



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2938332 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 38/09 (2006.01)
A61K 9/00 (2006.01)
A61K 9/08 (2006.01)
A61K 9/107 (2006.01)
A61K 47/22 (2006.01)
A61K 47/24 (2006.01)
A61K 47/26 (2006.01)
A61K 47/28 (2006.01)
A61K 47/30 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2018.07.09
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2018.02.21
(86)	European Application Nr.	13867921.2
(86)	European Filing Date	2013.12.27
(87)	The European Application's Publication Date	2015.11.04
(30)	Priority	2012.12.28, KR, 20120157583
(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	Chong Kun Dang Pharmaceutical Corp., 8 Chungjeong-ro Seodaemun-gu, Seoul 120-756, KR-Sør-Korea
(72)	Inventor	YOON, Sang Phil, 315-20 Dongbaekjukjeon-daeroGiheung-gu, Yongin-siGyeonggi-do 446-916, KR-Sør-Korea KO, Ki Seong, 315-20 Dongbaekjukjeon-daeroGiheung-gu, Yongin-siGyeonggi-do 446-916, KR-Sør-Korea YU, Ha Na, 315-20 Dongbaekjukjeon-daeroGiheung-gu, Yongin-siGyeonggi-do 446-916, KR-Sør-Korea BAIK, Hye Jung, 315-20 Dongbaekjukjeon-daeroGiheung-gu, Yongin-siGyeonggi-do 446-916, KR-Sør-Korea YANG, Won Kyu, 315-20 Dongbaekjukjeon-daeroGiheung-gu, Yongin-siGyeonggi- do 446-916, KR-Sør-Korea KO, Jin Young, 315-20 Dongbaekjukjeon-daeroGiheung-gu, Yongin-siGyeonggi-do 446-916, KR-Sør-Korea PARK, So Hyun, 315-20 Dongbaekjukjeon-daeroGiheung-gu, Yongin-siGyeonggi-do 446-916, KR-Sør-Korea JUNG, Sung Bum, 315-20 Dongbaekjukjeon-daeroGiheung-gu, Yongin-siGyeonggi-do 446-916, KR-Sør-Korea AN, Sung Won, 315-20 Dongbaekjukjeon-daeroGiheung-gu, Yongin-siGyeonggi-do 446-916, KR-Sør-Korea

KI, Min Hyo, 315-20 Dongbaekjukjeon-daeroGiheung-gu, Yongin-siGyeonggi-do
446-916, KR-Sør-Korea

(74) Agent or Attorney TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

(54) Title **SUSTAINED-RELEASE LIPID PRE-CONCENTRATE OF GNRH ANALOGUES AND
PHARMACEUTICAL COMPOSITION COMPRISING THE SAME**

(56) References
Cited: WO-A1-2013/032207, WO-A1-2014/104784, US-A- 5 807 573, US-A1- 2012 269 772,
US-A1- 2007 080 323, US-A1- 2008 274 176, US-A1- 2011 091 420, US-A1- 2005 118 206

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 sammensetning som omfatter:

- a) minst én umettet sorbitanfettsyreester som har et polarhode med minst to eller flere -OH(hydroksyl)-grupper;
- b) minst ett fosfolipid;
- c) minst én flytende krystallherder, som er fri for en ioniserbar gruppe, som har en hydrofob del med 15 til 40 karbonatomer med en triacylgruppe eller en karbonringstruktur; og
- d) minst én GnRH (gonadotropinfrigivende hormon) analog som en farmakologisk aktiv substans, hvori lipidforkonsentratet eksisterer som en flytende fase i fravær av vandig fluid og formes til en flytende krystall i nærvær av vandig fluid,

hvori GnRH-analogen er en GnRH-agonist som er valgt fra gruppen som består av leuprolid, goserelin, triptorelin, nafarelin, buserelin, histrelin, deslorelin, meterelin, gonadorelin, et farmasøytisk akseptabelt salt derav og en kombinasjon derav, eller hvori GnRH-analogen er en GnRH-antagonist som er valgt fra gruppen som består av degarelix, abarelix, ganirelix, cetorelix, et farmasøytisk akseptabelt salt derav og en kombinasjon derav.

2. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1, hvori den umettede sorbitanfettsyreesteren er valgt fra gruppen som består av sorbitanmonooleat, sorbitanmonolinoleat, sorbitanmonopalmitoleat, sorbitanmonomyristoleat, sorbitansesquioleat, sorbitansesquilinoleat, sorbitansesquipalmitoleat, sorbitansesquimyristoleat, sorbitandioleat, sorbitandilinoleat, sorbitandipalmitoleat, sorbitandimyristoleat og en kombinasjon derav.

3. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1, hvori den umettede sorbitanfettsyreesteren er valgt fra gruppen som består av sorbitanmonooleat, sorbitanmonolinoleat, sorbitanmonopalmitoleat, sorbitanmonomyristoleat, sorbitansesquioleat og en kombinasjon derav.

4. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1, hvori fosfolipidet inneholder en mettet eller umettet alkylestergruppe med 4 til 30 karbonatomer og er valgt fra gruppen som består av fosfatidylkolin, fosfatidyletanolamin, fosfatidylserin, fosfatidylglyserin, fosfatidylinositol, fosfatidinsyre, sfingomyelin og en kombinasjon derav.

5. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1, hvori den flytende krystallherderen er valgt fra gruppen som består av triglyserid, retinylpalmitat, tokoferolacetat, kolesterol, benzybenzoat, ubiquinon og en kombinasjon derav.

6. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1, hvori den flytende krystallherderen er valgt fra gruppen som består av tokoferolacetat, kolesterol og en kombinasjon derav.

7. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1, for anvendelse i forebygging eller behandling av en kjønns hormonavhengig sykdom, eller som et prevensjonsmiddel.

8. Den farmasøytiske sammensetningen for anvendelse ifølge krav 7, hvori den kjønns hormonavhengige sykdommen er valgt fra gruppen som består av prostatakreft, brystkreft, eggstokkreft, endometriose, uterinfibroid, polycystisk ovariesykdom, forstadig pubertet, hypertrikose, gonadotrope hypofyseadenomer, søvnapné syndrom, irritabelt tarmsyndrom, premenstruelt syndrom, godartet prostatahyperplasi og infertilitet.

9. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1, som omfatter:

a) minst én umettet sorbitanfettsyreester som har et polarhode med minst to eller flere -OH (hydroksyl)-grupper i en mengde på 9 ~90 vekt-%;

b) minst ett fosfolipid i en mengde på 9~90 vekt-%;

c) minst én flytende krystallherder som er fri for en ioniserbar gruppe og har en triacylgruppe med 15 til 40 karbonatomer eller en karbonringstruktur i en hydrofob del i en mengde på 0,1~50 vekt-%; og

d) minst én GnRH (gonadotropinfrigivende hormon) analog i en mengde på 0,01~50 vekt-%.

10. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1, som omfatter:

a) minst én umettet sorbitanfettsyreester som har et polarhode med minst to eller flere -OH(hydroksyl)-grupper i en mengde på 9~64 vekt-%;

b) minst ett fosfolipid i en mengde på 18~76 vekt-%;

c) minst én flytende krystallherder som er fri for en ioniserbar gruppe og har en triacylgruppe med 15 til 40 karbonatomer eller en karbonringstruktur i en hydrofob del i en mengde på 1~36 vekt-%; og

d) leuprolid eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav i en mengde på 0,1~50 vekt-%.

11. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1, som omfatter:

a) minst én umettet sorbitanfettsyreester som har et polarhode med minst to eller flere -OH(hydroksyl)-grupper i en mengde på 9~64 vekt-%;

- b) minst ett fosfolipid i en mengde på 18~76 vekt-%;
- c) minst én flytende krystallherder som er fri for en ioniserbar gruppe og har en triacylgruppe med 15 til 40 karbonatomer eller en karbonringstruktur i en hydrofob del i en mengde på 1~36 vekt-%; og
- d) goserelin eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav i en mengde på 0,1~50 vekt-%.

12. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 1, som omfatter:

- a) minst én umettet sorbitanfettsyreester som har et polarhode med minst to eller flere -OH(hydroksyl)-grupper i en mengde på 9~64 vekt-%;
- b) minst ett fosfolipid i en mengde på 18~76 vekt-%;
- c) minst én flytende krystallherder som er fri for en ioniserbar gruppe og har en triacylgruppe med 15 til 40 karbonatomer eller en karbonringstruktur i en hydrofob del i en mengde på 1~36 vekt-%; og
- d) degarelix eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav i en mengde på 2~50 vekt-%.