



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 4125903 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

A61K 31/496 (2006.01)

A61P 25/18 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2025.01.06
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2024.10.09
(86)	European Application Nr.	21720012.0
(86)	European Filing Date	2021.04.01
(87)	The European Application's Publication Date	2023.02.08
(30)	Priority	2020.04.01, US, 202063003544 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
(73)	Proprietor	Otsuka Pharmaceutical Co., Ltd., 2-9, Kanda Tsukasa-machi Chiyoda-ku, Tokyo 101-8535, Japan
(72)	Inventor	HARLIN, Matthew, c/o OTSUKA PHARMACEUTICAL CO., LTD., 3-2-27, Otedori, Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka 540-0021, Japan WANG, Xiaofeng, c/o OTSUKA PHARMACEUTICAL CO., LTD., 3-2-27, Otedori, Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka 540-0021, Japan WANG, Yanlin, c/o OTSUKA PHARMACEUTICAL CO., LTD., 3-2-27, Otedori, Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka 540-0021, Japan RAOUFINIA, Arash, c/o OTSUKA PHARMACEUTICAL CO., LTD., 3-2-27, Otedori, Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka 540-0021, Japan
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54) Title **METHODS FOR DOSE INITIATION OF ARIPIPRAZOLE TREATMENTS**

(56) References

Cited:

US-A1- 2015 087 654, US-A1- 2019 099 494,
MARJIE L. HARD ET AL: "Pharmacokinetic Evaluation of a 1-Day Treatment Initiation Option for Starting Long-Acting Aripiprazole Lauroxil for Schizophrenia :", JOURNAL OF CLINICAL PSYCHOPHARMACOLOGY., vol. 38, no. 5, 1 October 2018 (2018-10-01), US, pages 435 - 441, XP055590436, ISSN: 0271-0749, DOI: 10.1097/JCP.0000000000000921
LESLIE CITROME: "Aripiprazole long-acting injectable formulations for schizophrenia: aripiprazole monohydrate and aripiprazole lauroxil", EXPERT REVIEW OF CLINICAL PHARMACOLOGY 20141101 EXPERT REVIEWS LTD. GBR, vol. 9, no. 2, 19 December 2015 (2015-12-19), UK, pages 169 - 186, XP055398416, ISSN: 1751-2433, DOI: 10.1586/17512433.2016.1121809
WANG X ET AL: "P.533 The two-injection start of aripiprazole once-monthly provides rapid attainment of therapeutic concentrations without the need for 14-day oral tablet supplementation", EUROPEAN NEUROPSYCHOPHARMACOLOGY, ELSEVIER SIENCE PUBLISHERS BV , AMSTERDAM, NL, vol. 40, 1 November 2020 (2020-11-01), XP086353709, ISSN: 0924-977X, [retrieved on 20201117], DOI: 10.1016/J.EURONEURO.2020.09.388
MARJIE L. HARD ET AL: "Pharmacokinetic Profile of a 2-Month Dose Regimen of Aripiprazole Lauroxil: A Phase I Study and a Population Pharmacokinetic Model", CNS DRUGS, vol. 31, no. 7, 8 June 2017 (2017-06-08), AUCKLAND, NZ, pages 617 - 624, XP055590498, ISSN: 1172-7047, DOI: 10.1007/s40263-017-0447-7

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. Aripiprazol intramuskulær (IM)-depotformulering omfattende 300 mg eller 400 mg aripiprazol, for bruk i en fremgangsmåte for doseinnføring for en aripiprazolbehandling til en pasient med behov for det, hvori pasienten har schizofreni eller bipolar I lidelse, fremgangsmåten omfatter:

administrering av to separate injeksjoner av aripiprazol intramuskulær (IM)-depotformulering, hvori hver injeksjon omfatter 300 mg eller 400 mg aripiprazol, til pasienten på separate injeksjonssteder valgt fra gluteale injeksjonssteder, deltoid-injeksjonssteder og et glutealt injeksjonssted og et deltoid-injeksjonssted og en enkelt dose oral aripiprazol, hvori trinnet med å administrere de to separate injeksjonene og den enkle orale dosen skjer på en første dag av behandlingen.

