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

(11) **NO/EP 3562485 B1**

(19) NO

NORWAY

(51) Int Cl.
A61K 31/4045 (2006.01)
A61K 9/22 (2006.01)
A61K 9/50 (2006.01)
A61K 45/06 (2006.01)
A61P 15/16 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2020.09.21
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.07.01
(86)	European Application Nr.	19714150.0
(86)	European Filing Date	2019.03.22
(87)	The European Application's Publication Date	2019.11.06
(30)	Priority	2018.03.23, EP, 18305328 2018.03.23, US, 201862763129 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 Validation States:	KH MA TN
(73)	Proprietor	Laboratoires Major, 6 rue Copernic, 75116 Paris, Frankrike
(72)	Inventor	EL GLAOUI, Guillaume, c/o Laboratoires Major 12 rue de Berri, 75008 Paris, Frankrike EL GLAOUI, Medhi, c/o Laboratoires Major 12 rue de Berri, 75008 Paris, Frankrike PERRIN, Philippe, 10 rue du Docteur Roux, 75015 Paris, Frankrike DROUPY, Stéphane, 68 route Sauve, 30900 Nîmes, Frankrike AGATHON-MERIAU, Véronique, 31 rue Raymond Queneau, 92500 Rueil-Malmaison, Frankrike
(74)	Agent or Attorney	Nordic Patent Service A/S, Bredgade 30, 1260 KØBENHAVN K, Danmark

---

(54) Title **NON-HORMONAL COMPOSITIONS AND METHODS FOR MALE CONTRACEPTION COMPRISING (R)-SILODOSIN**

(56) References Cited:

CN-B- 102 283 816

JIN WANG ET AL: "Assessment of Tamsulosin as a Potential Male Contraceptive in Healthy Volunteers", UROLOGY., vol. 80, no. 3, 1 September 2012 (2012-09-01), pages 614-617, XP055240673, US ISSN: 0090-4295, DOI: 10.1016/j.urology.2012.06.003 cited in the application

KOBAYASHI K ET AL: "ORGASM IS PRESERVED REGARDLESS OF EJACULATORY DYSFUNCTION WITH SELECTIVE ALPHA-1A-BLOCKER ADMINISTRATION", EUROPEAN

UROLOGY SUPPLEMENTS, ELSEVIER BV, NL, vol. 7, no. 3, 1 March 2008 (2008-03-01), page 186, XP022610457, ISSN: 1569-9056, DOI: 10.1016/S1569-9056(08)60457-1 [retrieved on 2008-03-01]
CHEN Y ET AL: "Blockade of alpha1A-adrenoceptor: A novel possible strategy for male contraception", MEDICAL HYPOTHESES, EDEN PRESS, PENRITH, US, vol. 73, no. 2, 1 August 2009 (2009-08-01) , pages 140-141, XP026124106, ISSN: 0306-9877, DOI: 10.1016/J.MEHY.2009.02.022 [retrieved on 2009-05-08]
BHAT G ET AL: "BKP 02 Prospective double blind randomised study to evaluate the efficacy of Siliodosin 8 mg as on demand, reversible, male oral contraceptive", INDIAN JOURNAL OF UROLOGY, MEDKNOW PUBLICATIONS AND MEDIA PVT. LTD, IN , vol. 34, no. 5, Supplement 1 1 January 2018 (2018-01-01), page S7, XP009507905, ISSN: 1998-3824 Retrieved from the Internet: URL:http://www.indianjurol.com/text.asp?20 18/34/5/7/222931
KJAERGAARD N ET AL: "Prazosin, an adrenergic blocking agent inadequate as male contraceptive pill", CONTRACEPTION, GERON-X, INC., LOS ALTOS, CA, US, vol. 37, no. 6, 1 June 1988 (1988-06-01), pages 621-629, XP023167444, ISSN: 0010-7824, DOI: 10.1016/0010-7824(88)90008-X [retrieved on 1988-06-01]

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. Sammensetning for anvendelse i en ikke-hormonell prevensjonsmetode for et mannlig individ, hvori sammensetningen er en formulering med forlenget frigivelse omfattende:

- en alfa-1-adrenoreseptorantagonist; og
- minst én farmasøytisk akseptabel bærer,

hvori prevensjonsmetoden inkluderer en én gang daglig administrering av sammensetningen på omtrent samme tid hver dag, utløse en kontinuerlig reversibel aspermi, azoospermi eller alvorlig oligozoospermi hos det mannlige individet, hvori prevensjonen etter en innledende periode på minst to påfølgende dager ikke svekkes av en forsinkelse av det påfølgende inntaket én gang daglig, og hvori alfa-1-adrenoreseptorantagonisten er *(R)*-silodosin.

2. Sammensetningen for anvendelse ifølge krav **1**, hvori sammensetningen administreres oralt.

3. Sammensetningen for anvendelse ifølge krav **1** eller krav **2**, hvori, inntaket av en neste dose etter den innledende perioden på påfølgende dager kan forsinkes fra 6 til 18 timer etter den siste faste daglige dosetiden, og tilstanden til aspermi, azoospermi eller alvorlig oligozoospermi opprettholdes hos det mannlige individet.

4. Sammensetningen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene **1** til **3**, hvori manglende inntak av en daglig dose etter den innledende perioden på påfølgende dager ikke påvirker den kontinuerlige tilstanden av aspermi, azoospermi eller alvorlig oligozoospermi som understøtter prevensjonsmetoden i 36 til 48 timer fra siste inntakstid.

5. Sammensetningen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene **1** til **4**, hvori prevensjonsmetoden utføres i minst åtte dager.

6. Sammensetningen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene **1** til **5**, hvori alfa-1-adrenoreseptorantagonisten er i en mengde i området fra ca. 0,1 til ca. 30 mg, fortrinnsvis fra ca. 0,2 til ca. 20 mg.

7. Sammensetningen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene **1** til **6**, hvori *(R)*-silodosin er i en polymorf eller amorf form.

8. Sammensetningen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene **1** til **7**, hvori sammensetningen inkluderer eller består av minst én partikkel, fortrinnsvis minst én belagt partikkel, og den gjennomsnittlige partikkeldiameteren er i området fra 0,01 til 5 mm, fortrinnsvis 0,1 til 2 mm.

9. Sammensetningen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene **1** til **8**, hvori partiklene omsluttes til en kapsel, idet hver kapsel fylles av partikler i et antall tilstrekkelig til å nå den daglige dosen.

10. Sammensetningen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene **1** til **9**, hvori prevensjonen oppnås uavhengig av matforbruket til det mannlige individet.

11. Sammensetningen for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene **1** til **10**, hvori den daglige administreringsprevensjonsmetoden videre omfatter en samtidig eller sekvensiell administrering av en ytterligere sammensetning egnet for behandling av erektil dysfunksjon; fortrinnsvis omfatter den ytterligere sammensetningen en fosfodiesterase-5-inhibitor.

12. Emballasje omfattende minst 7, 14, 28, 56, 84 eller 168 til 365 enhetsdoser; eller 10, 20, 30, 60, 90 eller 180 til 360 enhetsdoser av sammensetningen for anvendelse beskrevet i et hvilket som helst av kravene **1** til **10**, idet hver enhetsdose er en daglig dose.

13. Emballasje ifølge krav **12**, hvori sammensetningen inkluderer *(R)*-silodosin i en mengde i området fra ca. 0,1 til ca. 30 mg, fortrinnsvis fra ca. 0,2 til ca. 20 mg, fortrinnsvis i en mengde på 8 til 12 mg.