



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 4025188 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	2024.03.25
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2024.01.10
(86)	European Application Nr.	21724652.9
(86)	European Filing Date	2021.05.07
(87)	The European Application's Publication Date	2022.07.13
(30)	Priority	2020.11.30, US, 202063119405 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 pasient som har behov for det, som har fått administrert en første dose av en første injiserbar suspensjon med forlenget frigivning av paliperidonpalmitat som har et seks-måneders doseringsintervall ("PP6M") (første suspensjon), omfattende å:
- administrere i en deltamuskel av pasienten en re-initierende startdose av en andre injiserbar suspensjon med forlenget frigivning av paliperidonpalmitat som har et én-måneders doseringsintervall ("PP1M") (andre suspensjon) på et tidspunkt som er mer enn seks måneder og tre uker etter administrasjon av nevnte første dose av den første suspensjon, men mindre enn åtte måneder etter administrasjon av nevnte første dose av den første suspensjon; og
- administrere i deltamuskel eller setemuskel av pasienten en vedlikeholdsdose av den første suspensjon på et tidspunkt som er én måned (± 7 dager) etter administrasjonen av den re-initierende startdose av den andre suspensjon,
- hvor det ikke er noen mellomliggende doser av paliperidonpalmitat mellom den første dose og den re-initierende startdose,
- hvor nevnte PP6M (første suspensjon) omfatter omtrent 312 mg/mL paliperidonpalmitat;
- hvor nevnte PP1M (andre suspensjon) omfatter omtrent 156 mg/mL paliperidonpalmitat;
- hvor de injiserbare suspensjon er med forlenget frigivning av paliperidonpalmitat er vandige sammensetninger som ytterligere omfatter et suspensjonsmiddel, en buffer og valgfritt ett eller flere konserveringsmidler og/eller isotoniserende midler, og
- hvor enten
- (i) den første dose av den første suspensjon omfatter omtrent 1092 mg paliperidonpalmitat; den re-initierende startdose av den andre suspensjon omfatter

omtrent 156 mg paliperidonpalmitat; og vedlikeholdsdosen av den første suspensjon omfatter omtrent 1092 mg paliperidonpalmitat, eller

- (ii) den første dose av den første suspensjon omfatter omtrent 1560 mg paliperidonpalmitat; den re-initierende startdose av den andre suspensjon omfatter omtrent 234 mg paliperidonpalmitat; og vedlikeholdsdosen av den første suspensjon omfatter omtrent 1560 mg paliperidonpalmitat.

2. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge krav 1, hvor den første dose av den første suspensjon omfatter omtrent 1092 mg paliperidonpalmitat; den re-initierende startdose av den andre suspensjon omfatter omtrent 156 mg paliperidonpalmitat; og vedlikeholdsdosen av den første suspensjon omfatter omtrent 1092 mg paliperidonpalmitat.

3. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge krav 1, hvor den første dose av den første suspensjon omfatter omtrent 1560 mg paliperidonpalmitat; den re-initierende startdose av den andre suspensjon omfatter omtrent 234 mg paliperidonpalmitat; og vedlikeholdsdosen av den første suspensjon omfatter omtrent 1560 mg paliperidonpalmitat.

4. 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 pasient som har behov for det, som har fått administrert en første dose av en første injiserbar suspensjon med forlenget frigivning av paliperidonpalmitat som har et seks-måneders doseringsintervall ("PP6M") (første suspensjon), omfattende å:

administrere til deltamuskel av pasienten en første re-initieringsstartdose med omtrent 156 mg paliperidonpalmitat av en andre injiserbar suspensjon med forlenget frigivning av paliperidonpalmitat som har et én-måneders doseringsintervall ("PP1M") (andre suspensjon) på et tidspunkt som er fra 8 måneder opptil og inkluderende 11 måneder etter administrasjon av den første dose av den første suspensjon;

administrere i deltamuskel av pasienten en andre re-initieringsstartdose med omtrent 156 mg paliperidonpalmitat av den andre suspensjon på dag 8 (± 4 dager) etter administrasjonen av den første re-initieringsstartdose av den andre suspensjon; og

administrere i deltamuskel eller setemuskel av pasienten en vedlikeholdsdose av den første suspensjon 1 måned (± 7 dager) etter administrasjonen av den andre re-initieringsstartdose av den andre suspensjon,

