



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3280392 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/00 (2006.01)
A61K 31/40 (2006.01)
A61K 31/4178 (2006.01)
A61K 31/439 (2006.01)
A61K 31/454 (2006.01)
A61K 31/473 (2006.01)
A61K 31/496 (2006.01)
A61K 31/5377 (2006.01)
A61K 31/573 (2006.01)
A61P 1/08 (2006.01)
A61P 43/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.07.05
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.02.24
(86)	European Application Nr.	16716659.4
(86)	European Filing Date	2016.04.11
(87)	The European Application's Publication Date	2018.02.14
(30)	Priority	2015.04.10, GB, 201506116
(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	Acacia Pharma Limited, The Officers' Mess Royston Road, DuxfordCambridge CB22 4QH, Storbritannia
(72)	Inventor	GILBERT, Julian Clive, c/o Acacia Pharma LimitedHarston Mill, HarstonCambridgeshire GB22 7GG, Storbritannia GRISTWOOD, Robert William, c/o Acacia Pharma LimitedHarston Mill, HarstonCambridgeshire GB22 7GG, Storbritannia FOX, Gabriel, c/o Acacia Pharma LimitedHarston Mill, HarstonCambridgeshire GB22 7GG, Storbritannia
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54)	Title	DOSAGE REGIMENS OF AMISULPRIDE FOR TREATING NAUSEA AND VOMITING
(56)	References Cited:	WO-A2-2011/110854 Anonymous: "EU Clinical Trials Register - EudraCT Number 2013-001635-51", , 19 August 2013 (2013-08-19), XP055271561, Retrieved from the Internet:

URL:<https://www.clinicaltrialsregister.eu/ctr-search/trial/2013-001635-51/DK> [retrieved on 2016-05-10]

Anonymous: "A trial of APD403 to prevent sickness caused by chemotherapy | Cancer Research UK", , 18 October 2013 (2013-10-18), XP055271599, Retrieved from the Internet:

URL:<http://www.cancerresearchuk.org/about-cancer/find-a-clinical-trial/a-trial-of-apd403-to-prevent-sickness-caused-by-chemotherapy#undefined> [retrieved on 2016-05-10]

MAGNANI M: "Amisulpride: Pharmacological and biochemical aspects", FARMACIA E CLINICA, IT, vol. 33, no. 3, 1 January 1994 (1994-01-01), pages 91-97, XP009151871, ISSN: 1123-1254

Anonymous: "Acacia Pharma Announces Positive Results From Phase 2a Nausea & Vomiting Study In Cancer Patients", , 1 October 2012 (2012-10-01), XP055271578, Retrieved from the Internet: URL:<http://www.acaciapharma.com/news/2012/10/acacia-pharma-announces-positive-results-from-phase-2a-nausea-vomiting-study-in-cancer-patients> [retrieved on 2016-05-10]

P. KRANKE ET AL: "I.V. APD421 (amisulpride) prevents postoperative nausea and vomiting: a randomized, double-blind, placebo-controlled, multicentre trial", BRITISH JOURNAL OF ANAESTHESIA., vol. 111, no. 6, 19 July 2013 (2013-07-19), pages 938-945, XP055271509, GB ISSN: 0007-0912, DOI: 10.1093/bja/aet251

