



NORWAY

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

(11) **NO/EP 3576771 B1**

(19) **NO**
(51) **Int Cl.**
A61K 38/09 (2006.01)
A61K 9/00 (2006.01)
A61K 9/06 (2006.01)
A61K 9/16 (2006.01)
A61K 47/34 (2017.01)
A61P 35/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2022.06.20
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2022.03.09
(86)	European Application Nr.	18747581.9
(86)	European Filing Date	2018.01.31
(87)	The European Application's Publication Date	2019.12.11
(30)	Priority	2017.01.31, US, 201762452788 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	Veru Inc., 4400 Biscayne Blvd. Suite 888, Miami, Florida 33137, USA
(72)	Inventor	RAVI, Kacker, 39 Paul Revere Road, Lexington, Massachusetts 02421, USA MITCHELL S., Steiner, 2600 Forest Hill Road, Germantown, Tennessee 38139, USA
(74)	Agent or Attorney	RWS, Europa House, Chiltern Park, Chiltern Hill, SL99FG CHALFONT ST PETER, Storbritannia

(54)	Title	COMPOSITIONS AND METHODS FOR LONG TERM RELEASE OF GANADOTROPIN- RELEASING HORMONE (GNRH) ANTAGONISTS
(56)	References Cited:	US-A- 5 744 153, US-A1- 2003 133 964, US-A1- 2012 202 743, US-A1- 2013 203 796 US-A1- 2005 042 294, US-A1- 2016 106 804, GB-A- 2 228 262, US-A1- 2007 003 592 US-A1- 2011 200 679, US-A1- 2006 003 008, CN-A- 102 145 160, US-A1- 2007 196 416, Www Posterpresentations ET AL: "RESEARCH POSTER PRESENTATION DESIGN 2019", , 1 February 2020 (2020-02-01), XP055697671, Retrieved from the Internet: URL: https://verupharma.com/wp-content/uplo ads/2020/02/VERU-100-Poster-02-2020.pdf [retrieved on 2020-05-25] & Anonymous: "Determination of the ability of a novel, long-acting subcutaneous GnRH antagonist, VERU-100, to castrate without a testosterone surge in a rat model. Journal of Clinical Oncology", , 19 February 2020 (2020-02-19), XP055697672, Retrieved from the Internet: URL: https://ascopubs.org/doi/10.1200/JCO.2020.38.6_suppl.128 [retrieved on 2020-05-25], SCHWACH G ET AL: "Biodegradable microparticles for sustained release of a new GnRH antagonist - part I: screening commercial PLGA and formulation technologies", EUROPEAN JOURNAL OF PHARMACEUTICS AND BIOPHARMACEUTICS, ELSEVIER SCIENCE PUBLISHERS B.V., AMSTERDAM, NL, vol. 56, no. 3, 1 November 2003 (2003-11-01), pages 327-336, XP004470468, ISSN: 0939-6411, DOI: 10.1016/S0939-6411(03)00096-1

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 som omfatter cetorelix og en polymer, idet nevnte polymer omfatter et poly(laktid-co-glykolid) (PLGA) i et molforhold av laktid : glykolid mellom
5 50:50 og 100:0, hvor cetorelix er til stede i en mengde på 5% - 90% av massen av nevnte sammensetning, og nevnte polymer er til stede i en mengde på 10% - 50% av massen av nevnte sammensetning, og hvor nevnte sammensetning er i stand til å forlenge frigjøringen av cetorelix i et individ i et tidsrom fra 1 måned til 6 måneder.
- 10 2. Sammensetning ifølge krav 1, hvor nevnte sammensetning er i stand til å frigjøre cetorelix i mer enn 90 dager.
3. Sammensetning ifølge krav 1, hvor nevnte sammensetning er i form av en hydrogel.
15
4. Sammensetning ifølge krav 1, hvor nevnte sammensetning er en flytbar sammensetning.
5. Sammensetning ifølge krav 1, hvor nevnte sammensetning er i form av et
20 implantat.
6. Sammensetning ifølge krav 1, hvor laktid : glykolid-vektforholdet av nevnte PLGA er 55:45, 60:40, 65:35, 70:30, 75:25, 80:20, 85:15, 90:10 eller 95:5.
- 25 7. Sammensetning ifølge krav 1, som videre omfatter et løsemiddel.
8. Sammensetning ifølge krav 7, hvor nevnte løsemiddel er et polart aprotisk løsemiddel.
- 30 9. Sammensetning ifølge krav 8, hvor nevnte løsemiddel er *N*-metyl-2-pyrrolidon.
10. Sammensetning ifølge krav 7, hvor nevnte løsemiddel er til stede i en konsentrasjon i området fra 10 vekt-% til 30 vekt-%.
- 35 11. Sammensetning ifølge krav 7, hvor nevnte PLGA omfatter like deler laktid og glykolid.

12. Sammensetning ifølge krav 7, hvor nevnte PLGA omfatter 75% laktid og 25% glykolid.
- 5 13. Sammensetning ifølge krav 7, hvor nevnte PLGA omfatter like deler av en første og en andre polymersammensetning, hvor nevnte første polymersammensetning omfatter like deler laktid og glykolid, og nevnte andre polymersammensetning omfatter 75% laktid og 25% glykolid.
- 10 14. Sammensetning ifølge krav 13, hvor polymeren er til stede i en konsentrasjon i området fra 20 vekt-% til 40 vekt-%.
15. Sammensetning ifølge krav 7, som videre omfatter et salt; fortrinnsvis hvor nevnte salt er Ca-pamoat, Na-oleat eller Ca-citrat.