(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
4. September 2008 (04.09.2008)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2008/104342 A1

(51) Internationale Patentklassifikation:
A61K 31/57 (2006.01) *A61P 15/00* (2006.01)
A61K 31/573 (2006.01)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2008/001451

(22) Internationales Anmeldedatum:
23. Februar 2008 (23.02.2008)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
07004202.3 1. März 2007 (01.03.2007) EP

(71) Anmelder *(für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US)*: **BAYER SCHERING PHARMA AKTIENGESELLSCHAFT** [DE/DE]; Müllerstrasse 170-178, 13353 Berlin (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder *(nur für US)*: **SEITZ, Christian** [DE/DE]; Lange Strasse 5, 15738 Zeuthen (DE). **WASSERFALL, Annemarie** [DE/DE]; Sperberstrasse 5, 13506 Berlin (DE). **ZIMMERMANN, Holger** [DE/DE]; Lessingstrasse 3a, 14612 Falkensee (DE).

(74) Anwalt: **CRAMER, Eva-Maria**; Jenapharm GmbH & Co. KG, Otto-Schott-Strasse 15, 07745 Jena (DE).

(81) Bestimmungsstaaten *(soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart)*: AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten *(soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart)*: ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, NO, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Erklärung gemäß Regel 4.17:
— *hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii)*

Veröffentlicht:
— *mit internationalem Recherchenbericht*
— *mit geänderten Ansprüchen*

(54) Title: PHARMACEUTICAL PREPARATION FOR THE ALLEVIATION OF ENDOMETRIOSIS

(54) Bezeichnung: PHARMAZEUTISCHE ZUBEREITUNG ZUR VERMINDERUNG DER ENDOMETRIOSE

(57) Abstract: A pharmaceutical composition for the treatment of endometriosis without loss of bone density comprises a gestagenic having an antiandrogenic effect, preferably 17α-cyanomethyl-17ß-hydroxy-estra-4,9-diene-3-one (Dienogest), cyproteronacetate or chlormadinonacetate at a daily dosage which is no more than two times the dosage required to suppress ovulation, together with one or a plurality of pharmaceutically acceptable adjuvants/carriers. The pharmaceutical composition according to the invention provides both the alleviation of endometriosis and the lack of a negative affect on bone metabolism and bone density, and is simultaneously able to keep the side effects known from conventional pharmaceuticals (such as hot flashes, acne, negative affects on the lipid profile) within tolerable limits. The pharmaceutical composition is thus suitable for long-term application.

(57) Zusammenfassung: Eine pharmazeutische Zusammensetzung zur Behandlung der Endometriose ohne Verringerung der Knochendichte enthält ein Gestagen mit antiand rogener Wirksamkeit, vorzugsweise 17α-Cyanomethyl-17-ß-hydroxyestra-4,9-dien-3on (Dienogest), Cyproteronacetat oder Chlormadinonacetat in einer täglichen Dosis, die maximal das zweifache der Ovulationshemmdosis beträgt, gemeinsam mit einem oder mehreren pharmazeutisch annehmbaren Hilfsstoffen/Trägern. Die erfindungsgemäße pharmazeutische Zusammensetzung realisiert sowohl die Verminderung der Endometriose als auch das Fehlen einer negativen Beeinflussung des Knochenstoffwechsels und der Knochendichte und vermag gleichzeitig die von den konventionellen Arzneimitteln bekannten Nebenwirkungen (z. B. Hitzewallungen, Akne, negative Beeinflussung des Lipidprofils) im erträglichen Maße zu halten. Die pharmazeutische Zusammensetzung ist daher für die Langzeitapplikation geeignet.

WO 2008/104342 A1