



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 3866765 B1

NORWAY

(19) NO  
(51) Int Cl.  
**A61K 9/16 (2006.01)**  
**A61K 31/485 (2006.01)**  
**A61P 25/04 (2006.01)**

**Norwegian Industrial Property Office**

|      |                                                                            |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |
|------|----------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| (45) | Translation Published                                                      | 2024.04.08                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |
| (80) | Date of The European<br>Patent Office Publication of<br>the Granted Patent | 2024.02.07                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |
| (86) | European Application Nr.                                                   | 19874338.7                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |
| (86) | European Filing Date                                                       | 2019.10.15                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |
| (87) | The European Application's<br>Publication Date                             | 2021.08.25                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |
| (30) | Priority                                                                   | 2018.10.15, US, 201862745805 P                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |
| (84) | Designated Contracting<br>States:                                          | AL ; AT ; BE ; BG ; CH ; CY ; CZ ; DE ; DK ; EE ; ES ; FI ; FR ; GB ; GR ; HR ; HU ;<br>IE ; IS ; IT ; LI ; LT ; LU ; LV ; MC ; MK ; MT ; NL ; NO ; PL ; PT ; RO ; RS ; SE ; SI ;<br>SK ; SM ; TR                                                                                                                                               |
| (73) | Proprietor                                                                 | Chong Kun Dang Pharmaceutical Corp., 8, Chungjeong-ro Seodaemun-gu, Seoul<br>03742, Sør-Korea<br>Purdue Research Foundation, 1801 Newman Road, West Lafayette, Indiana 47906,<br>USA                                                                                                                                                            |
| (72) | Inventor                                                                   | YOON, Gwangheum, 3117 Courthouse Drive East 2A, West Lafayette, Indiana<br>47906, USA<br>SOH, Bong Kwan, 3117 Courthouse Drive East 2B, West Lafayette, Indiana 47906,<br>USA<br>OTTE, Andrew David, 4910 Hawthorne Ridge Drive, West Lafayette, Indiana 47906,<br>USA<br>PARK, Kinam, 3525 Wakefield Drive, West Lafayette, Indiana 47906, USA |
| (74) | Agent or Attorney                                                          | ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |

|      |                      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       |
|------|----------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| (54) | Title                | <b>INJECTABLE LONG-ACTING NALTREXONE MICROPARTICLE COMPOSITIONS</b>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
| (56) | References<br>Cited: | EP-B1- 1 786 400<br>CN-A- 1 415 294<br>CN-A- 101 700 226<br>US-A1- 2015 265 535<br>US-B2- 7 799 345<br>CN-C- 100 379 420<br>WO-A1-2009/058147<br>YAMAGUCHI K. ET AL.: "Biocompatibility studies of naltrexone sustained release formulations",<br>JOURNAL OF CONTROLLED RELEASE, ELSEVIER, AMSTERDAM, NL, vol. 19, no. 1-3, 1<br>March 1992 (1992-03-01), pages 299-314, XP023744411, ISSN: 0168-3659, DOI:<br>10.1016/0168-3659(92)90085-6 [retrieved on 1992-03-01] |

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. Injiserbar mikropartikkelformulering omfattende en mikropartikkel som inkluderer naltrekson og en biologisk nedbrytbar polymer,
- 5    hvor den biologisk nedbrytbare polymeren er poly(laktid-ko-glykolid) med et laktid:glykolid-forhold på 85:15, og hvor langvarig frigjøring av naltrekson er lenger enn 4 uker og opptil 100 dager.
2. Mikropartikkelformulering ifølge krav 1, hvor langvarig frigjøring av naltrekson er omtrent 8 uker til omtrent 12 uker.
- 10    3. Mikropartikkelformulering ifølge krav 1, hvor naltreksonet er i form av fri base, salt, solvat, kokrystall eller kombinasjoner derav.
4. Mikropartikkelformulering ifølge krav 1, hvor naltreksonet utgjør omtrent 20-40% (vekt/vekt) av
- 15    mikropartikkelen.
5. Mikropartikkelformulering ifølge krav 1, hvor den biologisk nedbrytbare polymeren har en antallsbasert gjennomsnittlig molekylvekt på 50.000 til 150.000 Dalton.
- 20    6. Mikropartikkelformulering ifølge krav 1, hvor mikropartikkelen blir administrert i et biokompatibelt vehikkel, som inkluderer et vannbasert vehikkel, et oljebasert vehikkel eller en kombinasjon derav, eventuelt hvor:
  - (i) det vannbaserte vehikkelet omfatter et tonisitetsmiddel så som natriumklorid, et
  - 25    viskositetsøkende middel så som natriumkarboksymetylcellulose, et fuktemiddel så som polysorbat, eller kombinasjoner derav; og/eller
  - (ii) det oljebaserte vehikkelet omfatter peanøttolje, sesamolje, bomullsfrøolje eller kombinasjoner derav.
- 30    7. Mikropartikkelformulering ifølge krav 1, hvor mikropartiklene har en partikkelstørrelse i området fra 25 til 125  $\mu\text{m}$ .

8. Injiserbar mikropartikkelformulering ifølge krav 1 for bruk ved behandling eller forebygging av sykdommer knyttet til misbruk eller overdoser av opioider, alkoholavhengighet eller smerte.

9. Fremgangsmåte for fremstilling av den injiserbare mikropartikkelformuleringen ifølge krav 1, hvor

5 fremgangsmåten omfatter å:

(a) blande en første fase omfattende polyvinylalkohol og et første løsemiddel, og en andre fase omfattende en biologisk nedbrytbar polymer, naltrekson og et andre løsemiddel for å fremstille en blanding, hvor den biologisk nedbrytbare polymeren er poly(laktid-ko-glykolid) med et laktid:glykolid-forhold på 85:15; og

10 (b) utføre en uttrekingsprosess på blandingen med vann eller en vandig løsning for å frembringe mikropartikler.

10. Fremgangsmåte ifølge krav 9, hvor det første løsemiddelet omfatter minst ett valgt fra gruppen bestående av vann, diklormetan-benzylalkohol og etylacetat.

15

11. Fremgangsmåte ifølge krav 9, hvor det andre løsemiddelet omfatter minst ett valgt fra gruppen bestående av diklormetan, benzylalkohol og etylacetat.

12. Fremgangsmåte ifølge krav 9, hvor den vandige løsningen omfatter minst én valgt fra gruppen bestående av polyvinylalkohol, diklormetan, benzylalkohol og etylacetat.

20

13. Fremgangsmåte ifølge krav 9, hvor fremgangsmåten videre omfatter et trinn (c) med å utføre en ytterligere uttrekingsprosess på mikropartiklene med en etanolisk vandig løsning etter trinn (b) med å utføre uttrekingsprosessen,

25 eventuelt hvor fremgangsmåten videre omfatter å tørke mikropartiklene, hvor tørkingen utføres etter trinn (b) med å utføre uttrekingsprosessen, etter trinn (c) med å utføre den ytterligere uttrekingsprosessen eller etter hvert av trinnene (b) og (c).