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/>

3280392

1

Patentkrav

- 5 **1.** Ikke-IV-injiserbar formulering av amisulprid, for anvendelse i behandlingen eller forebyggingen av kjemoterapi- eller radioterapiindusert kvalme og/eller oppkast (CINV/RINV) i forsinket fase hos et individ, hvori individet mottar eller har mottatt et kjemoterapi- eller radioterapibehandlingsregime på dag 1, og hvori doseringsregimet omfatter administrering av en dose på 5-15 mg av det ikke-IV-injiserbare amisulpridet på hver av dag 2, 3 og 4, og videre hvori
- 10 individet mottar eller har mottatt et akutfase-antiemetikum på dag 1, hvori akutfase-antiemetikumet er et antiemetikum som er egnet for anvendelse i den akutte fasen av CINV eller RINV.
- 15 **2.** Ikke-IV-injiserbar formulering av amisulprid for anvendelse ifølge krav 1, hvori individet mottar eller har mottatt et akutfase-antiemetikum på dag 1, hvori akutfase-antiemetikumet er IV-amisulprid.
- 20 **3.** Ikke-IV-injiserbar formulering av amisulprid for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 2, hvori doseringsregimet i tillegg omfatter administreringen av minst én enhetsdose av et annet forsinket-fase-antiemetikum på dag 2, foretrukket på dag 2 og 3, og mer foretrukket på dag 2, 3 og 4, hvori det andre forsinket-fase-antiemetikumet er et antiemetikum som administreres i den forsinkede fasen av CINV eller RINV, foretrukket hvori det andre forsinket-fase-antiemetikumet er en 5HT₃-antagonist, en NK₁-antagonist eller et steroid.
- 25 **4.** Ikke-IV-injiserbar formulering av amisulprid for anvendelse ifølge et av kravene 1 til 3, hvori dosen på 5-15 mg av det ikke-IV-injiserbare amisulpridet omfatter 10 mg amisulprid, hvori amisulpridet er i formen av en racemisk blanding, eller 5 mg, hvori amisulpridet er i form av (S)-amisulprid.
- 30 **5.** Sett omfattende minst tre ikke-IV-injiserbare doser på 5-15 mg av amisulprid og minst én dose av et akutfase-antiemetikum for samtidig, separat eller sekvensiell anvendelse i behandlingen eller forebyggingen av kjemoterapi- eller radioterapiindusert kvalme og/eller oppkast (CINV/RINV)
- 35 hos et individ, hvori individet mottar eller har mottatt et kjemoterapi- eller radioterapibehandlingsregime, og hvori doseringsregimet omfatter administreringen av det eller hvert akutfase-antiemetikum på dag 1, der dag 1 er den samme dagen en kjemoterapi eller radioterapi administreres på, og administreringen av de ikke-IV-injiserbare dosene på 5-15 mg av amisulprid
- 40 på dag 2, 3 og 4, hvori akutfase-antiemetikumet er et antiemetikum som er egnet for anvendelse i den akutte fasen av CINV eller RINV.

3280392

2

6. Sett for anvendelse ifølge krav 5, hvori akutfase-antiemetikumet omfatter én eller flere av amisulprid, ondansetron, deksametason og aprepitant.

5 **7.** Sett for anvendelse ifølge krav 6, hvori akutfase-antiemetikumet omfatter en intravenøs formulering av amisulprid.

10 **8.** Sett for anvendelse ifølge krav 7, hvori en enhetsdose av akutfase-antiemetikumet omfatter 5 til 30 mg amisulprid, foretrukket 10 til 20 mg amisulprid, mer foretrukket 20 mg amisulprid.

15 **9.** Sett for anvendelse ifølge et av kravene 5-8, hvori settet i tillegg omfatter minsten enhetsdose av et annet forsinket-fase-antiemetikumsmiddel, og hvori doseringsregimet i tillegg omfatter administreringen av minst én enhetsdose av det andre forsinket-fase-antiemetikumsmiddelet på den samme dagen som minst én av, foretrukket hver av de ikke-IV-injiserbare enhetsdosene med amisulprid, hvori det forsinket-fase-antiemetikumet er et antiemetikum administrert i den forsinkede fasen av CINV eller RINV, foretrukket hvori det andre forsinket-fase-antiemetikumsmiddelet er en 5HT₃-antagonist, en NK₁-antagonist eller et steroid.

20 **10.** Sett for anvendelse ifølge et av kravene 5-9, hvori amisulpridet er i formen av en racemate.

25 **11.** Sett for anvendelse ifølge et av kravene 5-10, hvori de ikke-IV-injiserbare enhetsdosene av amisulprid skal administreres på subkutan, sublingual, rektal, intranasal, topisk, bukkal eller pulmonalinhalert vei, eller hvori de ikke-IV-injiserbare enhetsdosene av amisulprid skal administreres i en ikke-injiserbar formulering.

30 **12.** Sett for anvendelse ifølge et av kravene 5-10, hvori de ikke-IV-injiserbare enhetsdosene av amisulprid skal administreres i en oral formulering.

35 **13.** Sett for anvendelse ifølge et av kravene 5-12, hvori de ikke-IV-injiserbare dosene av amisulprid omfatter 10 mg amisulprid, hvori amisulpridet er i formen av en racemisk blanding eller 5 mg, hvori amisulpridet er i form av (S)-amisulprid.

40 **14.** Sett omfattende tre ikke-IV-injiserbare doser på 5-15 mg av amisulprid og en enkelt intravenøs dose av amisulprid, for anvendelse i behandlingen eller forebyggingen av kjemoterapi- eller radioterapiindusert kvalme og/eller oppkast i forsinket fase.

3280392

3

15. Sett for anvendelse ifølge krav 14, i tillegg omfattende minst én enhetsdose av et annet antiemetikumsmiddel, foretrukket hvori det andre antiemetikumsmiddelet er en 5HT₃-antagonist, en NK₁-antagonist eller et steroid.

5