



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3634419 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/519 (2006.01)
A61P 15/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

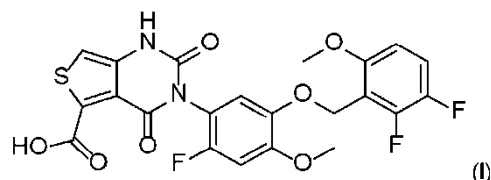
(45)	Translation Published	2025.04.28
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2025.01.29
(86)	European Application Nr.	18731976.9
(86)	European Filing Date	2018.06.05
(87)	The European Application's Publication Date	2020.04.15
(30)	Priority	2017.06.05, US, 201762515232 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	Kissei Pharmaceutical Co., Ltd., 19-48, Yoshino, Matsumoto-Shi, Nagano 399-8710, Japan
(72)	Inventor	LOUMAYE, Ernest, 29 Chemin de la Planta, 1223 Cologny, Sveits GOTTELAND, Jean-Pierre, 9 Rue Charles Humbert, 1205 Geneva, Sveits POHL, Oliver, c/o ObsEva S.A. Chemin des Aulx 12, 1228 Plan-les-Ouates, Sveits
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54)	Title	DOSING REGIMEN COMPRISING A GONADOTROPIN-RELEASING HORMONE ANTAGONIST FOR TREATING UTERINE FIBROIDS AND REDUCING MENSTRUAL BLOOD LOSS
(56)	References Cited:	EP-A1- 2 535 342 WO-A1-2018/030317 ANONYMOUS: "ObsEva SA Announces the Completion of a Phase 1 PK/PD Clinical Trial Evaluating Different Doses of OBE2109 and Add-Back Therapy", 7 June 2017 (2017-06-07), pages 1 - 7, XP055497341, Retrieved from the Internet <URL:http://www.obseva.com/news/obseva-sa-announces-the- completion-of-a-phase-1-pk-pd-clinical-trial-evaluating-different-doses-of-obe2109-and-add-back-therapy> [retrieved on 20180803] ARCHER DAVID F ET AL: "Elagolix for the management of heavy menstrual bleeding associated with uterine fibroids: results from a phase 2a proof-of-concept study", FERTILITY AND STERILITY, ELSEVIER SCIENCE INC, NEW YORK, NY, USA, vol. 108, no. 1, 1 June 2017 (2017-06-01), pages 152, XP085109784, ISSN: 0015-0282, DOI: 10.1016/J.FERTNSTERT.2017.05.006 ANONYMOUS: "Building a Leader by Innovating Women's Reproductive Health and Pregnancy Therapeutics", 1 November 2017 (2017-11-01), pages 1 - 35, XP055497348, Retrieved from the Internet <URL:http://www.jefferies.com/CMSFiles/Jefferies.com/files/ObsEva.pdf> [retrieved on 20180803] ANONYMOUS: "Annual Report 2016", 21 April 2017 (2017-04-21), pages 1 - 114, XP055497451, Retrieved from the Internet <URL:http://investors.obseva.com/phoenix.zhtml?c=254482&p=irol-reportsannual> [retrieved on 20180806]

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

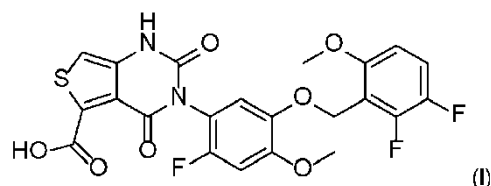
1. Forbindelse, 3-[2-fluor-5-(2,3-difluor-6-metoksybenzyloxy)-4-metoksyfenyl]-2,4-diokso-1,2,3,4-tetrahydropyrimidin-5-karboksylysyre, representert ved formel (I)



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for bruk i en fremgangsmåte for å redusere volumet av menstruelt blodtap hos en kvinnelig menneskelig pasient, fremgangsmåten omfatter administrering av forbindelsen til pasienten i en mengde på ca. 100 mg per dag.

2. Forbindelse for bruk ifølge krav 1, hvori pasienten har uterine fibroider.

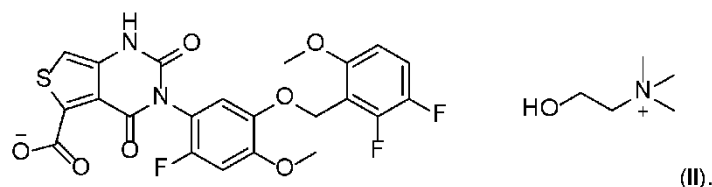
3. Forbindelse, 3-[2-fluor-5-(2,3-difluor-6-metoksybenzyloxy)-4-metoksyfenyl]-2,4-diokso-1,2,3,4-tetrahydropyrimidin-5-karboksylysyre, representert ved formel (I)



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for bruk i en fremgangsmåte for behandling av uterine fibroider hos en kvinnelig menneskelig pasient med behov for det, fremgangsmåten omfatter administrering av forbindelsen til pasienten i en mengde på ca. 100 mg per dag.

