

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

PATENTTI- JA REKISTERIHALLITUS
PATENT- OCH REGISTERSTYRELSEN
FINNISH PATENT AND REGISTRATION OFFICE

(10)

FI/EP3684333 T3

(12)

**EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION**

(45)

Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning -
Translation available to the public

13.05.2025

(97)

Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för
det europeiska patentet - Date of grant of European patent

05.03.2025

(51)

Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -
International patent classification

A61K 9/00 (2006 . 01)

A61K 47/12 (2006 . 01)

A61K 47/26 (2006 . 01)

A61K 47/36 (2006 . 01)

A61K 47/38 (2006 . 01)

A61K 9/48 (2006 . 01)

A61K 31/4745 (2006 . 01)

A61P 25/00 (2006 . 01)

(96)

Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan -
European patent application

EP18783228.2

(22)

Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date

18.09.2018

(97)

Patenttihakemuksen julkiseksitulosopäivä - Patentansökans
publiceringsdag - Patent application available to the public

29.07.2020

(86)

Kansainvälinen hakemus - Internationell
ansökan - International application

18.09.2018 PCT/US2018051579

(30)

Etuoiikeus - Prioritet - Priority

21.09.2017 US US201762561629 P

28.09.2017 US US201762564951 P

(73)

Haltija - Innehavare - Holder

1• NEUROCRINE BIOSCIENCES, INC., 12780 El Camino Real , San Diego, CA 92130 , (US)

(72)

Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1• MOORE, Richard Alexander, Jr., 16348 Pinto Ridge Court , San Diego, California 92127 , (US)

2• MCCLELLAND, Gregory A., 14029 Via Corsini , San Diego, California 92128 , (US)

3• O'BRIEN, Christopher F., 12780 El Camino Real , San Diego, CA 92130 , (US)

(74)

Asiamies - Ombud - Agent

Zacco Sweden AB, 11485 Stockholm , (SE)

(54)

Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

**SUUREN ANNOSTUKSEN VALBENATSIINIFORMULAATIO JA SIIHEN LIITTYVIÄ KOOSTUMUKSIA, MENETELMIÄ JA PAKKAUKSIA
HIGH DOSAGE VALBENAZINE FORMULATION AND COMPOSITIONS, METHODS, AND KITS RELATED THERETO**

Patenttivaatimukset

1. Koostumus, joka käsittää

valbenatsiinia tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävää suolaa;

5 piidioksidipitoista mikrokiteistä selluloosaa;

isomaltia;

hydroksipropyylimetyyliselluloosaa;

osittain esigelatinoitua maissitärkkelystä ja

magnesiumstearaattia.

10

2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen koostumus, joka on kiinteä lääkekoostumus.

3. Patenttivaatimuksen 2 mukainen kiinteä lääkekoostumus, jossa valbenatsiinin farmaseuttisesti hyväksyttävä suola on valbenatsiiniditosylaatti.

15

4. Patenttivaatimuksen 2 tai 3 mukainen kiinteä lääkekoostumus, jolloin kiinteän lääkekoostumuksen irtotiheys on vähintään 0,5 mg/ml.

5. Jonkin patenttivaatimuksen 2–4 mukainen kiinteä lääkekoostumus, jolloin kiinteän lääkekoostumuksen tärytiheys on vähintään 0,6 mg/ml.

20

6. Jonkin patenttivaatimuksen 2–5 mukainen kiinteä lääkekoostumus, jossa valbenatsiiniditosylaatin d(0,9)-hiukkaskokojakauma on alle 100 µm.

7. Jonkin patenttivaatimuksen 2–6 mukainen kiinteä lääkekoostumus, jolloin kiinteä lääkekoostumus on suun kautta ottamiseen soveltuvassa yksikköannosmuodossa.

25

8. Patenttivaatimuksen 7 mukainen kiinteä lääkekoostumus, jossa valbenatsiiniditosylaattia on vähintään 30 painoprosentin määränä yksikköannosmuodon kokonaispainosta.

30

9. Patenttivaatimuksen 7 mukainen kiinteä lääkekoostumus, jossa valbenatsiiniditosylaattia on vähintään 35 painoprosentin määränä yksikköannosmuodon kokonaispainosta.

5 **10.** Patenttivaatimuksen 7 mukainen kiinteä lääkekoostumus, jossa valbenatsiiniditosylaattia on vähintään 38 painoprosentin määränä yksikköannosmuodon kokonaispainosta.

10 **11.** Patenttivaatimuksen 7 mukainen kiinteä lääkekoostumus, jossa valbenatsiiniditosylaattia on vähintään 40 painoprosentin määränä yksikköannosmuodon kokonaispainosta.

