



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 4094766 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

A61K 31/513 (2006.01)

A61K 31/565 (2006.01)

A61K 31/57 (2006.01)

A61P 15/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2025.06.10
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2025.04.02
(86)	European Application Nr.	22162349.9
(86)	European Filing Date	2017.09.29
(87)	The European Application's Publication Date	2022.11.30
(30)	Priority	2016.09.30, US, 201662402034 P 2016.09.30, US, 201662402055 P 2016.09.30, US, 201662402150 P 2017.05.01, US, 201762492839 P 2017.07.03, US, 201762528409 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
	Designated validation states	MA ; MD
(62)	Divided application	EP3518933, 2017.09.29
(73)	Proprietor	Sumitomo Pharma Switzerland GmbH, Aeschengraben 27 Floor 22, 4051 Basel, Sveits Takeda Pharmaceutical Company Limited, 1-1, Doshomachi 4-chome, Chuo-ku, Osaka-shi,, Osaka 541-0045, Japan
(72)	Inventor	JOHNSON, Brendan Mark, Chapel Hill, North Carolina 27514, USA SEELY, Lynn, San Mateo, California 94402, USA MUDD, Paul N. Jr., Cary, North Carolina 27519, USA WOLLOWITZ, Susan, Lafayette, California 94549, USA HIBBERD, Mark, Hampshire, GU33 6NQ, Storbritannia TANIMOTO, Masataka, Osaka-shi 540-8645, Japan RAJASEKHAR, Vijaykumar Reddy, Apple Valley, California 92308, USA SUKHATME, Mayukh Vasant, New York 10018, USA
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54) Title **ORAL FIXED DOSE COMBINATION AND USE THEREOF IN THE TREATMENT OF UTERINE FIBROIDS AND ENDOMETRIOSIS**

(56) References
Cited: WO-A1-2014/143669
DATABASE MEDLINE [online] US NATIONAL LIBRARY OF MEDICINE (NLM), BETHESDA, MD, US; January 1998 (1998-01-01), HORNSTEIN M D ET AL: "Leuprolide acetate depot and hormonal add-back in endometriosis: a 12-month study. Lupron Add-Back Study Group.", XP002779261, Database accession no. NLM9464714

NAKATA DAISUKE ET AL: "Suppression of the hypothalamic-pituitary-gonadal axis by TAK-385 (relugolix), a novel, investigational, orally active, small molecule gonadotropin-releasing hormone (GnRH) antagonist: Studies in human GnRH receptor knock", EUROPEAN JOURNAL OF PHARMACOLOGY, vol. 723, 11 December 2013 (2013-12-11), pages 167 - 174, XP028607987, ISSN: 0014-2999, DOI: 10.1016/J.EJPHAR.2013.12.001

M/S. REPORTSTACK: "Endometriosis - Opportunity Analysis and Forecasts to 2017", 4 February 2014 (2014-02-04), XP055460148, Retrieved from the Internet

<URL:https://www.prnewswire.com/news-releases/endometriosis---opportunity-analysis-and-forecasts-to-2017-243490131.html> [retrieved on 20180316]

ANONYMOUS: "A Long-term Extension Study of TAK-385 in the Treatment of Endometriosis - ClinicalTrials.gov", 8 May 2014 (2014-05-08), XP055460104, Retrieved from the Internet

<URL:https://www.clinicaltrials.gov/ct2/show/NCT01452685?term=TAK-385&draw=3&rank=12> [retrieved on 20180316]

ANONYMOUS: "NCT02655237 on 2016_09_14: ClinicalTrials.gov Archive", 14 September 2016 (2016-09-14), XP055460098, Retrieved from the Internet

<URL:https://clinicaltrials.gov/archive/NCT02655237/2016_09_14> [retrieved on 20180316]

OBSTETRICS AND GYNECOLOGY JAN 1998, vol. 91, no. 1, January 1998 (1998-01-01), pages 16 - 24, ISSN: 0029-7844

ANONYMOUS: "Efficacy and Safety of TAK-385 in the Treatment of Endometriosis - ClinicalTrials.gov", 25 February 2014 (2014-02-25), XP055460103, Retrieved from the Internet

<URL:https://www.clinicaltrials.gov/ct2/show/NCT01458301?term=TAK-385&draw=2&rank=11> [retrieved on 20180316]

KAZUHIRO MIWA ET AL: "Discovery of 1-{4-[1-(2,6-Difluorobenzyl)-5-[(dimethylamino)methyl]-3-(6-methoxypyridazin-3-yl)-2,4-dioxo-1,2,3,4-tetrahydrothieno[2,3-d]pyrimidin-6-yl]phenyl}-3-methoxyurea (TAK-385) as a Potent, Orally Active, Non-Peptide Antagonist of the Human Gonadotropin-Releasing Hormone Receptor", JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, vol. 54, no. 14, 28 July 2011 (2011-07-28), pages 4998 - 5012, XP055012890, ISSN: 0022-2623, DOI: 10.1021/jm200216q

