



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2741824 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61P 15/18 (2006.01)
A61K 31/565 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

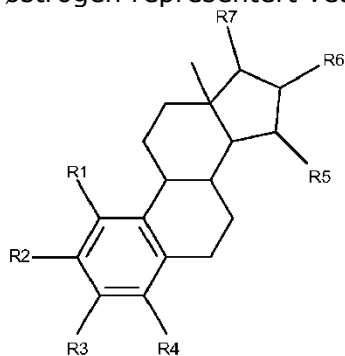
(21)	Translation Published	2017.09.04
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2017.05.03
(86)	European Application Nr.	12753086.3
(86)	European Filing Date	2012.08.09
(87)	The European Application's Publication Date	2014.06.18
(30)	Priority	2011.08.11, EP, 11177266 2011.08.11, US, 201161522480 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
	Designated Extension States:	BA ME
(73)	Proprietor	Estetra S.P.R.L., Rue Saint-Georges 5, 4000 Liège, BE-Belgia
(72)	Inventor	WOUTERS, Wout, Bodemanstraat 43, 1216 AJ Hilversum, NL-Nederland COELINGH BENNINK, Herman Jan Tijmen, Jachtrustlaan 1, 3985 MK Werkhoven, NL-Nederland PETIT, Ludivine, Rue de Paris 1, 4020 Liège, BE-Belgia FOIDART, Jean-Michel, Sur la Heid 3, 4870 Forêt Trooz, BE-Belgia
(74)	Agent or Attorney	Zacco Norway AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

(54)	Title	USE OF ESTETROL AS EMERGENCY CONTRACEPTIVE
(56)	References Cited:	WO-A2-2004/041839 US-A1- 2004 192 620 COELINGH BENNINK ET AL: "Ovulation inhibition by estetrol in an in vivo model", CONTRACEPTION, GERON-X, INC., LOS ALTOS, CA, US, vol. 77, no. 3, 22 January 2008 (2008-01-22), pages 186-190, XP022477670, ISSN: 0010-7824, DOI: 10.1016/J.CONTRACEPTION.2007.11.014 VISSER M ET AL: "Clinical applications for estetrol", JOURNAL OF STEROID BIOCHEMISTRY AND MOLECULAR BIOLOGY, ELSEVIER SCIENCE LTD., OXFORD, GB, vol. 114, no. 1-2, 1 March 2009 (2009-03-01), pages 85-89, XP026076475, ISSN: 0960-0760, DOI: 10.1016/J.JSBMB.2008.12.013 [retrieved on 2009-01-09] PAUL M. FINE: "Update on emergency contraception", ADVANCES IN THERAPY, vol. 28, no. 2, 10 December 2010 (2010-12-10), pages 87-90, XP055015108, ISSN: 0741-238X, DOI: 10.1007/s12325-010-0090-x

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. Fremgangsmåte for nødprevensjon hos et hunnpattedyr, omfattende administrering av et nødprevensjonsmiddel omfattende tetrahydroksylert østrogen representert ved generell formel (I):



(I)

hvor R1, R2, R3, R4 uavhengig er et hydrogenatom, en hydroksylgruppe, en alkoksygruppe med 1-5 karbonatomer eller en ketogruppe;

foretrukket hvor R1, R2, R3, R4 uavhengig er et hydrogenatom, en hydroksylgruppe eller en alkoksygruppe med 1-5 karbonatomer;

hvor hver av R5, R6, R7 er en hydroksylgruppe; og

hvor ikke mer enn 3 av R1, R2, R3 og R4 er hydrogenatomer,

i en effektiv mengde for å hindre graviditet hos et hunnpattedyr, hvor administreringen utføres ved ikke-vaginal administrering.

2. Fremgangsmåten ifølge et hvilket som helst av kravene 1, hvor administreringen utføres ved oral, parenteral, rektal, transkutan eller topisk administrering.

3. Fremgangsmåten ifølge et hvilket som helst av kravene 1 eller 2, hvor nødprevensjonen ytterligere omfatter et farmasøytisk akseptabelt salt eller en farmasøytisk akseptabel eksipient.

4. Fremgangsmåten ifølge et hvilket som helst av kravene 1 eller 3, hvor nødprevensjonen ytterligere omfatter en ytterligere aktiv ingrediens som er egnet til å hindre graviditet.

5. Fremgangsmåten ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4, hvori det tetra-hydroksylerte østrogenet er estetrol (1,3,5(10)-estratrien-3, 15 α , 16 α , 17 β -tetrol).

5 **6.** Fremgangsmåten ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5, hvori nødprevensjonen omfatter det tetra-hydroksylerte østrogenet i en dose på mellom 0,5 og 7 mg/kg, mellom 1,0 og 5,0 mg/kg, mellom 1,5 og 2,5 mg/kg eller på ca. 2,0 mg/kg

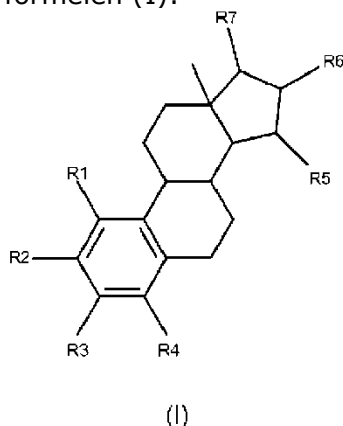
10 **7.** Fremgangsmåten ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 5, hvori nødprevensjonen omfatter det tetra-hydroksylerte østrogenet i en dose på mellom 30 mg og 400 mg, mellom 40 mg og 250 mg, mellom 40 mg og 200 mg, mellom 40 mg og 150 mg, mellom 40 mg og 100 mg, mellom 50 mg og 100 mg eller på ca. 100 mg estetrol.

15 **8.** Fremgangsmåten ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7, hvori administreringen utføres i en enkeltdose.

20 **9.** Fremgangsmåten ifølge krav 1 til 7, hvori administreringen utføres i en dobbeltdose, f.eks. med et intervall på 6, 12, 18 eller 24 timer.

25 **10.** Fremgangsmåten ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 9, hvori administreringen utføres innen 120 timer etter samleie, foretrukket innen 96 timer, innen 72 timer, innen 48 timer, innen 24 timer, innen 12 timer eller mindre.

11. Anvendelse av tetrahydroksylert østrogen representert ved den generelle formelen (I):



hvor R1, R2, R3, R4 uavhengig er et hydrogenatom, en hydroksylgruppe, en alkoksygruppe med 1-5 karbonatomer eller en ketogruppe;

foretrukket hvor R1, R2, R3, R4 uavhengig er et hydrogenatom, en hydroksylgruppe eller en alkoksygruppe med 1-5 karbonatomer;

5 hvor hver av R5, R6, R7 er en hydroksylgruppe; og

hvor ikke mer enn 3 av R1, R2, R3 og R4 er hydrogenatomer,

som nødprevensjonsmiddel,

hvor administreringen av det tetrahydroksylerte østrogenet utføres ved ikke-vaginal administrering.

10

12. Anvendelsen ifølge krav 11, hvor administreringen av det tetrahydroksylerte østrogenet utføres ved oral, parenteral, rektal, transkutan eller topisk administrering.