15 **12.** Patenttivaatimuksen 7 mukainen kiinteä lääkekoostumus, jossa valbenatsiiniditosylaattia on vähintään 45 painoprosentin määränä yksikköannosmuodon kokonaispainosta.

13. Jonkin patenttivaatimuksen 7–12 mukainen kiinteä lääkekoostumus, jossa valbenatsiinia tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävää suolaa on 20–160 mg:n määränä vapaana emäksenä mitattuna.

20

14. Jonkin patenttivaatimuksen 7–12 mukainen kiinteä lääkekoostumus, jossa valbenatsiinia tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävää suolaa on 20 mg:n määränä vapaana emäksenä mitattuna.

25 **15.** Jonkin patenttivaatimuksen 7–12 mukainen kiinteä lääkekoostumus, jossa valbenatsiinia tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävää suolaa on 40 mg:n määränä vapaana emäksenä mitattuna.

30 **16.** Jonkin patenttivaatimuksen 7–12 mukainen kiinteä lääkekoostumus, jossa valbenatsiinia tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävää suolaa on 60 mg:n määränä vapaana emäksenä mitattuna.

17. Jonkin patenttivaatimuksen 7–12 mukainen kiinteä lääkekoostumus, jossa valbenatsiinia tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävää suolaa on 80 mg:n määränä vapaana emäksenä mitattuna.

5 **18.** Jonkin patenttivaatimuksen 7–12 mukainen kiinteä lääkekoostumus, jossa valbenatsiinia tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävää suolaa on 100 mg:n määränä vapaana emäksenä mitattuna.

10 **19.** Jonkin patenttivaatimuksen 7–12 mukainen kiinteä lääkekoostumus, jossa valbenatsiinia tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävää suolaa on 120 mg:n määränä vapaana emäksenä mitattuna.

15 **20.** Jonkin patenttivaatimuksen 7–12 mukainen kiinteä lääkekoostumus, jossa valbenatsiinia tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävää suolaa on 160 mg:n määränä vapaana emäksenä mitattuna.

21. Jonkin patenttivaatimuksen 7–20 mukainen kiinteä lääkekoostumus, jolloin yksikköannosmuoto on formuloitu kerran vuorokaudessa otettavaksi.

20 **22.** Jonkin patenttivaatimuksen 7–20 mukainen kiinteä lääkekoostumus, jolloin yksikköannosmuoto on kapselin muodossa.

23. Patenttivaatimuksen 22 mukainen kiinteä lääkekoostumus, jolloin kapselimuoto käsittää kapselin, jonka koko on 0 tai pienempi.

25

24. Patenttivaatimuksen 22 mukainen kiinteä lääkekoostumus, jolloin kapselimuoto käsittää koon 1 kapselin.

30 **25.** Patenttivaatimuksen 22 mukainen kiinteä lääkekoostumus, jolloin kapselimuoto käsittää koon 2 tai pienemmän kapselin.

26. Jonkin patenttivaatimuksen 22–25 mukainen kiinteä lääkekoostumus, jolloin kapseli liukenee vähintään 80-prosenttisesti 30 minuutissa USP-standardin lapaliuotusmenetelmän 2 mukaisessa laitteessa ja väliaineessa, joka on 0,1 N HCl.

5 **27.** Jonkin patenttivaatimuksen 2–26 mukainen kiinteä lääkekoostumus, jolloin kiinteä koostumus käsittää valbenatsiinin tai sen farmaseuttisesti hyväksyttävän suolan rakeita ja kyseistä vähintään yhtä farmaseuttisesti hyväksyttävää apuainetta; ja valbenatsiinin farmaseuttisesti hyväksyttävä suola on valbenatsiiniditosylaatti.

10 **28.** Suun kautta otettava valmiste, joka käsittää jonkin patenttivaatimuksen 2–27 mukaista kiinteää lääkekoostumusta.

29. Yksikköannosmuoto, joka käsittää jonkin patenttivaatimuksen 2–27 mukaista kiinteää lääkekoostumusta.

15

30. Lääkekoostumuksen yksikköannosmuoto, jolloin lääkekoostumus on patenttivaatimuksen 1 mukainen lääkekoostumus, joka käsittää

valbenatsiiniditosylaattia noin 40 %:n (paino/paino) määränä;

20 piidioksidipitoista mikrokiteistä selluloosaa noin 25 %:n (paino/paino) määränä;

isomaltia noin 20 %:n (paino/paino) määränä;

hydroksipropyylimetyyliselluloosaa noin 5 %:n (paino/paino) määränä;

osittain esigelatinoitua maissitärkkelystä valbenatsiiniditosylaattia noin 7,5 %:n (paino/paino) määränä ja

25 magnesiumstearaattia noin 2,5 %:n (paino/paino) määränä;

jolloin ”noin” on ± 5 % ilmoitetusta arvosta.

