

(19)



SUOMI - FINLAND  
(FI)

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

- (10) **FI/EP4025188 T3**
- (12) **EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS  
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT  
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION**
- (45) Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning - **21.02.2024**  
Translation available to the public
- (97) Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för **10.01.2024**  
det europeiska patentet - Date of grant of European patent
- (51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -  
International patent classification  
**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 )
- (96) Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan - **EP21724652.9**  
European patent application
- (22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date **07.05.2021**
- (97) Patenttihakemuksen julkiseksitulosopäivä - Patentansökans **13.07.2022**  
publiceringsdag - Patent application available to the public
- (86) Kansainvälinen hakemus - Internationell **07.05.2021 PCT/EP2021062147**  
ansökan - International application
- (30) Etuoikeus - Prioritet - Priority  
30.11.2020 US US202063119405 P

(73) Haltija - Innehavare - Holder  
**1• Janssen Pharmaceutica NV**, Turnhoutseweg 30 , 2340 Beerse , (BE)

(72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor  
**1• GOPAL, Srihari**, Titusville, NJ 08560 , (US)  
**2• VENKATASUBRAMANIAN, Raja**, Titusville, NJ 08560 , (US)  
**3• T'JOLLYN, Huybrecht**, 2340 Beerse , (BE)

(74) Asiamies - Ombud - Agent  
**Boco IP Oy Ab**, Kansakoulukatu 3 , 00100 Helsinki , (FI)

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention  
**PITKÄVAIKUTTEISIIN INJEKTOITAVIIN PALIPERIDONIFORMULAATIOIHIN LIITTYVIÄ ANNOSTELUOHJELMIA  
DOSING REGIMENS ASSOCIATED WITH EXTENDED RELEASE PALIPERIDONE INJECTABLE FORMULATIONS**

## PITKÄVAIKUTTEISIIN INJEKTOITAVIIN PALIPERIDONIFORMULAATIOIHIN LIITTYVIÄ AN- NOSTELUOHJELMIA

### PATENTTIVAATIMUKSET

1. Paliperidonipalmitaatti käytettäväksi menetelmässä, jolla hoidetaan psykoosia, skitsofreniaa,  
5 skitsoaffektiiivista häiriötä, skitsofreenistyyppistä häiriötä tai kaksisuuntaista mielialahäiriötä, mene-  
telmän käsittäessä paliperidonipalmitaatin antamisen sen tarpeessa olevalle potilaalle, jolle on an-  
nettu ensimmäisen kerran kuudessa kuukaudessa annettavan pitkävaikutteisen injektoitavan pali-  
peridonipalmitaattisuspension ("PP6M")(ensimmäinen suspensio) ensimmäinen annos, menetel-  
män käsittäessä:
- 10 toisen kerran kuukaudessa annettavan pitkävaikutteisen injektoitavan paliperidonipalmitaattisus-  
pension ("PP1M")(toinen suspensio) uudelleenaloitusannoksen antamisen potilaan hartialihakseen  
ajankohtana, joka on yli kuusi kuukautta ja kolme viikkoa mainitun ensimmäisen suspension en-  
simmäisen annoksen antamisen jälkeen, mutta alle kahdeksan kuukautta mainitun ensimmäisen  
suspension ensimmäisen annoksen antamisen jälkeen; ja
- 15 ensimmäisen suspension ylläpitoannoksen antamisen potilaan hartia- tai pakaralihakseen ajankoh-  
tana, joka on yksi kuukausi ( $\pm$  seitsemän päivää) toisen suspension uudelleenaloitusannoksen  
antamisen jälkeen;
- jossa ensimmäisen annoksen ja uudelleenaloitusannoksen välissä ei anneta paliperidonipalmitaa-  
tin väliannoksia;
- 20 jossa PP6M (ensimmäinen suspensio) käsittää noin 312 mg/ml paliperidonipalmitaattia;
- jossa PP1M (toinen suspensio) käsittää noin 156 mg/ml paliperidonipalmitaattia;
- jossa pitkävaikutteiset injektoitavat paliperidonipalmitaattisuspensiot ovat vesipitoisia koostumuk-  
sia, joka käsittävät lisäksi suspensioainetta, puskuria ja valinnaisesti yhtä tai useampaa säilöntäai-  
neesta ja isotonisuutta säätelevästä aineesta, ja
- 25 jossa joko
- (i) ensimmäisen suspension ensimmäinen annos käsittää noin 1 092 mg paliperidonipalmitaattia;  
toisen suspension uudelleenaloitusannos käsittää noin 156 mg paliperidonipalmitaattia; ja ensim-  
mäisen suspension ylläpitoannos käsittää noin 1 092 mg paliperidonipalmitaattia, tai

(ii) ensimmäisen suspension ensimmäinen annos käsittää noin 1 560 mg paliperidonipalmitaattia; toisen suspension uudelleenaloitusannos käsittää noin 234 mg paliperidonipalmitaattia; ja ensimmäisen suspension ylläpitoannos käsittää noin 1 560 mg paliperidonipalmitaattia.

