



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3207149 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
C12P 13/04 (2006.01)
A61K 9/00 (2006.01)
A61K 38/00 (2006.01)
A61K 47/34 (2017.01)
A61K 47/59 (2017.01)
A61P 15/08 (2006.01)
A61P 35/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2023.07.10
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.06.07
(86)	European Application Nr.	15850568.5
(86)	European Filing Date	2015.10.15
(87)	The European Application's Publication Date	2017.08.23
(30)	Priority	2014.10.15, US, 201462064008 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	Foresee Pharmaceuticals Co., Ltd., 17f., No. 3, Park St. Nangang Dist., Taipei City Taiwan 115, Taiwan Li, Yuhua, 116 Ridgewood Drive, Landenberg, PA 19350, USA Guarino, Andrew J., 14 N Valley Stream Cir., Newark, DE 19702, USA
(72)	Inventor	LI, Yuhua, 116 Ridgewood Drive, Landenberg, PA 19350, USA GUARINO, Andrew, J., 14 N Valley Stream Cir., Newark, DE 19702, USA
(74)	Agent or Attorney	Cosmovici Intellectual Property, Rue du Commerce 4, 1204 GENÈVE, Sveits

(54)	Title	PHARMACEUTICAL COMPOSITION WITH IMPROVED STABILITY
(56)	References Cited:	US-A1- 2003 133 964 US-A1- 2005 042 294 US-A1- 2007 196 416 US-A1- 2008 020 016 BURTON K W ET AL: "Extended release peptide delivery systems through the use of PLGA microsphere combinations", JOURNAL OF BIOMATERIALS SCIENCE. POLYMER EDIT, VSP, UTRECHT, NL, vol. 11, no. 7, 1 January 2000 (2000-01-01), pages 715-729, XP009079300, ISSN: 0920-5063, DOI: 10.1163/156856200743977 JAY A. SCHRIER ET AL: "Recombinant Human Bone Morphogenetic Protein-2 Binding and Incorporation in PLGA Microsphere Delivery Systems", PHARMACEUTICAL DEVELOPMENT AND TECHNOLOGY, vol. 4, no. 4, 20 January 1999 (1999-01-20), pages 611-621, XP055472724, US ISSN: 1083-7450, DOI: 10.1081/PDT-100101400

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/>

EP 3 207 149 B1

Patentkrav

1. Fremgangsmåte for å fremstille en injiserbar sammensetning med levering av kontrollert frisetting av legemiddel omfattende:

5

kombinere en laktatbasert polymer med en gjennomsnittlig molekylvekt på mellom 5000 og 50 000 daltoner, et syretall på mindre enn 3 mgKOH/g og innholdet med rester av laktidmonomerer i den laktatbaserte polymeren med mindre enn 0,3 % etter vekt; med

10

farmasøytisk akseptabelt organisk løsemiddel; og

bioaktivt stoff valgt fra gruppen bestående av gonadotropinfrigjørende hormon (LHRH), LHRH-analoger, agonister, antagonist og salter derav, med betingelsen at ingen syretilsetning tilsettes ved fremstilling av sammensetningen.

15

2. Fremgangsmåten ifølge krav 1, hvor laktidet i den laktatbaserte polymeren er D-laktid, D,L-laktid, L,D-laktid, L-laktid, (R,R)-laktid, (S,S)-laktid og meso-laktid eller en hvilken som helst kombinasjon derav.

20

3. Fremgangsmåten ifølge krav 1, hvor den laktatbaserte polymeren har innholdet med rester av laktidmonomerer på mindre enn omtrent 0,2 % etter vekt.

4. Fremgangsmåten ifølge krav 1, hvor den laktatbaserte polymeren har innholdet med rester av laktidmonomerer på mindre enn omtrent 0,1 % etter vekt.

25

5. Fremgangsmåten ifølge krav 1, hvor den laktatbaserte polymeren har et syretall på mindre enn 2 mg KOH/g.

30

6. Fremgangsmåten ifølge krav 1, hvori den laktatbaserte polymeren er poly(laktid-ko-glykolid) (PLGA) der forholdet mellom laktid og glykolid er fra 50/50 til 100/0.

7. En injiserbar sammensetning med levering av kontrollert frisetting av legemiddel omfattende:

EP 3 207 149 B1

- 5 a. laktatbasert polymer med en gjennomsnittlig molekylvekt på mellom 5000 og 50 000 daltoner, et syretall på mindre enn 3 mg KOH/g og innholdet med rester av laktidmonomerer i den laktatbaserte polymeren med mindre enn 0,3 % etter vekt;
- b. farmasøytisk akseptabelt løsemiddel; og
- c. bioaktivt stoff valgt fra gruppen bestående av gonadotropinfrigjørende hormon (LHRH), LHRH-analoger, agonister, antagonist og salter derav,
- 10 med betingelsen at ingen syretilsetning tilsettes ved fremstilling av sammensetningen, og at sammensetningen reduserer dannelsen av konjugatet.
8. Den injiserbare sammensetningen ifølge krav 7, hvor laktidet i den laktatbasert polymeren er D-laktid, D,L-laktid, L,D-laktid, L-laktid, (R,R)-laktid, (S,S)-laktid og meso-laktid eller en hvilken som helst kombinasjon derav.
- 15 9. Fremgangsmåten ifølge krav 7, hvor den laktatbaserte polymeren har et syretall på mindre enn 2 mg KOH/g.
- 20 10. Den injiserbare sammensetningen ifølge krav 7, hvor den laktatbaserte polymeren har innholdet med rester av laktidmonomerer i den laktatbaserte polymeren på mindre enn omtrent 0,2 % etter vekt.
11. Den injiserbare sammensetningen ifølge krav 7, hvor den laktatbaserte polymeren har innholdet med rester av laktidmonomerer på mindre enn omtrent 0,1 % etter vekt.
- 25 12. Den injiserbare sammensetningen ifølge 7, hvori den laktatbaserte polymeren er poly(laktid-ko-glykolid) (PLGA) der forholdet mellom laktid og glykolid er fra 50/50 til 100/0.
- 30 13. Den injiserbare sammensetningen ifølge krav 7, hvor det bioaktive stoffet er leuprolid eller et salt derav.