



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 3744326 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

A61K 31/519 (2006.01)

A61P 25/18 (2006.01)

A61K 9/00 (2006.01)

A61P 25/24 (2006.01)

A61K 9/10 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

|      |                                                                            |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |
|------|----------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| (45) | Translation Published                                                      | 2024.01.22                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |
| (80) | Date of The European<br>Patent Office Publication of<br>the Granted Patent | 2023.12.06                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |
| (86) | European Application Nr.                                                   | 20169861.0                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |
| (86) | European Filing Date                                                       | 2016.03.30                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |
| (87) | The European Application's<br>Publication Date                             | 2020.12.02                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |
| (30) | Priority                                                                   | 2015.04.07, US, 201562144054 P<br>2015.05.15, US, 201562162596 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                                                                                                                          |
|      | Designated Extension<br>States:                                            | BA ; ME                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    |
|      | Designated validation<br>states                                            | MA ; MD                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    |
| (62) | Divided application                                                        | EP3280416, 2016.03.30                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |
| (73) | Proprietor                                                                 | Janssen Pharmaceutica NV, Turnhoutseweg 30, 2340 Beerse, Belgium                                                                                                                                                                                                                                                           |
| (72) | Inventor                                                                   | GOPAL, Srihari, 1125 Trenton-Harbourton Road, Titusville, NJ New Jersey 08560,<br>USA<br>RAVENSTIJN, Paulien Gerarda Maria, Turnhoutseweg 30, B-2340 Beerse,, Belgium<br>RUSSU, Alberto, Turnhoutseweg 30, B-2340 Beerse,, Belgium<br>SAMTANI, Mahesh Narain, 920 Route 202 Raritan, Raritan,, NJ New Jersey 08869,<br>USA |
| (74) | Agent or Attorney                                                          | AWA NORWAY AS, Postboks 1052 Hoff, 0218 OSLO, Norge                                                                                                                                                                                                                                                                        |

(54) Title **DOSING REGIMEN FOR MISSED DOSES FOR LONG-ACTING INJECTABLE  
PALIPERIDONE ESTERS**

(56) References

Cited:

US-A1- 2011 105 536, US-A1- 2009 163 519  
PIERRE CHUE ET AL: "A review of paliperidone palmitate", EXPERT REVIEW OF  
NEUROTHERAPEUTICS, vol. 12, no. 12, 9 December 2012 (2012-12-09), pages 1383-1397,  
XP055525726, GB ISSN: 1473-7175, DOI: 10.1586/ern.12.137  
FDA: "HIGHLIGHTS OF PRESCRIBING INFORMATION INVEGA TRINZATM", , 1 May 2015  
(2015-05-01), 21 January 2021 (2021-01-21), XP093007896, Retrieved from the Internet:  
URL:https://www.accessdata.fda.gov/drugsatfda\_docs/label/2015 [retrieved on 2021-01-21]  
SRIHARI GOPAL ET AL: "Practical guidance for dosing and switching from paliperidone  
palmitate 1 monthly to 3 monthly formulation in schizophrenia", CURRENT MEDICAL  
RESEARCH AND OPINION, vol. 31, no. 11, 2 October 2015 (2015-10-02), pages 2043-2054,  
XP055627208, GB ISSN: 0300-7995, DOI: 10.1185/03007995.2015.1085849 [retrieved on 2021-  
01-21]

RICHARD H OSBORNE ET AL: "Health-related quality of life advantage of long-acting injectable antipsychotic treatment for schizophrenia: a time trade-off study", HEALTH AND QUALITY OF LIFE OUTCOMES, BIOMED CENTRAL, LONDON, GB, vol. 10, no. 1, 2 April 2012 (2012-04-02), page 35, XP021095723, ISSN: 1477-7525, DOI: 10.1186/1477-7525-10-35

