

(12)

PREVOD ZAHTEVKOV EVROPSKEGA PATENTA

(21) Številka predmeta: **201131350**

(51) Int. Cl. (2017.01)

(22) Datum prijave: **12.01.2011**

A61K 39/00 C07K 16/00
A61P 17/00

(46) Datum objave prevoda zahtevkov:
30.03.2018

(96) Evropska patentna prijava:
12.01.2011 EP 11705713.3

(30) Prednostna pravica:
15.01.2010 US 295387 P;
10.12.2010 US 422059 P

(87) Objava mednarodne patentne prijave:
WO 2011/088120, 21.07.2011

(86) Mednarodna patentna prijava:
12.01.2011 WO PCT/US2011/020985

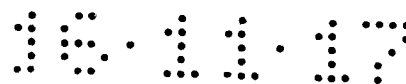
(97) Objava evropskega patenta:
EP 2523688 B1, 11.10.2017

(72) Izumitelji: **LIU Dingjiang, Oak Park California 91377, US;**
HUANG Holly Zhuohong, Thousand Oaks California 91320, US;
MARTIN David Andrew, Seattle Washington 98115, US;
RUSSELL Christopher Boyd, Bainbridge Island Washington 98110, US;
SALINGER David H., Seattle Washington 98115, US;
BAUMGARTNER Scott Walter, Thousand Oaks California 91362, US;
ENDRES Christopher J., Seattle Washington 98107, US

(73) Imetnik: **Kirin-Amgen, Inc. One Amgen Center Drive,**
Thousand Oaks, CA 91320-1799, US

(74) Zastopnik: **MARK-INVENTA d.o.o., Glinška 14, 1000 Ljubljana, SI**

(54) **FORMULACIJA PROTITELES IN TERAPEVTSKI REŽIMI**



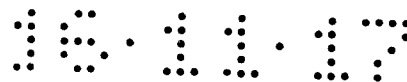
Kirin-Amgen, Inc.
One Amgen Center Drive
Thousand Oaks CA 91320-1799, US

EP 2 523 688 B1
MIP-9510-SI

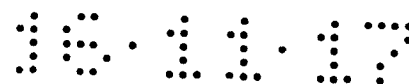
Formulacija protiteles in terapevtski režimi

Patentni zahtevki

1. Farmacevtska formulacija, ki vsebuje vodno raztopino pufru glutaminske kisline in protitelo, ki vsebuje zaporedje variabilne domene težke verige, ki vsebuje SEQ ID NO:3 in zaporedje variabilne domene lahke verige, ki vsebuje SEQ ID NO:4, kjer omenjeno protitelo specifično veže receptor A humanega IL-17in, kjer:
 - a) omenjena formulacija vsebuje glutaminsko kislino v koncentraciji od 5-30 mM ± 0.2 mM;
 - b) omenjena formulacija ima pH 4.5-5.2 ± 0.2 ;
 - c) omenjena formulacija nadalje vsebuje od 2 do 4% proline (teža/volumen) in 0,005-0,02% (teža/volumen) polisorbata 20;
 - d) omenjeno protitelo je v koncentraciji od 100 do 150 mg/ml.
2. Farmacevtska formulacija po zahtevku 1, kjer protitelo vsebuje zaporedje težke verige, ki vsebuje SEQ ID NO:1 in zaporedje lahke verige, ki vsebuje SEQ ID NO:2 ali alternativno, zaporedje težke verige, ki vsebuje SEQ ID NO:12 in zaporedje lahke verige, ki vsebuje SEQ ID NO:2.
3. Farmacevtska formulacija po zahtevku 1 ali zahtevku 2, ki ima nadalje osmolarnost od 250 do 400 mOsm/L.
4. Farmacevtski vsebnik, ki vsebuje posodo in farmacevtsko formulacijo po kateremkoli zahtevku od 1 do 3, kjer je posoda viala, steklenica, prednapolnjena brizgalka ali prednapolnjena avtoinjektorska brizgalka.