2. Aripiprazol IM-depotformulering for bruk ifølge krav 1, hvori hver av de to separate injeksjonene omfatter 400 mg aripiprazol.

3. Aripiprazol IM-depotformulering for bruk ifølge krav 1, hvori hver av de to separate injeksjonene omfatter 300 mg aripiprazol.

4. Aripiprazol IM-depotformulering for bruk i en fremgangsmåte ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvori aripiprazolbehandlingen videre omfatter etter den første dagen av behandlingen, administrering av enkle månedlige vedlikeholdsinjeksjoner av aripiprazol IM-depotformuleringen omfattende 400 mg aripiprazol.

5. Aripiprazol IM-depotformulering for bruk i en fremgangsmåte ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvori aripiprazolbehandlingen videre omfatter etter den første dagen av behandlingen, administrering av enkle månedlige vedlikeholdsinjeksjoner av aripiprazol IM-depotformuleringen omfattende 300 mg av aripiprazol.

6. Aripiprazol IM-depotformulering for bruk i en fremgangsmåte ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 3, hvori når pasienten er en CYP2D6-fattig metabolisator eller tar samtidig CYP3A4-hemmere eller CYP2D6-hemmere i mer enn 14 dager, omfatter behandlingen med aripiprazol administrering enkle månedlige vedlikeholdsinjeksjoner valgt fra 160 mg og 200 mg aripiprazol i aripiprazol IM-depotformuleringen.

7. Aripiprazol IM-depotformulering for bruk i en fremgangsmåte ifølge hvilket som helst av kravene 4 til 6, hvori hver vedlikeholdsinjeksjon administreres ikke tidligere enn 26 dager etter den forrige injeksjonen.

8. Aripiprazol IM-depotformulering for bruk ifølge krav 1, hvori de to separate injeksjonene av aripiprazol IM-depotformuleringen administreres på separate gluteale injeksjonssteder hos pasienten.

9. Aripiprazol IM-depotformulering for bruk ifølge krav 1, hvori de to separate injeksjonene av aripiprazol IM-depotformuleringen administreres på et glutealt injeksjonssted og et deltoid-injeksjonssted hos pasienten.

10. Aripiprazol IM-depotformulering for bruk ifølge krav 1, hvori de to separate injeksjonene av aripiprazol IM-depotformuleringen administreres på separate deltoid-

injeksjonssteder hos pasienten.

11. Aripiprazol IM-depotformulering for bruk ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 10, hvori pasienten har schizofreni.

12. Aripiprazol IM-depotformulering for bruk ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 10, hvori pasienten har bipolar I lidelse.

13. Aripiprazol IM-depotformulering for bruk ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 12, hvori enkeltdosen av oral aripiprazol varierer fra ca. 2 mg til ca. 30 mg aripiprazol.

14. Aripiprazol IM-depotformulering for bruk ifølge krav 13, hvori enkeltdosen av oral aripiprazol varierer fra ca. 10 mg til ca. 30 mg.

15. Aripiprazol IM-depotformulering for bruk ifølge krav 13, hvori enkeltdosen av oral aripiprazol er 20 mg.

16. Aripiprazol IM-depotformulering for bruk ifølge krav 13, hvori enkeltdosen av oral aripiprazol er 10 mg.

17. Aripiprazol IM-depotformulering for bruk ifølge krav 1, hvori når pasienten er en CYP2D6-fattig metabolisator, omfatter hver av de to separate injeksjonene ca. 300 mg aripiprazol og enkeltdosen av oral aripiprazol er ca. 20 mg.

18. Aripiprazol IM-depotformulering for bruk ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 17, hvori aripiprazolet er i form av et salt.

19. Aripiprazol IM-depotformulering for bruk ifølge krav 1, hvori pasienten som har behov for aripiprazolbehandlingen er en pasient med eller uten tidligere stabilisering på oral aripiprazol, hvori hver av de to separate injeksjoner omfatter 400 mg aripiprazol, og hvor enkeltdosen av oral aripiprazol er ca. 20 mg.

20. Aripiprazol IM-depotformulering for bruk ifølge krav 19, hvori pasienten som trenger aripiprazolbehandlingen er en pasient med tidligere stabilisering på oral aripiprazol.