



(12) Translation of new
European patent specification
After opposition procedure

(11) NO/EP 2234617 B2

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.

A61K 31/519 (2006.01)

A61P 25/18 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.06.28
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.03.31
(45)	Decision of the opposition in EPO	2024.11.06
	Decision of the opposition in NIPO	2025.01.06
(86)	European Application Nr.	08863534.7
(86)	European Filing Date	2008.12.17
(87)	The European Application's Publication Date	2010.10.06
(30)	Priority	2007.12.19, US, 14918 P 2008.12.05, US, 120276 P
(84)	Designated Contracting States:	AT ; BE ; BG ; CH ; CY ; CZ ; DE ; DK ; EE ; ES ; FI ; FR ; GB ; GR ; HR ; HU ; IE ; IS ; IT ; LI ; LT ; LU ; LV ; MC ; MT ; NL ; NO ; PL ; PT ; RO ; SE ; SI ; SK ; TR
	Designated Extension States:	AL ; BA ; MK ; RS
(73)	Proprietor	Janssen Pharmaceutica NV, Turnhoutseweg 30, 2340 Beerse, Belgium
(72)	Inventor	KUSAMAKER, Vivek, *-*, deceased, Belgium VERMEULEN, An, Margriet, Cornelia, c/o Janssen Pharmaceutica NV Turnhoutseweg 30, B-2340 Beerse, Belgium WOUTERS, Alfons, Jeanne, c/o Janssen Pharmaceutica NV Turnhoutseweg 30, B- 2340 Beerse, Belgium GOPAL, Srihari, c/o Janssen Pharmaceutica NV PV 250 Turnhoutseweg 30, B-2340 Beerse, Belgium LEWYN-BRISCOE, Peter H., c/o Janssen Pharmaceutica NV PV 250 Turnhoutseweg 30, B-2340 Beerse, Belgium SAMTANI, Mahesh, c/o Janssen Pharmaceutica NV PV 250 Turnhoutseweg 30, B- 2340 Beerse, Belgium
(74)	Agent or Attorney	AWA NORWAY AS, Postboks 1052 Hoff, 0218 OSLO, Norge

(54)	Title	DOSING REGIMEN ASSOCIATED WITH LONG ACTING INJECTABLE PALIPERIDONE ESTERS
------	-------	--

(56) References

Cited:

US-A1- 2003 064 998

US-A1- 2007 197 591

LINDENMAYER P: "Synopsis R092670-PSY-3007", PHARMACEUTICAL JOHNSON, DEVELOPMENT RESEARCH, pages 1 - 8, [retrieved on 20211220]

ANONYMOUS: "A Study to Evaluate the Effectiveness and Safety of 3 Doses of Paliperidone Palmitate in Treating Subjects With Schizophrenia NCT00210548", CLINICALTRIALS.GOV NCT00210548, 11 October 2007 (2007-10-11), pages 1 - 6, Retrieved from the Internet <URL:https://clinicaltrials.gov/ct2/show/NCT00210548> [retrieved on 20210423]

CLETON A ET AL: "Effects of renal impairment on the pharmacokinetic profile of paliperidone extended-release tablets", CLINICAL PHARMACOLOGY & THERAPEUTICS, MOSBY-YEAR BOOK, ST LOUIS, MO, US, vol. 81, no. Suppl. 1, 1 March 2007 (2007-03-01), pages S63, XP009114090, ISSN: 0009-9236

KRAMER: "Efficacy and Tolerability of two fixed dosages of paliperidone palmitate in the treatment of schizophrenia: Results of A 9-week placebo-controlled trial", 20TH US PSYCHIATRIC AND MENTAL HEALTH CONGRESS, 14 October 2007 (2007-10-14) - 14 October 2007 (2007-10-14), pages 1 - 7

REVILL P ET AL: "Paliperidone - Antipsychotic agent, treatment of bipolar disorder, dual dopamine D2/5-HT2A receptor antagonist", DRUGS OF THE FUTURE, PROUS SCIENCE, ES, vol. 31, no. 7, 1 July 2006 (2006-07-01), pages 579 - 584, XP008096915, ISSN: 0377-8282