5 2. Paliperidonipalmitaatti käytettäväksi patenttivaatimuksen 1 mukaisesti, jossa ensimmäisen suspension ensimmäinen annos käsittää noin 1 092 mg paliperidonipalmitaattia; toisen suspension uudelleenaloitusannos käsittää noin 156 mg paliperidonipalmitaattia; ja ensimmäisen suspension ylläpitoannos käsittää noin 1 092 mg paliperidonipalmitaattia.

10 3. Paliperidonipalmitaatti käytettäväksi patenttivaatimuksen 1 mukaisesti, jossa ensimmäisen suspension ensimmäinen annos käsittää noin 1 560 mg paliperidonipalmitaattia; toisen suspension uudelleenaloitusannos käsittää noin 234 mg paliperidonipalmitaattia; ja ensimmäisen suspension ylläpitoannos käsittää noin 1 560 mg paliperidonipalmitaattia.

15 4. Paliperidonipalmitaatti käytettäväksi menetelmässä, jolla hoidetaan psykoosia, skitsofreniaa, skitsoaffektiiivista häiriötä, skitsofreenistyyppistä häiriötä tai kaksisuuntaista mielialahäiriötä, menetelmän käsittäessä paliperidonipalmitaatin antamisen sen tarpeessa olevalle potilaalle, jolle on annettu ensimmäisen kerran kuudessa kuukaudessa annettavan pitkävaikutteisen injektoitavan paliperidonipalmitaattisuspension ("PP6M")(ensimmäinen suspensio) ensimmäinen annos, menetelmän käsittäessä:

20 toisen kerran kuukaudessa annettavan pitkävaikutteisen injektoitavan paliperidonipalmitaattisuspension ("PP1M")(toinen suspensio) ensimmäisen uudelleenaloitusannoksen, jossa on noin 156 mg paliperidonipalmitaattia, antamisen potilaan hartialihakseen ajankohtana, joka on kahdeksan kuukautta - enintään 11 kuukautta se mukaan lukien ensimmäisen suspension ensimmäisen annoksen antamisen jälkeen;

25 toisen suspension toisen uudelleenaloitusannoksen, jossa on noin 156 mg paliperidonipalmitaattia, antamisen potilaan hartialihakseen päivänä 8 ( $\pm$  neljä päivää) toisen suspension ensimmäisen uudelleenaloitusannoksen antamisen jälkeen; ja

ensimmäisen suspension ylläpitoannoksen antamisen potilaan hartia- tai pakaralihakseen yksi kuukausi ( $\pm$  seitsemän päivää) toisen suspension toisen uudelleenaloitusannoksen antamisen jälkeen;

30 jossa ensimmäisen annoksen ja ensimmäisen uudelleenaloitusannoksen välissä ei anneta paliperidonipalmitaatin väliannoksia;

jossa PP6M (ensimmäinen suspensio) käsittää noin 312 mg/ml paliperidonipalmitaattia;

jossa PP1M (toinen suspensio) käsittää noin 156 mg/ml paliperidonipalmitaattia;

jossa pitkävaikutteiset injektoitavat paliperidonipalmitaattisuspensiot ovat vesipitoisia koostumuksia, joka käsittävät lisäksi suspensioainetta, puskuria ja valinnaisesti yhtä tai useampaa säilöntäainetta ja isotonisuutta säätelevästä aineesta, ja