5 hvor det ikke er noen mellomliggende doser av paliperidonpalmitat mellom den første dose og den første re-initieringsstartdose,

hvor nevnte PP6M (første suspensjon) omfatter omtrent 312 mg/mL paliperidonpalmitat;

hvor nevnte PP1M (andre suspensjon) omfatter omtrent 156 mg/mL paliperidonpalmitat;

10 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 konserveringsmidler og/eller isotoniserende midler, og

hvor enten

15 (i) den første dose av den første suspensjon omfatter omtrent 1092 mg paliperidonpalmitat og vedlikeholdsdosen av den første suspensjon omfatter omtrent 1092 mg paliperidonpalmitat, eller

(ii) den første dose av den første suspensjon omfatter omtrent 1560 mg paliperidonpalmitat og vedlikeholdsdosen av den første suspensjon omfatter omtrent 1560 mg paliperidonpalmitat.

20 5. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge krav 4, hvor den første dose av den første suspensjon omfatter omtrent 1092 mg paliperidonpalmitat og vedlikeholdsdosen av den første suspensjon omfatter omtrent 1092 mg paliperidonpalmitat.

25 6. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge krav 4, hvor den første dose av den første suspensjon omfatter omtrent 1560 mg paliperidonpalmitat og vedlikeholdsdosen av den første suspensjon omfatter omtrent 1560 mg paliperidonpalmitat.

7. 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 pasient som har behov for det, som har fått administrert en første dose av en første
5 injiserbar suspensjon med forlenget frigivning av paliperidonpalmitat som har et seks-måneders doseringsintervall ("PP6M") (første suspensjon), omfattende å:

(1) administrere i deltamuskel av pasienten en første re-initieringsstartdose med omtrent 234 mg paliperidonpalmitat av en andre injiserbar suspensjon med forlenget frigivning av paliperidonpalmitat som har et én-måneders doseringsintervall
10 ("PP1M") (andre suspensjon) på et tidspunkt som er mer enn 11 måneder etter administrasjon av den første dose av den første suspensjon;

(2) administrere i deltamuskel av pasienten en andre re-initieringsstartdose med omtrent 156 mg paliperidonpalmitat av den andre suspensjon på dag 8 (± 4 dager) etter administrasjonen av den første re-initieringsstartdose av den andre
15 suspensjon;

(3) administrere i deltamuskel eller setemuskel av pasienten en første re-initieringsvedlikeholdsdose med omtrent 39 mg til omtrent 234 mg paliperidonpalmitat av den andre suspensjon 1 måned (± 7 dager) etter administrasjonen av den andre re-initieringsstartdose av den andre suspensjon;

20 (4) administrere i deltamuskel eller setemuskel av pasienten en andre re-initieringsvedlikeholdsdose med fra omtrent 39 mg til omtrent 234 mg paliperidonpalmitat av den andre suspensjon 1 måned (± 7 dager) etter administrasjonen av den første re-initieringsvedlikeholdsdose av den andre suspensjon;

25 (5) administrere i deltamuskel eller setemuskel av pasienten en tredje re-initieringsvedlikeholdsdose av fra omtrent 39 mg til omtrent 234 mg paliperidonpalmitat av den andre suspensjon 1 måned (± 7 dager) etter administrasjonen av den andre re-initieringsvedlikeholdsdose av den andre suspensjon; og