ANONYMOUS: "Gibaldi's Drug Delivery Systems", part Chapter 8 1 January 2007, AMERICAN SOCIETY OF HEALTH SYSTEM PHARMACISTS, article "Parenteral Drug Delivery", pages: 204 - 205

CLETON A ET AL: "Evaluation of the pharmacokinetic profile of gluteal versus deltoid intramuscular injections of paliperidone palmitate 100 mg equivalent in patients with schizophrenia.", CLINICAL PHARMACOLOGY & THERAPEUTICS, vol. 83, no. Suppl. 1, March 2008 (2008-03-01), & 109TH ANNUAL MEETING OF THE AMERICAN-SOCIETY-FOR-CLINICAL-PHARMACOLOGY-AND-THERAPEUTICS; ORLANDO, FL, USA; APRIL 02 -05, 2008, pages S31, ISSN: 0009-9236

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. Paliperidonpalmitat for anvendelse ved behandling av en psykiatrisk pasient med et doseringsregime omfattende:

5 (1) å administrere intramuskulært i deltoidmuskelen hos en pasient som har behov for behandling, en første initialdose på omkring 150 mg-eq. av paliperidon som paliperidonpalmitat formulert i en vedvarende frigjøringsformulering på første behandlingsdag;

10 (2) å administrere intramuskulært i deltoidmuskelen hos pasienten som har behov for behandling, en andre innlastingsdose på omkring 100 mg-eq. av paliperidon som paliperidonpalmitat formulert i en vedvarende frigjøringsformulering på åttende behandlingsdag og

15 (3) å administrere intramuskulært i deltoid- eller gluteal-muskelen hos pasienten som har behov for behandling, en vedlikeholdsdose på omkring 25 mg-eq til omkring 150 mg-eq. av paliperidon som paliperidonpalmitat i en vedvarende frigjøringsformulering på 36. behandlingsdag og

hvor den vedvarende frigjøringsformuleringen er en vandig nanopartikkelsuspensjon.

2. Paliperidonpalmitat for anvendelse ved behandling av en psykiatrisk pasient med et doseregime omfattende

20 (a) å administrere intramuskulært i deltoidmuskelen hos en pasient som har behov for behandling, en første tilføringsdose på omkring 150 mg-eq. av paliperidon som paliperidonpalmitat formulert i en vedvarende frigjøringsformulering på første dag av behandlingen;

25 (b) å administrere intramuskulært i deltoidmuskelen hos pasienten som har behov for behandling, en opprettholdelsesdose på omkring 100 mg-eq. av paliperidon som paliperidonpalmitat formulert i en vedvarende frigjøringsformulering på åttende behandlingsdag og

(c) å administrere i deltoidmuskelen hos pasienten som har behov for behandling, en opprettholdelsesdose på fra omkring 25 mg-eq. til omkring 100 mg-

eq. av paliperidon som paliperidonpalmitat formulert i en vedvarende frigjøringsformulering på 36. behandlingsdag og

hvor den vedvarende frigjøringsformulering er en vandig nanopartikkelsuspensjon.

- 5 3. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 2, hvor den psykiatriske pasient har behov for behandling for psykose.
4. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 2, hvor den psykiatriske pasienten har behov for behandling for schizofreni.
- 10 5. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 2, hvor den psykiatriske pasienten har behov for behandling for bipolar lidelse.
6. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 2, hvor den
- 15 psykiatriske pasienten har behov for behandling for en mental lidelse valgt fra gruppen bestående av schizofreni og schizoaffektiv lidelse.
7. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge krav 4 eller krav 6, hvor den psykiatriske pasienten har behov for behandling for en mental lidelse valgt fra
- 20 gruppen bestående av schizofeni, paranoid type, (295.30), schizofreni, disorganisert (295.10), schizofreni, katatonisk type, (295.20), schizofreni udifferensiert type (295.90), schizofreni, residual type (295.60) og schizofreniform lidelse (295.40).
- 25 8. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7, hvor den vandige nanopartikkelsuspensjonen omfatter nanopartikler, et overflateaktivt middel, et suspensjonsmiddel og eventuelt en eller flere ytterligere ingredienser valgt fra gruppen bestående av preservativer, buffere og isotoniserende midler.