

(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
6. Oktober 2011 (06.10.2011)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2011/120925 A1

(51) Internationale Patentklassifikation:

A61K 9/00 (2006.01) *A61K 45/06* (2006.01)
A61K 31/00 (2006.01) *A61P 15/18* (2006.01)
A61K 31/4196 (2006.01) *A61P 15/00* (2006.01)
A61K 31/569 (2006.01)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2011/054737

(22) Internationales Anmeldedatum:
28. März 2011 (28.03.2011)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
102010003494.0 31. März 2010 (31.03.2010) DE

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

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **PAKKALIN, Arto** [FI/DE]; Leistikowstr. 6, 14050 Berlin (DE). **KNAUTH, Rudolf** [DE/DE]; Pirschgang 14 A, 16548 Glienicke (DE). **SCHMITZ, Heinz** [DE/DE]; Weimarische Str. 27/I, 10715 Berlin (DE). **TALLING, Christine** [FI/FI]; Hännikökatu 51, FI-20610 Turku (FI). **JUKARAINEN, Harri** [FI/FI]; Vadelmakatu 3, FI-21620 Kuusisto (FI). **KOROLAINEN, Henriikka** [FI/FI]; Loimijoenrantatie 10, FI-32210 Loimaa (FI).

(74) Anwalt: **BAYER PHARMA AKTIENGESELLSCHAFT**; Law and Patents, Patents and Licensing, Müller Strasse 178, 13353 Berlin (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, CL, 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, PE, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, 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, LR, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht (Artikel 21 Absatz 3)

(54) Title: PARENTERAL PHARMACEUTICAL FORM WHICH RELEASES AROMATSE INHIBITOR AND GESTAGENS, FOR THE TREATMENT OF ENDOMETRIOSIS

(54) Bezeichnung : PARENTERALE ARZNEIFORM, DIE AROMATASEHEMMER UND GESTAGENE FREISETZT, FÜR DIE BEHANDLUNG VON ENDOMETRIOSE

(57) Abstract: The subject of the present invention for the treatment of endometriosis is the provision of a parenteral pharmaceutical form (release system) for the controlled release of an aromatase inhibitor (AI) with a daily release rate which does not induce any stimulation of the ovaries by negative feedback of the hypophyseal-ovarian axis (which would induce the secretion of gonadotropins and the stimulation of the ovarian follicular growth), and of a gestagen with a daily release rate of below the ovulation-inhibitory dose, which provides a contraceptive effect based on local effects (for example the reduction and thickening of the cervical mucus to prevent the ascent of sperm, effects on the endometrium and on tubal motility in order to hinder the implantation and the transport of ova).

(57) Zusammenfassung: Der Inhalt der vorliegenden Erfindung für die Behandlung von Endometriose ist die Bereitstellung einer parenteralen Arzneiform (Abgabesystem) für die kontrollierte Freisetzung eines Aromatasehemmers (AI) mit einer täglichen Freisetzungsrate, die keine Stimulation der Ovarien durch negative Rückkopplung der Hypophysen-Ovar-Achse (die eine Sekretion von Gonadotropinen und Stimulation des ovariellen Follikelwachstums hervorrufen würde) induziert, und eines Gestagens mit einer täglichen Freisetzungsrate unterhalb der Ovulationshemmdosis, die eine empfängnisverhütende Wirkung auf der Grundlage lokaler Wirkungen bereitstellt (beispielsweise Verringern und Eindicken des Zervixschleims, um das Aufsteigen von Spermien zu behindern, Wirkungen auf das Endometrium und auf die Tubenmotilität, um die Implantation und der Transport von Eizellen zu behindern).

WO 2011/120925 A1