- 5 jossa joko
- (i) ensimmäisen suspension ensimmäinen annos käsittää noin 1 092 mg paliperidonipalmitaattia ja ensimmäisen suspension ylläpitoannos käsittää noin 1 092 mg paliperidonipalmitaattia, tai
- (ii) ensimmäisen suspension ensimmäinen annos käsittää noin 1 560 mg paliperidonipalmitaattia ja ensimmäisen suspension ylläpitoannos käsittää noin 1 560 mg paliperidonipalmitaattia.
- 10 5. Paliperidonipalmitaatti käytettäväksi patenttivaatimuksen 4 mukaisesti, jossa ensimmäisen suspension ensimmäinen annos käsittää noin 1 092 mg paliperidonipalmitaattia ja ensimmäisen suspension ylläpitoannos käsittää noin 1 092 mg paliperidonipalmitaattia.
6. Paliperidonipalmitaatti käytettäväksi patenttivaatimuksen 4 mukaisesti, jossa ensimmäisen suspension ensimmäinen annos käsittää noin 1 560 mg paliperidonipalmitaattia ja ensimmäisen suspension ylläpitoannos käsittää noin 1 560 mg paliperidonipalmitaattia.
- 15 7. Paliperidonipalmitaatti käytettäväksi menetelmässä, jolla hoidetaan psykoosia, skitsofreniaa, skitsoaffektiivista häiriötä, skitsofreenistyyppistä häiriötä tai kaksisuuntaista mielialahäiriötä, menetelmän käsittäessä paliperidonipalmitaatin antamisen sen tarpeessa olevalle potilaalle, jolle on annettu ensimmäisen kerran kuudessa kuukaudessa annettavan pitkävaikutteisen injektoitavan paliperidonipalmitaattisuspension ("PP6M")(ensimmäinen suspensio) ensimmäinen annos, menetelmän käsittäessä:
- 20 (1) toisen kerran kuukaudessa annettavan pitkävaikutteisen injektoitavan paliperidonipalmitaattisuspension ("PP1M")(toinen suspensio) ensimmäisen uudelleenaloitusannoksen, jossa on noin 234 mg paliperidonipalmitaattia, antamisen potilaan hartialihakseen ajankohtana, joka on yli 11
- 25 kuukautta ensimmäisen suspension ensimmäisen annoksen antamisen jälkeen;
- (2) toisen suspension toisen uudelleenaloitusannoksen, jossa on noin 156 mg paliperidonipalmitaattia, antamisen potilaan hartialihakseen päivänä 8 ( $\pm$  neljä päivää) toisen suspension ensimmäisen uudelleenaloitusannoksen antamisen jälkeen;

(3) toisen suspension ensimmäisen uudelleenaloitetun ylläpitoannoksen, jossa on noin 39 mg - noin 234 mg paliperidonipalmitaattia, antamisen potilaan hartia- tai pakaralihakseen yksi kuukausi ( $\pm$  seitsemän päivää) toisen suspension toisen uudelleenaloitusannoksen antamisen jälkeen;

5 (4) toisen suspension toisen uudelleenaloitetun ylläpitoannoksen, jossa on noin 39 mg - noin 234 mg paliperidonipalmitaattia, antamisen potilaan hartia- tai pakaralihakseen yksi kuukausi ( $\pm$  seitsemän päivää) toisen suspension ensimmäisen uudelleenaloitetun ylläpitoannoksen antamisen jälkeen;

10 (5) toisen suspension kolmannen uudelleenaloitetun ylläpitoannoksen, jossa on noin 39 mg - noin 234 mg paliperidonipalmitaattia, antamisen potilaan hartia- tai pakaralihakseen yksi kuukausi ( $\pm$  seitsemän päivää) toisen suspension toisen uudelleenaloitetun ylläpitoannoksen antamisen jälkeen; ja

(6) ensimmäisen suspension ylläpitoannoksen antamisen potilaan hartia- tai pakaralihakseen yksi kuukausi ( $\pm$  seitsemän päivää) toisen suspension kolmannen uudelleenaloitetun ylläpitoannoksen antamisen jälkeen,

15 jossa ensimmäisen annoksen ja ensimmäisen uudelleenaloitusannoksen välissä ei anneta paliperidonipalmitaatin väliannoksia;

jossa PP6M (ensimmäinen suspensio) käsittää noin 312 mg/ml paliperidonipalmitaattia;

jossa PP1M (toinen suspensio) käsittää noin 156 mg/ml paliperidonipalmitaattia;

20 jossa pitkävaikutteiset injektoitavat paliperidonipalmitaattisuspensiot ovat vesipitoisia koostumuksia, joka käsittävät lisäksi suspensioainetta, puskuria ja valinnaisesti yhtä tai useampaa säilöntäainetta ja isotonisuutta säätelevästä aineesta, ja

jossa joko

(i) ensimmäisen suspension ensimmäinen annos käsittää noin 1 092 mg paliperidonipalmitaattia ja ensimmäisen suspension ylläpitoannos käsittää noin 1 092 mg paliperidonipalmitaattia, tai

25 (ii) ensimmäisen suspension ensimmäinen annos käsittää noin 1 560 mg paliperidonipalmitaattia ja ensimmäisen suspension ylläpitoannos käsittää noin 1 560 mg paliperidonipalmitaattia.