5. Komplet, ki vsebuje enega ali več farmacevtskih vsebnikov po zahtevku 4 in navodila v zvezi z njihovo uporabo.
6. Farmacevtska formulacija po kateremkoli zahtevku od 1 do 3 za uporabo v postopku zdravljenja psoriaze v humanem pacientu, kjer je protitelo v odmerku 70, 140, 210 ali 280 mg.
7. Farmacevtska formulacija za uporabo po zahtevku 6, kjer omenjenemu pacientu administriramo odmerek od 70 do 280 mg omenjenega protitelesa vsak teden, vsaka dva tedna in/ali vsak mesec.
8. Farmacevtska formulacija za uporabo po zahtevku 7, kje je odmerek 140 mg omenjenega protitelesa administriramo pacientom, ki tehtajo manj ali približno 100 kg in, kjer odmerek 210 mg omenjenega protitelesa administriramo pacientom, ki tehtajo več kot 100 kg.
9. Farmacevtska formulacija za uporabo po kateremkoli zahtevku od 6 do 8 kjer je, psoriza izbrana iz skupine, ki vsebuje:
 - a) psorizo v plakih;
 - b) zmerno do hudo psorizo v plakih;
 - c) kronično zmerno do hudo psorizo v plakih in so omenjeni pacienti kandidati za sistemsko terapijo ali fototerapijo;in
 - d) kronično zmerno do hudo psorizo v plakih in kjer se omenjeni pacienti niso odzvali na, imajo kontraindikacije ali so intolerantni na druge sistemske terapije, vključno s ciklosporinom, metotreksatom in psoralen plus ultraviolečno-A fototerapijo.
10. Farmacevtska formulacija za uporabo po kateremkoli zahtevku 6 to 9, kjer omenjena farmacevtska formulacija vsebuje približno 140 mg/ml omenjenega protitelesa, formuliranega z 10 ± 0.2 mM glutaminske kisline, $3 \pm 0.2\%$



(teža/volumen) L-prolina, $0.01 \pm 0.002\%$ (teža/volumen) polisorbata 20, pH 4.8 ± 0.2 .

11. Farmaceutvska formulacija za uporabo po kateremkoli zahtevku 6-10, kjer je farmaceutvska formulacija administrirana subkutano, intradermalno, intramuskularno in/ali intravensko.

12. Farmaceutvska formulacija, ki vsebuje protitelo, ki vsebuje protitelo v količini približno od 100 do 150 mg/ml, formulirano z:

- i) glutaminsko kislino koncentraciji v količini 10 mM;
- ii) pH 4.8 ± 0.2 ;
- iii) 3% prolina (teža/volumen) in 0.01% (teža/volumen) polisorbata 20;

kjer je protitelo izbrano iz skupine, ki vsebuje:

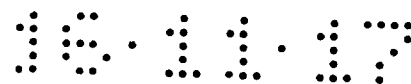
- a) protitelo, ki vsebuje zaporedje variabilne domene težke verige, ki vsebuje SEQ ID NO:3 in zaporedje variabilne domene lahke verige, ki vsebuje SEQ ID NO:4, kjer omenjeno protitelo specifično veže receptor A humanega IL-17; in
- b) protitelo, ki vsebuje zaporedje težke verige, ki vsebuje SEQ ID NO:1 in zaporedje lahke verige, ki vsebuje SEQ ID NO:2 ali alternativno, zaporedje težke verige, ki vsebuje SEQ ID NO:12 in zaporedje lahke verige, ki vsebuje SEQ ID NO:2, za uporabo v postopku zdravljenja psoriatičnega artritisa v humanem pacientu, kjer je protitelo v odmerku 70, 140, 210 ali 280 mg.

