



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 4025187 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 9/00 (2006.01)
A61K 9/10 (2006.01)
A61K 31/519 (2006.01)
A61P 25/18 (2006.01)
A61P 25/24 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2024.02.26
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2024.01.03
(86)	European Application Nr.	21724651.1
(86)	European Filing Date	2021.05.07
(87)	The European Application's Publication Date	2022.07.13
(30)	Priority	2020.11.30, US, 202063119382 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	GOPAL, Srihari, Titusville, NJ 08560, USA VENKATASUBRAMANIAN, Raja, Titusville, NJ 08560, USA T'JOLLYN, Huybrecht, 2340 Beerse, Belgium
(74)	Agent or Attorney	AWA NORWAY AS, Postboks 1052 Hoff, 0218 OSLO, Norge

(54)	Title	DOSING REGIMENS ASSOCIATED WITH EXTENDED RELEASE PALIPERIDONE INJECTABLE FORMULATIONS
(56)	References Cited:	WO-A1-2016/157061 US-A1- 2017 281 629 US-A1- 2019 183 896 US-B2- 10 143 693 Anonymous: "Invega Sustenna Reference ID: 3657038", Invega, 1 November 2014 (2014-11-01), pages 1-56, XP055780705, Retrieved from the Internet: URL: https://www.accessdata.fda.gov/drugsat_fda_docs/label/2014/022264s013s014lbl.pdf [retrieved on 2021-03-01]

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 i en fremgangsmåte ved behandling av psykose, schizofreni, schizoaffektiv lidelse, schizofreniform lidelse eller bipolar lidelse, hvilken fremgangsmåte omfatter å administrere paliperidonpalmitat til en
5 pasient som har behov for det, som har fått administrert en første dose av en injiserbar suspensjon med forlenget frigivning av paliperidonpalmitat som har et seks-måneders doseringsintervall (PP6M), hvor fremgangsmåten omfatter å administrere en andre dose av den injiserbare suspensjon med forlenget frigivning av paliperidonpalmitat til en deltamuskel eller setemuskel av pasienten opptil to
10 uker før eller tre uker etter et tidspunkt som er seks måneder etter administrasjon av den første dose, hvor det ikke er noen mellomliggende dose av paliperidonpalmitat mellom den første dosen og den andre dosen,

hvor den injiserbare suspensjon med forlenget frigivning av paliperidonpalmitat omfatter omtrent 312 mg/mL paliperidonpalmitat,

15 hvor den injiserbare suspensjon med forlenget frigivning av paliperidonpalmitat er en vandig sammensetning som ytterligere omfatter et suspensjonsmiddel, en buffer og valgfritt ett eller flere av et konserveringsmiddel og et isotoniserende middel,

hvor den første dose omfatter omtrent 1092 mg paliperidonpalmitat eller omtrent 1560 mg paliperidonpalmitat; og

20 hvor den andre dose omfatter omtrent 1092 mg paliperidonpalmitat eller omtrent 1560 mg paliperidonpalmitat.
2. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge krav 1, hvor den andre dose administreres til setemuskelen.
3. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge krav 1 eller krav 2, hvor pasienten
25 har en stabil plasmakonsentrasjon av paliperidon på tidspunktet for den første dose.
4. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-3, hvor fremgangsmåten er en fremgangsmåte ved behandling av schizofreni.

5. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge et hvilket som helst av de forutgående krav, hvor den første dose og den andre dose hver omfatter omtrent 1092 mg paliperidonpalmitat.
6. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1-4, hvor den første dose og den andre dose hver omfatter omtrent 1560 mg paliperidonpalmitat.
7. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge et hvilket som helst av de forutgående krav, hvor plasmakonsentrasjonen av paliperidon i pasienten er omtrent 5 til omtrent 50 ng/mL på tidspunktet for den andre dose.
8. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge krav 7, hvor når den første dose omfatter 1092 mg paliperidonpalmitat, er plasmakonsentrasjonen av paliperidon i pasienten omtrent 5 til omtrent 30 ng/mL på tidspunktet for den andre dose.
9. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge krav 7, hvor når den første dose omfatter 1560 mg paliperidonpalmitat, er plasmakonsentrasjonen av paliperidon i pasienten omtrent 9 til omtrent 40 ng/mL på tidspunktet for den andre dose.
10. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge et hvilket som helst av de forutgående krav, hvor plasmakonsentrasjonen av paliperidon når en topp ved omtrent 10 til omtrent 150 ng/mL etter administrasjon av den andre dose.
11. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge krav 10, hvor når den første dose er 1092 mg paliperidonpalmitat, når plasmakonsentrasjonen av paliperidon i pasienten en topp ved omtrent 10 til omtrent 125 ng/mL etter administrasjon av den andre dose.
12. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge krav 10, hvor når den første dose er 1560 mg paliperidonpalmitat, når plasmakonsentrasjonen av paliperidon i pasienten en topp ved omtrent 35 til omtrent 145 ng/mL etter administrasjon av den andre dose.
13. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge et hvilket som helst av de forutgående krav, hvor den injiserbare suspensjon med forlenget frigivning av paliperidonpalmitat omfatter:

omtrent 312 mg/mL paliperidonpalmitat;

omtrent 8 mg/mL til omtrent 12 mg/mL fuktemiddel;

ett eller flere buffermidler;

omtrent 65 mg/mL til omtrent 85 mg/mL suspensjonsmiddel; og

5 water q.s. ad 100%.

14. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge krav 13, hvor suspensionen er fra omtrent pH 6,0 til omtrent pH 8,0.

15. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge krav 13 eller krav 14, hvor
10 buffermidlet eller buffermidlene omfatter sitronsyremonohydrat, natrium-
dihydrogenfosfatmonohydrat, dinatriumhydrogenfosfatanhydrid eller natrium-
hydroksid.

16. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge krav 13, hvor den injiserbare suspensjon med forlenget frigivning av paliperidonpalmitat omfatter:

omtrent 312 mg/mL paliperidonpalmitat;

15 omtrent 10 mg/mL polysorbat 20; og

omtrent 75 mg/mL polyetylenglykol 4000.