8. Paliperidonipalmitaatti käytettäväksi patenttivaatimuksen 7 mukaisesti, jossa ensimmäisen suspension ensimmäinen annos käsittää noin 1 092 mg paliperidonipalmitaattia ja ensimmäisen suspension ylläpitoannos käsittää noin 1 092 mg paliperidonipalmitaattia.

9. Paliperidonipalmitaatti käytettäväksi patenttivaatimuksen 7 mukaisesti, jossa ensimmäisen suspension ensimmäinen annos käsittää noin 1 560 mg paliperidonipalmitaattia ja ensimmäisen suspension ylläpitoannos käsittää noin 1 560 mg paliperidonipalmitaattia.

5 10. Paliperidonipalmitaatti käytettäväksi jonkin edellä olevan patenttivaatimuksen mukaisesti, jossa ensimmäisen suspension ensimmäinen annos ja ensimmäisen suspension ylläpitoannos annetaan pakaralihakseen.

11. Paliperidonipalmitaatti käytettäväksi jonkin edellä olevan patenttivaatimuksen mukaisesti, jossa menetelmä on menetelmä, jolla hoidetaan skitsofreniaa.

10 12. Paliperidonipalmitaatti käytettäväksi jonkin edellä olevan patenttivaatimuksen mukaisesti, jossa ensimmäinen suspensio käsittää:

noin 312 mg/ml paliperidonipalmitaattia;

noin 8 mg/ml - noin 12 mg/ml kostutusainetta;

yhtä tai useampaa puskurointiainetta;

noin 65 mg/ml - noin 85 mg/ml suspensioainetta; ja

15 vettä tarvittava määrä 100 prosenttiin.

13. Paliperidonipalmitaatti käytettäväksi patenttivaatimuksen 12 mukaisesti, jossa ensimmäisen suspension pH on noin 6,0 - noin 8,0.

20 14. Paliperidonipalmitaatti käytettäväksi patenttivaatimuksen 12 tai patenttivaatimuksen 13 mukaisesti, jossa kyseinen yksi tai useampi puskurointiaine käsittää sitruunahappomonohydraattia, natriumdivetyfosfaattimonohydraattia, vedetöntä dinatriumvetyfosfaattia tai natriumhydroksidia.

15. Paliperidonipalmitaatti käytettäväksi patenttivaatimuksen 12 mukaisesti, jossa ensimmäinen suspensio käsittää:

noin 312 mg/ml paliperidonipalmitaattia;

noin 10 mg/ml polysorbaatti 20:ta; ja

25 noin 75 mg/ml polyetyleeniglykoli 4000:ää.

16. Paliperidonipalmitaatti käytettäväksi jonkin edellä olevan patenttivaatimuksen mukaisesti, jossa toinen suspensio käsittää:

noin 156 mg/ml paliperidonipalmitaattia;

noin 8 mg/ml - noin 16 mg/ml kostutusainetta;

yhtä tai useampaa puskurointiainetta;

noin 20 mg/ml - noin 40 mg/ml suspensioainetta; ja

5 vettä tarvittava määrä 100 prosenttiin.

17. Paliperidonipalmitaatti käytettäväksi patenttivaatimuksen 16 mukaisesti, jossa toisen suspensio-  
on pH on noin 6,0 - noin 8,0.

18. Paliperidonipalmitaatti käytettäväksi patenttivaatimuksen 16 tai patenttivaatimuksen 17 mukai-  
sesti, jossa kyseinen yksi tai useampi puskurointiaine käsittää sitruunahappomonohydraattia, nat-  
10 riumdivetyfosfaattimonohydraattia, vedetöntä dinatriumvetyfosfaattia tai natriumhydroksidia.

19. Paliperidonipalmitaatti käytettäväksi patenttivaatimuksen 16 mukaisesti, jossa toinen suspensio  
käsittää:

noin 156 mg/ml paliperidonipalmitaattia;

noin 12 mg/ml polysorbaatti 20:ta; ja

15 noin 30 mg/ml polyetyleeniglykoli 4000:ää.