



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 4005555 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

A61K 9/00 (2006.01)

A61K 9/10 (2006.01)

A61K 31/519 (2006.01)

A61K 47/26 (2006.01)

A61P 25/18 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2024.08.19
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2024.05.15
(86)	European Application Nr.	21210307.1
(86)	European Filing Date	2021.11.24
(87)	The European Application's Publication Date	2022.06.01
(30)	Priority	2020.11.30, US, 202063119305 P 2021.08.27, US, 202163237883 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
	Designated Extension States:	BA; ME
	Designated validation states	KH; MA; MD; TN
(73)	Proprietor	Janssen Pharmaceutica NV, Turnhoutseweg 30, 2340 Beerse, Belgium
(72)	Inventor	D'HOORE, Peter, 2340 Beerse, Belgium WALLAERT, Ignace, 2340 Beerse, Belgium NGUYEN, Jimmy, Milpitas, 95035, USA MEEUSSEN, Frank, 2340 Beerse, Belgium GOPAL, Srihari, Titusville, 08560, USA
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54) Title **METHODS FOR ENSURING RESUSPENSION OF PALIPERIDONE PALMITATE FORMULATIONS**

(56) References
Cited: WO-A2-2016/199170
 US-B2- 10 143 693
 EP-B1- 3 311 374
 Anonymous: "INVEGA SUSTENNA (paliperidone palmitate) extended-release injectable suspension, for intramuscular use", , 1 June 2017 (2017-06-01), XP055548926, Retrieved from the Internet: URL:https://www.accessdata.fda.gov/drugsatfda_docs/label/2017/022264s023lbl.pdf [retrieved on 2019-01-29]
 Janssen Pharmaceuticals ET AL: "INVEGA TRINZA®", , 15 March 2016 (2016-03-15), pages 1-16, XP055845012, Retrieved from the Internet: URL:https://web.archive.org/web/20160315102845if_/https://www.janssenmd.com/pdf/inve_ga-trinza/INVEGA-TRINZA_PI.pdf [retrieved on 2021-09-27]
 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

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. Fremgangsmåte for forbedring av resuspenderbarheten til en paliperidonpalmitat-injeksjonssuspensjon med forlenget frisetting i en sprøyte omfattende opprettholdelse av sprøyten i en ønsket orientering under transportering av sprøyten
5 som varierer fra orienteringen av sprøyten under lagring før transport, hvori lagringsorienteringen før transport var med spissen ned, og transporteringsorienteringen er i det vesentlige horisontal.
2. Fremgangsmåten ifølge krav 1, hvori opprettholdelse av sprøyten i den ønskede
10 transporteringsorienteringen omfatter lastning av sprøyten på et transportkjøretøy i den ønskede orienteringen, overvåking av sprøyten under transportering for å bekrefte opprettholdelse av den ønskede orienteringen, eller begge deler.
3. Fremgangsmåten ifølge krav 1 eller krav 2, som ytterligere omfatter romming av
15 sprøyten i en beholder omfattende en ytre overflate som bærer instruksjoner for opprettholdelse av beholderen under transportering i en orientering som tilsvarer den ønskede orienteringen av sprøyten.
4. Fremgangsmåten ifølge et hvilket som helst av kravene 1–3, som ytterligere
20 omfatter romming av sprøyten i en beholder omfattende en ytre overflate som bærer markeringer som indikerer en orientering av beholderen som tilsvarer opprettholdelse av den ønskede orienteringen.
5. Fremgangsmåten ifølge et hvilket som helst av kravene 1–4, hvori sprøyten
25 transporteres med fly, lastebil, båt eller jernbane.
6. Fremgangsmåten ifølge et hvilket som helst av kravene 1–5, hvori sprøyten, etter transporteringen, inneholder ikke mer enn ca. 1,5 mm rest som representerer ikke-suspendert paliperidonpalmitat etter administrering.
30
7. Fremgangsmåten ifølge et hvilket som helst av kravene 1–6, hvori sprøyten, etter transporteringen, inneholder ikke mer enn ca. 1 mm rest som representerer ikke-

suspendert paliperidonpalmitat etter administrering.

- 5 **8.** Fremgangsmåten ifølge et hvilket som helst av kravene 1–7, hvori sprøyten har en kapasitet på 1 ml, 2,25 ml, 2,8 ml eller 3 ml og inkluderer en 22 gauges nål som er 1 eller 1,5 tommer lang.
- 9.** Fremgangsmåten ifølge et hvilket som helst av kravene 1–7, hvori sprøyten har en kapasitet på 5 ml, og inkluderer en 20 gauges nål som er 1,5 tommer lang.
- 10 **10.** Fremgangsmåten ifølge et hvilket som helst av kravene 1–9, hvori suspensjonen inneholder ca. 273, 410, 546 eller 819 mg paliperidonpalmitat.
- 11.** Fremgangsmåten ifølge et hvilket som helst av kravene 1–9, hvori suspensjonen inneholder ca. 1092 eller 1560 mg paliperidonpalmitat.
- 15 **12.** Fremgangsmåten ifølge et hvilket som helst av kravene 1–11, hvori suspensjonen omfatter ca. 312 mg/ml paliperidonpalmitat.
- 13.** Fremgangsmåten ifølge et hvilket som helst av kravene 1–11, hvori
20 paliperidonpalmitat-injeksjonssuspensjonen med forlenget frisetting omfatter:
ca. 200 mg/ml til ca. 500 mg/ml paliperidonpalmitat;
ca. 2 mg/ml til ca. 25 mg/ml av et fuktemiddel;
ca. 2,5 mg/ml til ca. 50 mg/ml av et bufringsmiddel;
ca. 25 mg/ml til ca. 150 mg/ml av et suspensjonsmiddel; og
25 vann q.s. ad 100 %.
- 14.** Fremgangsmåten ifølge et hvilket som helst av kravene 1–11, hvori
paliperidonpalmitat-injeksjonssuspensjonen med forlenget frisetting omfatter:
30 ca. 250 mg/ml til ca. 400 mg/ml paliperidonpalmitat;
ca. 5 mg/ml til ca. 20 mg/ml av et fuktemiddel;
ca. 5 mg/ml til ca. 25 mg/ml av et bufringsmiddel;
ca. 50 mg/ml til ca. 100 mg/ml av et suspensjonsmiddel; og

vann q.s. ad 100 %.

- 15.** Fremgangsmåten ifølge et hvilket som helst av kravene 1–11, hvori
5 paliperidonpalmitat-injeksjonssuspensjonen med forlenget frisetting omfatter:
ca. 280 mg/ml til ca. 350 mg/ml paliperidonpalmitat;
ca. 8 mg/ml til ca. 12 mg/ml av et fuktemiddel;
ca. 5 mg/ml til ca. 15 mg/ml av et bufringsmiddel;
ca. 65 mg/ml til ca. 85 mg/ml av et suspensjonsmiddel; og
10 vann q.s. ad 100 %.

- 16.** Fremgangsmåten ifølge et hvilket som helst av kravene 1–11, hvori
15 paliperidonpalmitat-injeksjonssuspensjonen med forlenget frisetting omfatter:
ca. 312 mg/ml paliperidonpalmitat;
ca. 10 mg/ml polysorbat 20;
ca. 75 mg/ml polyetylen glykol 4000;
ca. 7,5 mg/ml sitronsyre-monohydrat;
ca. 6 mg/ml natriumdihydrogenfosfat-monohydrat;
20 ca. 5,4 mg/ml natriumhydroksid; og
vann for injeksjon.