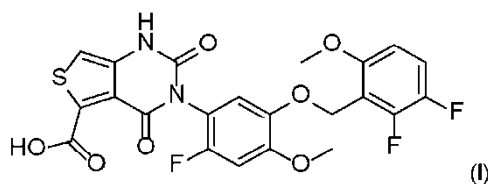
4. Forbindelse for bruk ifølge hvilket som helst av kravene 1-3, hvori forbindelsen administreres til pasienten i form av et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

5. Forbindelse for bruk ifølge krav 4, hvori det farmasøytisk akseptable saltet er et kolinsalt, representert ved formel (II)



6. Forbindelse for bruk ifølge hvilket som helst av kravene 1-5, hvori forbindelsen administreres til pasienten oralt.

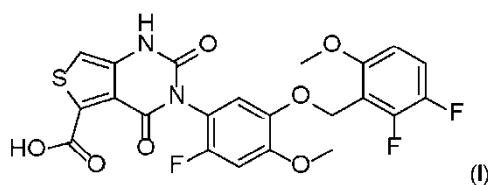
7. Forbindelse, 3-[2-fluor-5-(2,3-difluor-6-metoksybenzyloxy)-4-metoksyfenyl]-2,4-diokso-1,2,3,4-tetrahydropyrimidin-5-karboksylysyre, representert ved formel (I)



eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for bruk i en fremgangsmåte for å redusere volumet av menstruelt blodtap hos en kvinnelig pasient, fremgangsmåten omfatter administrering av forbindelsen til pasienten i en mengde på ca. 100 mg per dag eller ca. 200 mg per dag, hvor pasienten videre blir administrert add-back-terapi som omfatter β 17-østradiol og noretindronacetat, hvori β 17-østradiol administreres oralt til pasienten i en mengde på ca. 1,0 mg per dag, og hvori noretindronacetat administreres oralt til pasienten i en mengde på ca. 0,5 mg per dag.

8. Forbindelse for bruk ifølge krav 7, hvori pasienten har uterine fibroider.

9. Forbindelse, 3-[2-fluor-5-(2,3-difluor-6-metoksybenzyloxy)-4-metoksyfenyl]-2,4-diokso-1,2,3,4-tetrahydropyrimidin-5-karboksylysyre, representert ved formel (I)



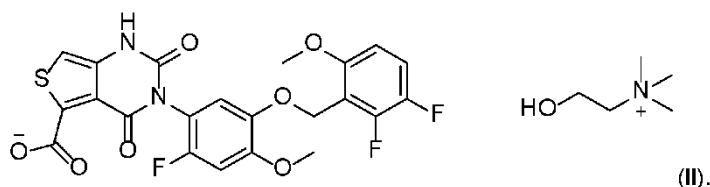
eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, for bruk i en fremgangsmåte for behandling av uterine fibroider hos en kvinnelig pasient med behov for det, fremgangsmåten omfatter administrering av forbindelsen til pasienten i en mengde på ca. 100 mg per dag eller ca. 200 mg per dag, hvor pasienten administreres videre add-back-terapi som omfatter β 17-østradiol og noretindronacetat, hvori β 17-østradiolen blir oralt administrert til pasienten i en mengde på ca. 1,0 mg per dag, og hvori noretindronacetat administreres oralt til pasienten i en mengde på ca. 0,5 mg per dag.

10. Forbindelse for bruk ifølge hvilket som helst av kravene 7-9, hvori forbindelsen administreres til pasienten i en mengde på 100 mg per dag.

11. Forbindelse for bruk ifølge hvilket som helst av kravene 7-9, hvori forbindelsen administreres til pasienten i en mengde på 200 mg per dag.

12. Forbindelse for bruk ifølge hvilket som helst av kravene 7-11, hvori forbindelsen administreres til pasienten i form av et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

13. Forbindelse for bruk ifølge krav 12, hvori det farmasøytisk akseptable saltet er et kolinsalt, representert ved formel (II)



14. Forbindelse for bruk ifølge hvilket som helst av kravene 7-13, hvori forbindelsen administreres til pasienten oralt.

15. Forbindelse for bruk ifølge hvilket som helst av kravene 7-14, hvori:

- a) pasienten viser amenoré etter administrering av forbindelsen til pasienten; og/eller
- b) pasienten viser reduserte bekkensmerter etter administrering av forbindelsen til pasienten.

16. Forbindelse for bruk ifølge hvilket som helst av kravene 7-15, hvori pasienten ikke viser en reduksjon i benmineraltetthet (BMD) på mer enn 5 % etter administrering av forbindelsen til pasienten, eventuelt hvori pasienten ikke viser en reduksjon i BMD på mer enn 1 % etter administrering av forbindelsen til pasienten.