL VAGINOSIS
------	-------	--

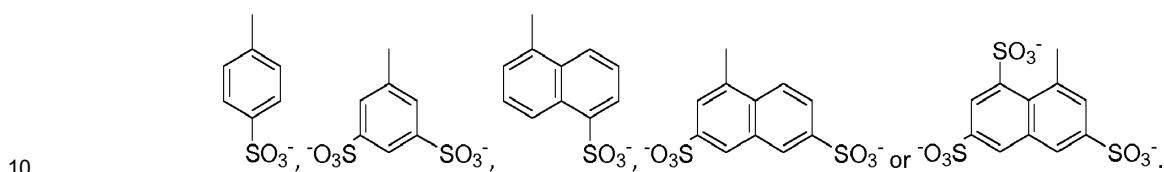
(56)	References Cited:	US-A1- 2010 252 050 WO-A1-00/15240 WO-A1-02/079299 Anonymous: "NCT01201057 on 2011_03_25: ClinicalTrials.gov Archive", , 25 March 2011 (2011-03-25), XP055138451, Retrieved from the Internet: URL: http://clinicaltrials.gov/archive/NCT01201057/2011_03_25 [retrieved on 2014-09-05] IAN MCGOWAN ET AL: "Phase 1 randomized trial of the vaginal safety and acceptability of SPL7013 gel (VivaGel) in sexually active young women (MTN-004)", AIDS, vol. 25, no. 8, 15 May 2011 (2011-05-15), pages 1057-1064, XP055138338, ISSN: 0269-9370, DOI: 10.1097/QAD.0b013e328346bd3e Richard Rupp ET AL: "VivaGel (SPL7013 Gel): a candidate dendrimer--microbicide for the prevention of HIV and HSV infection", International journal of nanomedicine, 1 January 2007
------	-------------------	--

(2007-01-01), pages 561-566, XP055138456, New Zealand Retrieved from the Internet:
 URL:<http://www.pubmedcentral.nih.gov/articlerender.fcgi?artid=2676817&tool=pmcentrez&rendertype=abstract> [retrieved on 2014-09-05]
 NICOLAS BERTRAND ET AL: "New pharmaceutical applications for macromolecular binders",
 JOURNAL OF CONTROLLED RELEASE, ELSEVIER, AMSTERDAM, NL, vol. 155, no. 2, 27
 April 2011 (2011-04-27), pages 200-210, XP028315148, ISSN: 0168-3659, DOI:
 10.1016/J.JCONREL.2011.04.027 [retrieved on 2011-05-05]
 JOHN O'LOUGHLIN ET AL: "Safety, Tolerability, and Pharmacokinetics of SPL7013 Gel
 (VivaGel): A Dose Ranging, Phase I Study", SEXUALLY TRANSMITTED DISEASES, vol. 37,
 no. 2, 1 February 2010 (2010-02-01), pages 100-104, XP055138341, ISSN: 0148-5717, DOI:
 10.1097/OLQ.0b013e3181bc0aac
 DONDERS G: "Diagnosis and management of bacterial vaginosis and other types of abnormal
 vaginal bacterial flora: A review", OBSTETRICAL AND GYNECOLOGICAL SURVEY 2010
 LIPPINCOTT WILLIAMS AND WILKINS USA, vol. 65, no. 7, July 2010 (2010-07), pages 462-
 473, XP009180009, ISSN: 0029-7828

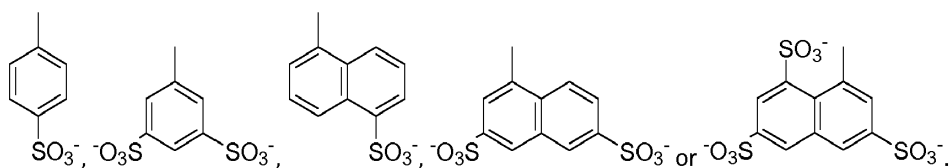
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters 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. Makromolekyl som omfatter en polylysindendrimer med 3 til 4 generasjoner og som har én eller flere sulfonsyreholdige enheter festet til én eller flere overflateaminogrupeer i dendrimerens ytterste generasjon, for anvendelse i behandling av bakteriell vaginose hos et individ, hvor makromolekylet administreres ved vaginal administrering i en mengde fra 40 mg til 100 mg per dag, og hvor den sulfonsyreholdige enheten er valgt fra:



2. Makromolekyl for anvendelse ifølge krav 1, hvor makromolekylet administreres i en mengde fra 40 mg til 60 mg per dag.
3. Makromolekyl for anvendelse ifølge krav 1 eller 2, hvor makromolekylet reduserer et symptom på bakteriell vaginose hos individet valgt fra vaginal dårlig lukt og/eller vaginal utflod.
4. Makromolekyl for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvor makromolekylet normaliserer eller opprettholder en Nugent Score på < 4 i individet.
5. Makromolekyl for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, hvor makromolekylet administreres i en gelformulering med en pH mellom 4,5 og 5,5.
6. Makromolekyl som omfatter en polylysindendrimer med 3 til 4 generasjoner og som har én eller flere sulfonsyreholdige enheter festet til én eller flere overflateaminogrupeer i dendrimerens ytterste generasjon, for anvendelse ved profylakse eller reduksjon av residiv bakteriell vaginose i en individ, hvor makromolekylet administreres ved vaginal administrering 1 til 7 ganger per uke, og hvor den sulfonsyreholdige delen er valgt fra:

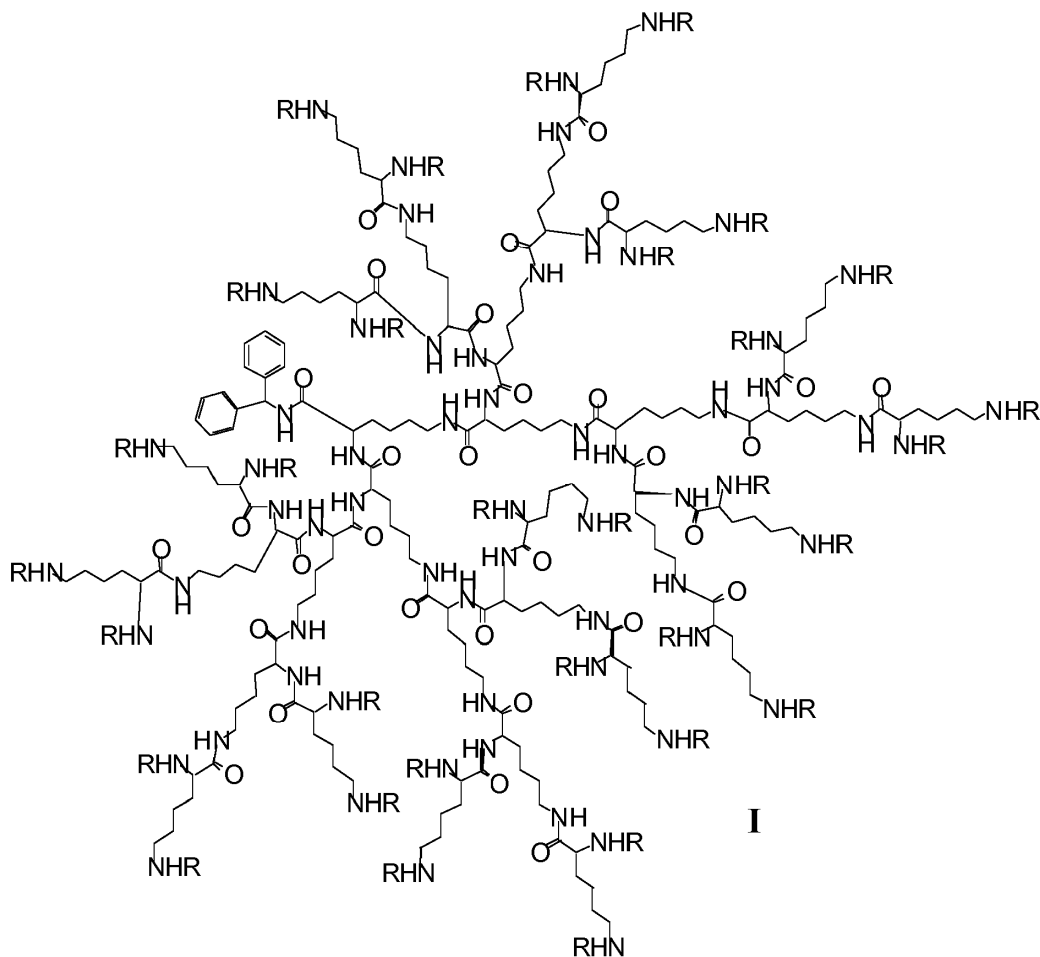


- 5 7. Makromolekyl for anvendelse ifølge krav 6, hvor makromolekylet administreres i en mengde fra 30 mg til 200 mg per dose, eller fra 40 mg til 160 mg per dose.
8. Makromolekyl for anvendelse ifølge krav 6 eller 7, hvor makromolekylet administreres 3 til 4 ganger per uke og/eller annenhver dag.
- 10 9. Makromolekyl for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 6 til 8, hvor makromolekylet administreres nær seksuell aktivitet, eller under eller etter menstruasjon.
- 15 10. Makromolekyl for anvendelse ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, hvor makromolekylet ikke er inhiberende overfor *Lactobacillus acidophilus*.
- 20 11. Makromolekyl for anvendelse ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, hvor makromolekylet er inhiberende overfor *Gardnerella vaginalis*, *Prevotella bivia* og/eller *B. ovatus*.
12. Makromolekyl for anvendelse ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, hvor makromolekylet har antibakteriell aktivitet overfor *Gardnerella vaginalis* og ingen antibakteriell aktivitet overfor *Lactobacillus acidophilus*.
- 25 13. Makromolekyl for anvendelse ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, hvor den sulfonsyreholdige enhet er bundet til den dendrimer-terminale aminogruppen ved en linker, hvor linkeren er en alkyl- eller alkenylengruppe hvor ett eller flere ikke-tilstøtende karbonatomer er eventuelt et oksygen- eller svovelatom, eller en gruppe $-X_1-(CH_2)_q-X_2-$ hvor X_1 og X_2 er uavhengig valgt fra $-NH-$, $-C(O)-$, $-O-$, $-S-$, $-C(S)$ og q er 0 eller et helt tall fra 1 til 10, og hvor én eller flere ikke-tilstøtende (CH_2) grupper kan erstattes med $-O-$ eller $-S-$.
- 30 14. Makromolekyl for anvendelse ifølge krav 13, karakterisert ved at linkeren er $\# - O-CH_2-C(O)-*$ hvor $\#$ betegner tilknytning til den sulfonsyreholdige delen og $*$
- 35

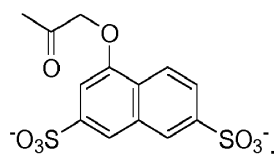
betegner tilknytning til den terminale aminosyregruppen til dendrimeren.

15. Makromolekyl for anvendelse ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, hvor dendrimeren er

5



hvor R er



10