



**ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ**

**(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2014151359, 17.05.2013

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
18.05.2012 US 61/649,146

(43) Дата публикации заявки: 10.07.2016 Бюл. № 19

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
национальной фазе: 18.12.2014(86) Заявка РСТ:  
US 2013/041532 (17.05.2013)(87) Публикация заявки РСТ:  
WO 2013/173687 (21.11.2013)

Адрес для переписки:

129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, строение 3,  
ООО "Юридическая фирма Городисский и  
Партнеры"

(71) Заявитель(и):

**ДЖЕНЕНТЕК, ИНК. (US)**

(72) Автор(ы):

**АРМСТРОНГ Николас Дж. (US),  
БАУЭН Маюми Н. (US),  
МАО Юй-Фань (US)****(54) ВЫСОКОКОНЦЕНТРИРОВАННЫЕ СОСТАВЫ МОНОКЛОНАЛЬНЫХ АНТИТЕЛ****(57) Формула изобретения**

1. Суспензионный состав, содержащий высушенное распылением моноклональное антитело в концентрации примерно 200 мг/мл или больше, суспендированное в неводном наполнителе для суспензии, при этом вязкость наполнителя для суспензии меньше примерно 20 сантипуаз.

2. Состав по п. 1, в котором вязкость наполнителя для суспензии меньше примерно 10 сантипуаз.

3. Состав по п. 2, в котором вязкость наполнителя для суспензии меньше примерно 5 сантипуаз.

4. Состав по любому из предшествующих пунктов, в котором сила трения скольжения состава при инъекции составляет примерно 20 ньютонов или меньше.

5. Состав по п. 4, в котором сила трения скольжения состава при инъекции составляет примерно 15 ньютонов или меньше.

6. Состав по п. 1, в котором средний размер частиц в составе составляет примерно от 2 микрон до примерно 30 микрон.

7. Состав по п. 6, в котором средний размер частиц в составе составляет примерно от 2 микрон до примерно 10 микрон.

8. Состав по п. 1, в котором концентрация антитела в составе составляет примерно от 200 мг/мл до примерно 500 мг/мл.

9. Состав по п. 8, в котором концентрация антитела в составе составляет примерно

от 200 мг/мл до примерно 350 мг/мл.

10. Состав по п. 1, дополнительно содержащий сахарид.
11. Состав по п. 10, в котором сахаридом является трегалоза или сахароза.
12. Состав по п. 10 или 11, в котором молярное соотношение сахарид : моноклональное антитело составляет примерно от 50 до примерно 400:1.
13. Состав по п. 12, в котором молярное соотношение сахарид : моноклональное антитело составляет примерно от 100 до примерно 250:1.
14. Состав по п. 1, дополнительно содержащий поверхностно-активное вещество.
15. Состав по п. 14, в котором поверхностно-активным веществом является полисорбат 20 или полисорбат 80.
16. Состав по п. 1, который подходит для подкожного введения.
17. Состав по п. 1, в котором моноклональное антитело представляет собой полноразмерное моноклональное антитело.
18. Состав по п. 17, в котором моноклональное антитело представляет собой IgG1 человека.
19. Состав по п. 1, в котором моноклональное антитело является химерным, гуманизированным или человеческим антителом.
20. Состав по п. 1, в котором моноклональное антитело связывается с антигеном, выбранным из группы, состоящей из: CD20, HER2, VEGF, IL6R, бета7, А-бета, HER3, EGFR и M1'.
21. Состав по п. 20, в котором антителом является ритуксимаб, трастузумаб или бевацизумаб.
22. Состав по п. 1, в котором неводный наполнитель для суспензии содержит дикаприлат/дикапрат пропиленгликоля, бензилбензоат, этиллактат или их смеси.
23. Состав по п. 22, в котором неводный наполнитель для суспензии содержит этиллактат.
24. Состав по п. 22 или п. 23, в котором неводный наполнитель для суспензии содержит смесь дикаприлата/дикапрата пропиленгликоля и этиллактата.
25. Устройство для подкожного введения состава по любому из предшествующих пунктов внутри него.
26. Устройство по п. 25, которое состоит из предварительно заполняемого шприца.
27. Способ получения суспензионного состава, включающий суспендирование высушенного распылением моноклонального антитела в неводном наполнителе для суспензии с вязкостью менее примерно 20 сантипуаз, при этом концентрация моноклонального антитела в суспензионном составе составляет примерно 200 мг/мл или больше.
28. Способ получения изделия, включающий заполнение устройства для подкожного введения составом по любому из пп. 1-24.
29. Суспензионный состав, содержащий высушенное распылением полноразмерное моноклональное IgG1-антитело человека в концентрации примерно от 200 мг/мл до примерно 400 мг/мл, суспендированное в неводном наполнителе для суспензии с вязкостью менее примерно 20 сантипуаз, при этом состав имеет средний размер частиц примерно от 2 микрон до примерно 10 микрон и силу трения скольжения при инъекции менее примерно 15 ньютонов.
30. Состав по п. 29, который дополнительно содержит сахарид, при этом молярное соотношение сахарид : моноклональное антитело составляет примерно от 100 до примерно 250:1.
31. Состав по п. 29 или п. 30, в котором антителом является ритуксимаб, трастузумаб или бевацизумаб.
32. Применение состава по любому из пп. 1-24 для лечения заболевания или

расстройства у пациента.

33. Применение состава по любому из пп. 1-24 для получения лекарственного средства для лечения пациента, нуждающегося в лечении моноклональным антителом в составе.

34. Способ лечения пациента, включающий введение состава по любому из пп. 1-24 пациенту моноклонального антитела в составе.

35. Способ по п. 34, в котором состав вводят пациенту подкожно.

36. Способ по п. 34 или 35, в котором состав вводят предварительно заполненным шприцем с находящимся в нем составом.

RU 2014151359 A

RU 2014151359 A