

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

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

(10)

FI/EP3380525 T3

(12)

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

(45)

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

30.01.2024

(97)

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

08.11.2023

(51)

Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -
International patent classification
C07K 16/46 (2006 . 01)
C07K 16/28 (2006 . 01)
C07D 487/04 (2006 . 01)

(96)

Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan -
European patent application

EP16869289.5

(22)

Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date

23.11.2016

(97)

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

03.10.2018

(86)

Kansainvälinen hakemus - Internationell
ansökan - International application

23.11.2016 PCT/US2016063624

(30)

Etuoikeus - Prioritet - Priority

25.11.2015 US US201562260104 P

28.07.2016 US US201662368156 P

(73)

Haltija - Innehavare - Holder

1• Immunogen, Inc., 830 Winter Street, Waltham, MA 02451, (US)

(72)

Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1• BARTLETT, Elizabeth, 88 Park Avenue Unit 207, Arlington, MA 02476, (US)

(74)

Asiamies - Ombud - Agent

Papula Oy, P.O.Box 981, 00101 Helsinki, (FI)

(54)

Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

LÄÄKEFORMULAATIOITA JA NIIDEN KÄYTTÖMENETELMIÄ

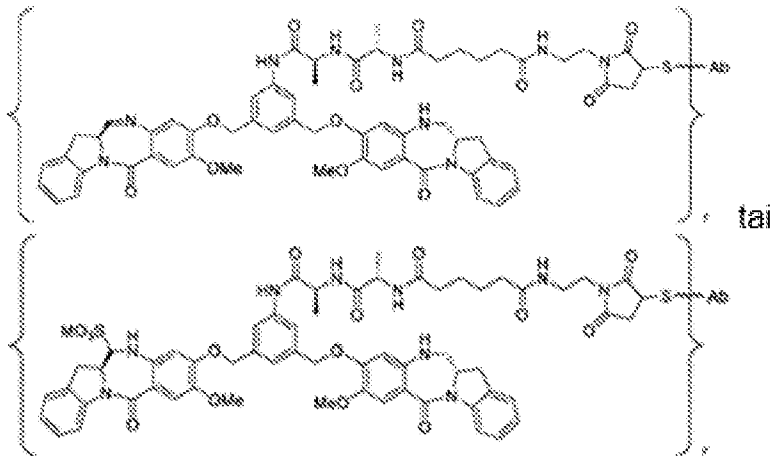
PHARMACEUTICAL FORMULATIONS AND METHODS OF USE THEREOF

Patenttivaatimukset

1. Vesipitoinen formulaatio, joka käsittää

(a) vettä

(b) 2 mg/ml konjugaattia, jolla on seuraava kaava:



(c) 10 mM natriumsukkinaattia ja

(d) 8 % trehaloosidihydraattia;

jolloin Ab on vasta-aine tai sen antigeeniä sitova fragmentti, joka käsittää sekvenssin SEQ ID NO: 1 mukaisen raskasketjun vaihtelevan alueen (VH) komplementaarisuuden määrittävän alueen (CDR1) sekvenssin, sekvenssin SEQ ID NO: 2 mukaisen VH CDR2 -sekvenssin ja sekvenssin SEQ ID NO: 3 mukaisen VH CDR3 -sekvenssin ja sekvenssin SEQ ID NO: 4 mukaisen kevytketjun vaihtelevan alueen (VL) CDR1-sekvenssin, sekvenssin SEQ ID NO: 5 mukaisen VL CDR2 -sekvenssin ja sekvenssin SEQ ID NO: 6 mukaisen VL CDR3 -sekvenssin;

jolloin r on kokonaisluku 1–10;

M on Na⁺, K⁺, H⁺ tai mikä tahansa farmaseuttisesti hyväksyttävä kationi; ja

jolloin formulaation pH on 4,0–4,5.

2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen vesipitoinen formulaatio, jossa vasta-aine tai sen antigeeniä sitova fragmentti käsittää raskasketjun vaihtelevan alueen domeenin, joka on vähintään noin 90-prosenttisesti identtinen sekvenssin SEQ ID NO: 7 kanssa, ja kevytketjun vaihtelevan alueen, joka on vähintään noin 90-prosenttisesti identtinen sekvenssin SEQ ID NO: 9 kanssa.

