(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
5. Juni 2003 (05.06.2003)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 03/045419 A1

(51) Internationale Patentklassifikation[7]: A61K 38/09, 9/08, 47/26

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP02/12798

(22) Internationales Anmeldedatum:
15. November 2002 (15.11.2002)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
101 57 628.5 26. November 2001 (26.11.2001) DE

(71) Anmelder: **ZENTARIS AG** [DE/DE]; Weismüllerstrasse 45, 60314 Frankfurt (DE).

(72) Erfinder: **SARLIKIOTIS, Werner**; Sp. Dima 31, GR-190 02 Peania (GR). **BAUER, Horst**; Röhrenstrasse 12a, 91217 Hersbruck (DE). **RISCHER, Matthias**; Schlesierstrasse 20, 60388 Frankfurt (DE). **ENGEL, Jürgen**; Erlenweg 3, 63755 Alzenau (DE). **GÜTHLEIN, Frank**; Westendstrasse 5, 63477 Maintal (DE). **DI STEFANO, Dominique**; Am Börnchen 14, 65479 Raunheim (DE).

(81) Bestimmungsstaaten *(national)*: AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten *(regional)*: ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:
— *mit internationalem Recherchenbericht*

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

WO 03/045419 A1

(54) Title: INJECTION SOLUTION COMPRISING AN LHRH ANTAGONIST

(54) Bezeichnung: INJEKTIONSLÖSUNG EINES LHRH-ANTAGONISTEN

(57) Abstract: The aqueous injection solution comprising an LHRH antagonist contains in addition to the LHRH antagonist, such as cetrorelix, an organic, physiologically compatible acid and optionally a surfactant and also a framework builder. The LHRH antagonist has significantly improved solubility and can be prepared in higher concentrations and with an improved bioavailability. The aggregation tendency of the LHRH antagonist is significantly reduced.

(57) Zusammenfassung: Die wässrige Injektionslösung eines LHRH-Antagonisten enthält neben dem LHRH-Antagonisten, wie Cetrorelix eine organische, physiologisch verträgliche Säure, und ggf. ein Tensid sowie einen Gerüstbildner. Der LHRH-Antagonist weist eine deutlich verbesserte Löslichkeit auf, kann in einer höheren Konzentration und besseren Bioverfügbarkeit bereitgestellt werden. Die Aggregationsneigung des LHRH-Antagonisten wird deutlich herabgesetzt.