JORIS BERWAERTS ET AL: "Efficacy and Safety of the 3-Month Formulation of Paliperidone Palmitate vs Placebo for Relapse Prevention of Schizophrenia : A Randomized Clinical Trial", JAMA PSYCHIATRY, vol. 72, no. 8, 25 March 2015 (2015-03-25) , page 830, XP055525842, ISSN: 2168-622X, DOI: 10.1001/jamapsychiatry.2015.0241

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. Injiserbart paliperidonpalmitatdepot for anvendelse i en fremgangsmåte ved behandling av en pasient som har behov for psykiatrisk behandling av psykose, schizofreni eller bipolar forstyrrelse som har blitt behandlet med en injiserbar 3-  
5 måneders suspensjon av paliperidonpalmitat med forlenget frigivning, hvor 4 måneder eller mer og opptil ni måneder har har gått siden forrige injeksjon av den injiserbare 3-måneders suspensjonen av paliperidonpalmitat med forlenget frigivning, ved et doseringsregime som omfatter å:
  - (1) administrere en første startdose for reinitiering, av en 1-måneders injiserbar  
10 paliperidonpalmitatsuspensjon med forlenget frigivning, intramuskulært i deltamuskelen av pasienten;
  - (2) administrere en andre startdose for reinitiering, av en 1-måneders injiserbar paliperidonpalmitatsuspensjon med forlenget frigivning, intramuskulært i deltamuskelen av pasienten, på ca. dag 4 til ca. dag 12 etter administrasjonen av  
15 den første startdose for reinitiering; og
  - (3) administrere en reinitieringsdose av en 3-måneders injiserbar paliperidonpalmitatsuspensjon med forlenget frigivning, intramuskulært i deltamuskelen eller setemuskelen av pasienten, i området fra ca. 175 mg ekv. til ca. 525 mg ekv. På ca. dag 23 til ca. dag 37 etter administrasjon av den andre  
20 startdose av månedlig injiserbart paliperidonpalmitat for reinitiering, hvor nevnte første og andre startdose for reinitiering og dosen av 3-måneders reinitieringsformuleringen av paliperidonpalmitat er valgt fra tabellen nedenfor basert på størrelsen av den missede dosen

| Misset PP3M-dose | Administrer PP1M, to doser (i deltamuskelen) |                         | Administrer deretter PP3M (i delta- eller setemuskelen) |
|------------------|----------------------------------------------|-------------------------|---------------------------------------------------------|
|                  | Første reinitieringsdose                     | Andre reinitieringsdose | Reinitiering av 3-måneders formulerings-dose            |
| 175 mg ekv.      | 50 mg ekv.                                   | 50 mg ekv.              | 175 mg ekv.                                             |
| 263 mg ekv.      | 75 mg ekv.                                   | 75 mg ekv.              | 263 mg ekv.                                             |
| 350 mg ekv.      | 100 mg ekv.                                  | 100 mg ekv.             | 350 mg ekv.                                             |
| 525 mg ekv.      | 100 mg ekv.                                  | 100 mg ekv.             | 525 mg ekv.                                             |

2. Injiserbart paliperidonpalmitatdepot for anvendelse ifølge krav 1, hvor nevnte pasient har behov for behandling av psykose.
3. Injiserbart paliperidonpalmitatdepot for anvendelse ifølge krav 1, hvor nevnte pasient har behov for behandling av schizofreni.
- 5 4. Injiserbart paliperidonpalmitatdepot for anvendelse ifølge krav 1, hvor nevnte pasient har behov for behandling av bipolar forstyrrelse.
5. Injiserbart paliperidonpalmitatdepot for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 eller 3, hvor schizofrenien er en tilstand som er ført opp i DSM-IV-TR i kategori 295.xx.
- 10 6. Injiserbart paliperidonpalmitatdepot for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1 eller 4, hvor den bipolare forstyrrelse er en tilstand som er ført opp i DSM-IV-TR i kategori 296.xx.
7. Injiserbart paliperidonpalmitatdepot for anvendelse ifølge et hvilket som helst av de forutgående krav, hvor det injiserbare paliperidonpalmitatdepot er  
15 formulert i en vandig bærer.