31. Patenttivaatimuksen 30 mukainen yksikköannosmuoto, jolloin yksikköannosmuoto
30 soveltuu suun kautta otettavaksi.

32. Patenttivaatimuksen 30 tai 31 mukainen yksikköannosmuoto, jolloin yksikköannosmuoto on formuloitu kerran vuorokaudessa otettavaksi.

33. Jonkin patenttivaatimuksen 30–32 mukainen yksikköannosmuoto, jolloin yksikköannosmuoto on kapselin muodossa.

5 **34.** Patenttivaatimuksen 33 mukainen yksikköannosmuoto, jolloin kapselimuoto käsittää koon 1 tai pienemmän kapselin.

35. Patenttivaatimuksen 33 mukainen kiinteä yksikköannosmuoto, jolloin kapselimuoto käsittää koon 2 tai pienemmän kapselin.

10

36 Patenttivaatimuksen 33 mukainen kiinteä yksikköannosmuoto, jolloin kapselimuoto käsittää koon 3 tai pienemmän kapselin.

15 **37.** Jonkin patenttivaatimuksen 30–36 mukainen yksikköannosmuoto, jossa valbenatsiiniditosylaatin d(0,9)-hiukkaskokojakauma on alle 100 µm.

38. Patenttivaatimuksen 1 mukainen koostumus tai jonkin patenttivaatimuksen 2–27 mukainen kiinteä lääkekoostumus tai patenttivaatimuksen 28 mukainen suun kautta otettava valmiste tai
20 jonkin patenttivaatimuksen 29–37 mukainen yksikköannosmuoto käytettäväksi menetelmässä neurologisen tai psykiatrisen sairauden tai häiriön hoitamiseksi sitä tarvitsevilla potilaalla.

25 **39.** Patenttivaatimuksen 38 mukaisesti käytettävä koostumus, kiinteä lääkekoostumus, suun kautta otettava valmiste tai yksikköannosmuoto, jolloin neurologinen tai psykiatrinen sairaus tai häiriö on hyperkineettinen liikehäiriö, mielialahäiriö, kaksisuuntainen mielialahäiriö, skitsofrenia, skitsoaffektiivinen häiriö, mielialahäiriössä esiintyvä mania, mielialahäiriössä esiintyvä masennus, hoitoon
30 reagoimaton pakkoneuroosi, Lesch-Nyhanin oireyhtymään liittyvä neurologinen toimintahäiriö, Alzheimerin tautiin liittyvä kiihtyneisyys, fragiili X -oireyhtymä tai fragiili X -oireyhtymään liittyvä vapina-ataksiaoireyhtymä, autismin kirjon häiriö, Rettin oireyhtymä tai neuroakantosytoosi.

40. Patenttivaatimuksen 39 mukaisesti käytettävä koostumus, kiinteä lääkekoostumus, suun kautta otettava valmiste tai yksikköannosmuoto, jolloin neurologinen tai psykiatrinen sairaus tai häiriö on hyperkineettinen liikehäiriö.

5

41. Patenttivaatimuksen 40 mukaisesti käytettävä koostumus, kiinteä lääkekoostumus, suun kautta otettava valmiste tai yksikköannosmuoto, jolloin hyperkineettinen liikehäiriö on tardiivi dyskinesia.

10 **42.** Patenttivaatimuksen 40 mukaisesti käytettävä koostumus, kiinteä lääkekoostumus, suun kautta otettava valmiste tai yksikköannosmuoto, jolloin hyperkineettinen liikehäiriö on Huntingtonin tautiin liittyvä korea.

15 **43.** Patenttivaatimuksen 40 mukaisesti käytettävä koostumus, kiinteä lääkekoostumus, suun kautta otettava valmiste tai yksikköannosmuoto, jolloin hyperkineettinen liikehäiriö on korea.

20 **44.** Patenttivaatimuksen 39 mukaisesti käytettävä koostumus, kiinteä lääkekoostumus, suun kautta otettava valmiste tai yksikköannosmuoto, jolloin neurologinen tai psykiatrinen sairaus tai häiriö on skitsofrenia.

25 **45.** Patenttivaatimuksen 39 mukaisesti käytettävä koostumus, kiinteä lääkekoostumus, suun kautta otettava valmiste tai yksikköannosmuoto, jolloin neurologinen tai psykiatrinen sairaus tai häiriö on hoitoon reagoimaton pakkoneuroosi.

46. Jonkin patenttivaatimuksen 38–45 mukaisesti käytettävä koostumus, kiinteä lääkekoostumus, suun kautta otettava valmiste tai yksikköannosmuoto, jolloin potilaalla on todettu 22q11.2-deleetio-oireyhtymä.