13. Farmaceutvska formulacija, ki vsebuje protitelo v količini približno od 100-150 mg/ml, formulirano z:

- i) glutaminsko kislino v koncentraciji 10 mM;
- ii) pH 4.8 ± 0.2 ;
- iii) 3% prolina (teža/volumen) in 0.01% (teža/volumen) polisorbata 20;

kjer je protitelo izbrano iz skupine, ki vsebuje:

- a) protitelo, ki vsebuje zaporedje variabilne domene težke verige, ki vsebuje SEQ ID NO:3 in zaporedje variabilne domene lahke verige, ki vsebuje SEQ ID NO:4, kjer omenjeno protitelo specifično veže receptor A humanega IL-17; in



- b) protitelo, ki vsebuje zaporedje težke verige, ki vsebuje SEQ ID NO: 1 in zaporedje lahke verige, ki vsebuje SEQ ID NO:2 ali alternativno, zaporedje težke verige, ki vsebuje SEQ ID NO:12 in zaporedje lahke verige, ki vsebuje SEQ ID NO:2, za uporabo v postopku zdravljenja astme v humanem pacientu, kjer je protitelo v odmerku 70, 140, 210 ali 280 mg.

14. Farmacevtska formulacija, ki vsebuje protitelo v količini približno od 100-150 mg/ml, formulirano z:

- i) glutaminsko kislino v koncentraciji 10 mM;
- ii) pH 4.8 ± 0.2 ;
- iii) 3% proline (teža/volumen) in 0.01% (teža/volumen) polisorbata 20;

kjer je protitelo izbrano iz skupine, ki vsebuje:

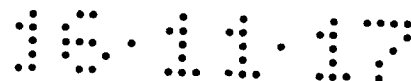
- a) protitelo, ki vsebuje zaporedje variabilne domene težke verige, ki vsebuje SEQ ID NO:3 in zaporedje variabilne domene lahke verige, ki vsebuje SEQ ID NO:4, kjer omenjeno protitelo specifično veže receptor A humanega IL-17; in
- b) protitelo, ki vsebuje zaporedje težke verige, ki vsebuje SEQ ID NO: 1 in zaporedje lahke verige, ki vsebuje SEQ ID NO:2 ali alternativno, zaporedje težke verige, ki vsebuje SEQ ID NO:12 in zaporedje lahke verige, ki vsebuje SEQ ID NO:2, za uporabo v postopku zdravljenja ankilozirajočega spondilitisa v humanem pacientu, kjer je protitelo v odmerku 70, 140, 210 ali 280 mg.

15. Farmacevtska formulacija, ki vsebuje protitelo v količini približno od 100-150 mg/ml, formulirano z:

- i) glutaminsko kislino v koncentraciji 10 mM;
- ii) pH 4.8 ± 0.2 ;
- iii) 3% proline (teža/volumen) in 0.01% (teža/volumen) polisorbata 20;

kjer je protitelo izbrano iz skupine, ki vsebuje:

- a) protitelo, ki vsebuje zaporedje variabilne domene težke verige, ki vsebuje SEQ ID NO:3 in zaporedje variabilne domene lahke verige, ki vsebuje SEQ ID NO:4, kjer omenjeno protitelo specifično veže receptor A humanega IL-17; in
- b) protitelo, ki vsebuje zaporedje težke verige, ki vsebuje SEQ ID NO: 1 in zaporedje lahke verige, ki vsebuje SEQ ID NO:2 ali alternativno, zaporedje



težke verige, ki vsebuje SEQ ID NO:12 in zaporedje lahke verige, ki vsebuje SEQ ID NO:2, za uporabo v postopku zdravljenja multiple skleroze v humanem pacientu, kjer je protitelo v odmerku 70, 140, 210 ali 280 mg.

16. Formulacija za uporabo po kateremkoli zahtevku od 12 do 15, kjer omenjena farmacevtska formulacija nadalje vsebuje približno 140 mg/ml omenjenega protitelesa in kjer ima omenjeno zdravilo viskoznost od 5 do 7 cP pri 25 °C.
17. Formulacija za uporabo po kateremkoli zahtevku od 12 do 16, kjer je omenjena farmacevtska formulacija administrirana subkutano, intradermalno, intramuskularno in/ali intravensko.

DIJKIĆ Zastopnik:
Miro - Inventa