(6) administrere i deltamuskel eller setemuskel av pasienten en vedlikeholdsdose av den første suspensjon 1 måned (± 7 dager) etter
30 administrasjonen av den tredje re-initieringsvedlikeholdsdose av den andre suspensjon,

hvor det ikke er noen mellomliggende doser av paliperidonpalmitat mellom den første dose og den første re-initieringsstartdose,

hvor nevnte PP6M (første suspensjon) omfatter omtrent 312 mg/mL paliperidonpalmitat;

- 5 hvor nevnte PP1M (andre suspensjon) omfatter omtrent 156 mg/mL paliperidonpalmitat;

hvor de injiserbare suspensjoner med forlenget frigivning av paliperidonpalmitat er vandige sammensetninger som ytterligere omfatter et suspensjonsmiddel, en buffer og valgfritt ett eller flere konserveringsmidler og/eller isotoniserende midler, og

- 10 hvor enten

(i) den første dose av den første suspensjon omfatter omtrent 1092 mg paliperidonpalmitat og vedlikeholdsdosen av den første suspensjon omfatter omtrent 1092 mg paliperidonpalmitat, eller

- 15 (ii) den første dose av den første suspensjon omfatter omtrent 1560 mg paliperidonpalmitat og vedlikeholdsdosen av den første suspensjon omfatter omtrent 1560 mg paliperidonpalmitat.

8. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge krav 7, hvor den første dose av den første suspensjon omfatter omtrent 1092 mg paliperidonpalmitat og vedlikeholdsdosen av den første suspensjon omfatter omtrent 1092 mg paliperidonpalmitat.
- 20

9. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge krav 7, hvor den første dose av den første suspensjon omfatter omtrent 1560 mg paliperidonpalmitat og vedlikeholdsdosen av den første suspensjon omfatter omtrent 1560 mg paliperidonpalmitat.

- 25 10. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge et hvilket som helst av de forutgående krav, hvor den første dose av den første suspensjon og vedlikeholdsdosen av den første suspensjon administreres i setemuskelen.

11. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge et hvilket som helst av de forutgående krav, hvor fremgangsmåten er en fremgangsmåte ved behandling av schizofreni.

12. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge et hvilket som helst av de
5 forutgående krav, hvor den første suspensjon 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

10 vann q.s. ad 100%.

13. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge krav 12, hvor den første suspensjon er fra omtrent pH 6,0 til omtrent pH 8,0.

14. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge krav 12 eller krav 13, hvor det ene eller flere buffermidler omfatter sitronsyremonohydrat, natriumdihydrogenfosfat-
15 monohydrat, dinatriumhydrogenfosfatanhydrid eller natriumhydroksid.

15. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge krav 12, hvor den første suspensjon omfatter:

omtrent 312 mg/mL paliperidonpalmitat;

omtrent 10 mg/mL polysorbat 20; og

20 omtrent 75 mg/mL polyetylenglykol 4000.

16. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge et hvilket som helst av de forutgående krav, hvor den andre suspensjon omfatter:

omtrent 156 mg/mL paliperidonpalmitat;

omtrent 8 mg/mL til omtrent 16 mg/mL fuktemiddel;

ett eller flere buffermidler;

omtrent 20 mg/mL til omtrent 40 mg/mL suspensjonsmiddel; og

vann q.s. ad 100%.

- 5 17. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge krav 16, hvor den andre suspensjon er fra omtrent pH 6,0 til omtrent pH 8,0.

18. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge krav 16 eller krav 17, hvor det ene eller flere buffermidler omfatter sitronsyremonohydrat, natriumdihydrogenfosfat-monohydrat, dinatriumhydrogenfosfatanhydrid eller natriumhydroksid.

- 10 19. Paliperidonpalmitat for anvendelse ifølge krav 16, hvor den andre suspensjon omfatter:

omtrent 156 mg/mL paliperidonpalmitat;

omtrent 12 mg/mL polysorbat 20; og

omtrent 30 mg/mL polyetylenglykol 4000.