



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3884947 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

A61K 31/485 (2006.01)

A61K 45/06 (2006.01)

A61K 31/137 (2006.01)

A61P 3/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2024.03.04
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.11.15
(86)	European Application Nr.	21152314.7
(86)	European Filing Date	2011.12.02
(87)	The European Application's Publication Date	2021.09.29
(30)	Priority	2010.12.03, US, 41939510 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
(62)	Divided application	EP3222280, 2011.12.02
(73)	Proprietor	Nalpropion Pharmaceuticals LLC, 155 Franklin Rd, Suite 450, Brentwood, TN 37027, USA
(72)	Inventor	FLANAGAN, Shawn, 14083 Via Corsini, San Diego, CA California 92128, USA DUNAYEVICH, Eduardo, 1030 Deep Wood Drive, Westlake Village, CA California 91362, USA
(74)	Agent or Attorney	AWA NORWAY AS, Postboks 1052 Hoff, 0218 OSLO, Norge

(54) Title **INCREASING DRUG BIOAVAILABILITY IN NALTREXONE THERAPY**

(56) References
Cited:

US-B2- 7 682 633

US-B2- 7 375 111

US-A1- 2008 110 792

JOHNSON F. 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

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

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

GREENWAY F.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

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. En farmasøytisk sammensetning til anvendelse i terapi, omfattende formulering med vedvarende frigivelse av naltrekson eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav og en formulering med vedvarende frigivelse av bupropion
5 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav, der nevnte sammensetning administreres med mat.
2. Den farmasøytiske sammensetningen til anvendelse ifølge krav 1, der mengden av nevnte bupropion eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav er i
10 området på ca. 90 mg til ca. 360 mg per dag, og mengden av naltrekson eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav er i området på ca. 4 mg til ca. 32 mg per dag.
3. Den farmasøytiske sammensetningen til anvendelse ifølge krav 1, der nevnte naltrekson eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav omfatter en ikke-
15 sekvestrert formulering av naltrekson eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.
4. Den farmasøytiske sammensetningen til anvendelse ifølge krav 1, der nevnte naltrekson eller farmasøytisk akseptabelt salt derav administreres samtidig med bupropion eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.
20
5. Den farmasøytiske sammensetningen til anvendelse ifølge krav 1, der nevnte naltrekson eller farmasøytisk akseptabelt salt derav administreres før eller etter bupropion eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.
- 25 6. Den farmasøytiske sammensetningen til anvendelse ifølge krav 1, der nevnte naltrekson eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav og nevnte bupropion eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav er i en enkelt doseringsform.
7. Den farmasøytiske sammensetningen til anvendelse ifølge hvilket som helst
30 av de foregående kravene, der nevnte mat omfatter et fettriikt måltid.
8. Den farmasøytiske sammensetningen til anvendelse ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 7, der nevnte mat omfatter et måltid valgt fra gruppen bestående av et måltid med moderat kaloriinnhold, moderat fettinnhold på ca. 575 kalorier og
35 fett som utgjør ca. 23 % av det totale kaloriinnholdet; et måltid med høyt kaloriinnhold, høyt fettinnhold på ca. 1000 kalorier og fett som utgjør ca. 50 % av det totale kaloriinnholdet; og et måltid som faller innenfor et område definert av

nevnte måltid med moderat kaloriinnhold, moderat fettinnhold og nevnte måltid med høyt kaloriinnhold, høyt fettinnhold.

5 9. Den farmasøytiske sammensetningen til anvendelse ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 8, der nevnte mat omfatter et måltid med moderat kaloriinnhold, moderat fettinnhold.

10 10. Den farmasøytiske sammensetningen til anvendelse ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, der behandlingsplanen for nevnte naltrekson eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav og nevnte bupropion eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav er:

ca. 8 mg av nevnte naltrekson eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav og ca. 90 mg av nevnte bupropion eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for den første uken av behandlingen;

15 ca. 16 mg av nevnte naltrekson eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav og ca. 180 mg av nevnte bupropion eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for den andre uken av behandlingen;

ca. 24 mg av nevnte naltrekson eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav og ca. 270 mg av nevnte bupropion eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for den 20 tredje uken av behandlingen; og

ca. 32 mg av nevnte naltrekson eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav og ca. 360 mg av nevnte bupropion eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav for den fjerde og eventuelle etterfølgende uker av behandlingen.

25 11. Den farmasøytiske sammensetningen til anvendelse ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, der nevnte naltrekson eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav og nevnte bupropion eller et farmasøytisk akseptabelt 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.

30

12. Den farmasøytiske sammensetningen til anvendelse ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, der nevnte naltrekson eller et farmasøytisk akseptabelt

salt derav og nevnte bupropion eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav administreres i minst 28 uker.

5 13. Den farmasøytiske sammensetningen til anvendelse ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, der nevnte naltrekson eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav og nevnte bupropion eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav administreres i minst 56 uker.

10 14. Den farmasøytiske sammensetningen til anvendelse ifølge hvilket som helst av de foregående kravene, der sammensetningen er til anvendelse for å påvirke vekttap, redusere kardiovaskulære risikofaktorer, øke insulinfølsomhet, redusere mattrang, behandle viscerale fetttilstander, redusere vektøkning eller fremme vekttap under røykeslutt, og gi vekttapsterapi hos pasienter med alvorlig depresjon.