



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2646031 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/485 (2006.01)
A61K 31/137 (2006.01)
A61P 3/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21)	Translation Published	2017.06.19
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2017.02.22
(86)	European Application Nr.	11845186.3
(86)	European Filing Date	2011.12.02
(87)	The European Application's Publication Date	2013.10.09
(30)	Priority	2010.12.03, US, 419395 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
(73)	Proprietor	Orexigen Therapeutics, Inc., 3344 North Torrey Pines Court, Suite 200, La Jolla, CA 92037, US-USA
(72)	Inventor	FLANAGAN, Shawn, 14083 Via Corsini, San DiegoCA 92128, US-USA DUNAYEVICH, Eduardo, 1030 Deep Wood Drive, Westlake Village, CA 91362, US- USA

(54)	Title	INCREASING DRUG BIOAVAILABILITY IN NALTREXONE THERAPY
(56)	References Cited:	US-A1- 2008 058 407 US-A1- 2008 110 792 US-A1- 2008 113 026 US-A1- 2010 166 889 US-B2- 7 375 111 US-B2- 7 682 633 GREENWAY FRANK L. ET AL: "Comparison of Combined Bupropion and Naltrexone Therapy for Obesity with Monotherapy and Placebo", JOURNAL OF CLINICAL ENDOCRINOLOGY AND METABOLISM, vol. 94, no. 12, December 2009 (2009-12), pages 4898-4906, XP055100385, US ISSN: 0021-972X, DOI: 10.1210/jc.2009-1350 HAUSENLOY D J: "Contrave(TM): Novel treatment for obesity", CLINICAL LIPIDOLOGY 2009 FUTURE MEDICINE LTD. GBR, vol. 4, no. 3, June 2009 (2009-06), pages 279-285, XP009176559, ISSN: 1746-0875 JOHNSON FRANKLIN ET AL: "Food effects on the pharmacokinetics of morphine sulfate and naltrexone hydrochloride extended release capsules", ADVANCES IN THERAPY, vol. 27, no. 11, 14 October 2010 (2010-10-14), pages 846-858, XP055104393, ISSN: 0741-238X, DOI: 10.1007/s12325-010-0074-x MIDHA K K ET AL: "Exposure measures applied to the bioequivalence of two sustained release formulations of bupropion.", INTERNATIONAL JOURNAL OF CLINICAL PHARMACOLOGY AND THERAPEUTICS MAY 2005, vol. 43, no. 5, May 2005 (2005-05), pages 244-254, XP009176514, ISSN: 0946-1965 WADDEN ET AL.: 'Weight Loss with Naltrexone Sr/Bupropion Sr Combination Therapy as an Adjunct to Behavior Modification: The COR-BMOD Trial.' OBESITY vol. 19, no. 1, 17 June 2010,

pages 110 - 120, XP055100388

WILCOXA ET AL.: 'An open-label study of naltrexone and bupropion combination therapy for smoking cessation in overweight and obese subjects.' ADDICTIVE BEHAVIORS vol. 35, March 2010, pages 229 - 234, 230, XP026809862

GREENWAY ET AL.: 'Comparison of Combined Bupropion and Naltrexone Therapy for Obesity with Monotherapy and Placebo.' J CLIN ENDOCRINOL METAB vol. 94, no. 12, 2009, pages 4898 - 4906, XP055100385

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. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ved behandling av overvekt eller fedme omfattende en formulering med vedvarende frigivelse av naltrekson eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav samt en formulering med vedvarende frigivelse av bupropion eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, hvor nevnte sammensetning administreres i kombinasjon med mat.
2. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 1, hvor mengden av nevnte bupropion eller farmasøytisk akseptabelt salt derav er i området omkring 90 mg til omkring 360 mg per dag og mengden av naltrekson eller farmasøytisk akseptabelt salt derav er i området omkring 4 mg til omkring 32 mg per dag.
3. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 1, hvor nevnte naltrekson eller farmasøytisk akseptable salt derav omfatter en ikke-oppdelt formulering av naltrekson eller farmasøytisk akseptabelt salt derav.
4. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 1, hvor nevnte naltrekson eller farmasøytisk akseptable salt derav administreres samtidig med bupropion eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.
5. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 1, hvor nevnte naltrekson eller farmasøytisk akseptable salt derav administreres før eller etter bupropion eller farmasøytisk akseptable salt derav.
6. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge krav 1, hvor nevnte naltrekson eller farmasøytisk akseptable salt derav og nevnte bupropion eller farmasøytisk akseptable salt derav er i enhetsdoseform.
7. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, hvor nevnte mat omfatter et måltid med høyt fettinnhold.
8. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge ethvert av kravene 1 til 7, hvor nevnte mat omfatter et måltid valgt fra gruppen bestående av et moderat kaloririkt, moderat fettinnholdende måltid på omkring 575 kalorier og fett som utgjør omkring 23% av det totale kaloriinnholdet; et kaloririkt, høyt fettinnholdende måltid på omkring 1000 kalorier og fett som utgjør omkring 50% av det totale kaloriinnholdet; og et måltid som faller innenfor et område definert

av nevnte moderat kaloririke, moderat fettinneholdende måltid og nevnte høye kaloriinneholdende høyt fettinneholdende måltid.

9. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 8, hvor nevnte mat omfatter et moderat kaloriinneholdende, moderat fettinneholdende måltid.

10. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, hvor behandlingsskjemaet for nevnte naltrekson eller farmasøytisk akseptable salt derav og nevnte bupropion eller farmasøytisk akseptable salt derav er:

10 omkring 8 mg av nevnte naltrekson eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav og omkring 90 mg av nevnte bupropion eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for første behandlingsuke;

omkring 16 mg av nevnte naltrekson eller farmasøytisk akseptable salt derav og omkring 180 mg av nevnte bupropion eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for andre behandlingsuke;

15 omkring 24 mg av nevnte naltrekson eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav og omkring 270 mg av nevnte bupropion eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for tredje behandlingsuke; og

omkring 32 mg av nevnte naltrekson eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav og omkring 360 mg av nevnte bupropion eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for fjerde og enhver etterfølgende behandlingsuke.

20

11. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, hvor nevnte naltrekson eller farmasøytisk akseptable salt derav og nevnte bupropion eller farmasøytisk akseptable salt derav administreres som to 8 mg tabletter med vedvarende frigivelse av naltrekson to ganger daglig og to 90 mg tabletter med vedvarende frigivelse av bupropion to ganger daglig.

25

12. Farmasøytisk sammensetning for anvendelse ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, hvor nevnte naltrekson eller farmasøytisk akseptable salt derav og nevnte bupropion eller farmasøytisk akseptable salt derav administreres i minst 28 uker.

30

13. Farmasøytisk sammensetning ifølge et hvilket som helst av de foregående krav, hvor nevnte naltrekson eller farmasøytisk akseptable salt derav og nevnte bupropion eller farmasøytisk akseptable salt derav administreres i minst 56 uker.