ANONYMOUS: "Roivant Sciences and Takeda Launch Myovant Sciences to Develop Innovative Therapeutics for Women's Health and Prostate Cancer", 6 June 2016 (2016-06-06), XP055459497, Retrieved from the Internet

<URL:http://investors.myovant.com/tools/viewpdf.aspx?page={7F19DBB5-53F9-43CE-8BF9-CCE79BD044BD}> [retrieved on 20180314]

ANONYMOUS: "Efficacy and Safety of TAK-385 in the Treatment of Uterine Fibroids - Full Text View - ClinicalTrials.gov", 21 January 2013 (2013-01-21), XP055460100, Retrieved from the Internet

<URL:https://www.clinicaltrials.gov/ct2/show/NCT01452659?term=TAK-385&rank=9> [retrieved on 20180316]

ANONYMOUS: "NCT02655224 on 2016_09_29: ClinicalTrials.gov Archive", 29 September 2016 (2016-09-29), XP055460097, Retrieved from the Internet

<URL:https://clinicaltrials.gov/archive/NCT02655224/2016_09_29> [retrieved on 20180316]

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. En oral fastdosekombinasjon som omfatter 40 mg av N-(4-(1-(2,6-difluorbenzyl)-5-((dimetylamino)metyl)-3-(6-metoksy-3-pyridaziny)-2,4-diokso-
5 1,2,3,4-tetrahydrotieno[2,3-d]pyrimidin-6-yl)fenyl)-N'-metoksyurea eller en
tilsvarende mengde av et farmasøytisk akseptabelt salt derav, 0,1 mg til 2 mg av
østradiol, og 0,1 mg til 0,5 mg av noretindronacetat (NETA).
2. Den orale fastdosekombinasjonen i henhold til krav 1, hvor den orale fast-
10 dosekombinasjonen omfatter 1 mg av østradiol og 0,5 mg av noretindronacetat.
3. Den orale fastdosekombinasjonen i henhold til hvilket som helst foregående
krav for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av livmorsfibromer,
endometriose, kraftig menstruasjonsblødning assosiert med livmorsfibromer eller
15 endometriose, eller smerte assosiert med livmorsfibromer eller endometriose, i en
pre-menopausal kvinne.
4. Den orale fastdosekombinasjonen for anvendelse i henhold til krav 3, hvor
behandlingen omfatter å oralt administrere kombinasjonen til den pre-
20 menopausale kvinnen én gang daglig i minst 4 påfølgende uker.
5. Den orale fastdosekombinasjonen for anvendelse i henhold til krav 3 eller
krav 4, hvor behandlingen omfatter å oralt administrere kombinasjonen til den
pre-menopausale kvinnen én gang daglig i minst 24 påfølgende uker.
25
6. Den orale fastdosekombinasjonen for anvendelse i henhold til et hvilket som
helst av krav 3 til 5, hvor kombinasjonen er for anvendelse i behandlingen av
endometriose.
- 30 7. Den orale fastdosekombinasjonen for anvendelse i henhold til et hvilket som
helst av krav 3 til 6, hvor kombinasjonen er for anvendelse i behandlingen av
livmorsfibromer.

- 8.** Den orale fastdosekombinasjonen for anvendelse i henhold til et hvilket som helst av krav 3 til 7, hvor kombinasjonen er for anvendelse i behandlingen av kraftig menstruasjonsblødning assosiert med livmorsfibromer
- 5 **9.** Den orale fastdosekombinasjonen for anvendelse i henhold til et hvilket som helst av krav 3 til 7, hvor kombinasjonen er for anvendelse i behandlingen av kraftig menstruasjonsblødning og den pre-menopausale kvinnen har endometriose.
- 10 **10.** Den orale fastdosekombinasjonen for anvendelse i henhold til et hvilket som helst av krav 3 til 9, hvor kombinasjonen er for anvendelse i behandlingen av smerte assosiert med endometriose.
- 15 **11.** Den orale fastdosekombinasjonen for anvendelse i henhold til et hvilket som helst av krav 3 til 10, hvor administrering av kombinasjonen er én gang daglig i minst 48 påfølgende uker eller minst 96 påfølgende uker.
- 20 **12.** Den orale fastdosekombinasjonen for anvendelse i henhold til et hvilket som helst av krav 3 til 11, hvor kombinasjonen blir administrert før matinntak, for eksempel minst 30 minutter før spising eller mens individet er fastende.
- 25 **13.** Den orale fastdosekombinasjonen for anvendelse i henhold til et hvilket som helst av krav 3 til 12, hvor kombinasjonen er for anvendelse i behandlingen av smerte assosiert med endometriose og smerten er dyspareuni eller bekken smerter.
- 14.** Den orale fastdosekombinasjonen for anvendelse i henhold til krav 13, hvor kombinasjonen er for anvendelse i behandlingen av bekkensmerter assosiert med endometriose og bekkensmertene er dysmenoré.