3. Patenttivaatimuksen 1 mukainen vesipitoinen formulaatio, jossa vasta-aine tai sen antigeeniä sitova fragmentti käsittää raskasketjun vaihtelevan alueen domeenin, joka on vähintään noin 90-prosenttisesti identtinen sekvenssin SEQ ID NO: 11 kanssa, ja kevytketjun vaihtelevan alueen, joka on vähintään noin 90-prosenttisesti identtinen sekvenssin SEQ ID NO: 14 kanssa.

4. Patenttivaatimuksen 1 mukainen vesipitoinen formulaatio, jossa vasta-aine tai sen antigeeniä sitova fragmentti käsittää raskasketjun vaihtelevan alueen domeenin, joka on vähintään noin 90-prosenttisesti identtinen sekvenssin SEQ ID NO: 12 kanssa, ja kevytketjun vaihtelevan alueen, joka on vähintään noin 90-prosenttisesti identtinen sekvenssin SEQ ID NO: 14 kanssa.

5. Jonkin patenttivaatimuksen 1–4 mukainen formulaatio, joka käsittää lisäksi noin 0,005–0,1 % (paino/tilavuus) polysorbaatti 20:ta tai 0,01 % (paino/tilavuus) polysorbaatti 20:ta.

6. Jonkin patenttivaatimuksen 1–5 mukainen formulaatio, jossa pH on noin 4,2.

7. Patenttivaatimuksen 1 mukainen vesipitoinen formulaatio, jossa vasta-aine tai sen antigeeniä sitova fragmentti käsittää

(i) raskasketjun vaihtelevan alueen, joka on vähintään noin 95-prosenttisesti identtinen sekvenssin SEQ ID NO: 7 kanssa, ja kevytketjun vaihtelevan alueen, joka on vähintään noin 95-prosenttisesti identtinen sekvenssin SEQ ID NO: 9 kanssa; tai

(ii) raskasketjun vaihtelevan alueen, joka käsittää sekvenssin SEQ ID NO: 7 mukaisen sekvenssin, ja kevytketjun vaihtelevan alueen, joka käsittää sekvenssin SEQ ID NO: 9 mukaisen sekvenssin.

8. Patenttivaatimuksen 1 mukainen vesipitoinen formulaatio, jossa vasta-aine tai sen antigeeniä sitova fragmentti käsittää

(i) raskasketjun aminohapposekvenssin, joka on vähintään noin 95-prosenttisesti identtinen sekvenssin SEQ ID NO: 11 kanssa, ja kevytketjun aminohapposekvenssin, joka on vähintään noin 95-prosenttisesti identtinen sekvenssin SEQ ID NO: 14 kanssa; tai

(ii) raskasketjun aminohapposekvenssin, joka käsittää sekvenssin SEQ ID NO: 11 mukaisen sekvenssin, ja kevytketjun aminohapposekvenssin, joka käsittää sekvenssin SEQ ID NO: 14 mukaisen sekvenssin.

- 5 **9.** Patenttivaatimuksen 1 mukainen vesipitoinen formulaatio, jossa vasta-aine tai sen antigeeniä sitova fragmentti käsittää

(i) raskasketjun aminohapposekvenssin, joka on vähintään noin 95-prosenttisesti identtinen sekvenssin SEQ ID NO: 12 kanssa, ja kevytketjun aminohapposekvenssin, joka on vähintään noin 95-prosenttisesti identtinen sekvenssin SEQ ID NO: 14 kanssa;

10 tai

(ii) raskasketjun aminohapposekvenssin, joka käsittää sekvenssin SEQ ID NO: 12 mukaisen sekvenssin, ja kevytketjun aminohapposekvenssin, joka käsittää sekvenssin SEQ ID NO: 14 mukaisen sekvenssin.

- 15 **10.** Jonkin patenttivaatimuksen 1–6 mukainen vesipitoinen formulaatio, joka käsittää lisäksi 2–200 μM natriumbisulfiittia tai 50 μM natriumbisulfiittia.