



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20170324 T1

HR P20170324 T1

(12) **PRIJEVOD PATENTNIH ZAHTEJEVA
EUROPSKOG PATENTA**

(51) MKP:

C07K 16/28 (2006.01)

A61P 29/00 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 21.04.2017.

(21) Broj predmeta: P20170324T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 27.02.2017.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/US2010048034
Datum podnošenja međunarodne prijave: 08.09.2010.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 10754387.8
Datum podnošenja europske prijave patenta: 08.09.2010.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2011031695
Datum međunarodne objave: 17.03.2011.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 2475684 A1
Datum objave europske prijave patenta: 18.07.2012.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 2475684 B1
Datum objave europskog patenta: 30.11.2016.

(31) Broj prve prijave: 240783 P
242821 P
317839 P

(32) Datum podnošenja prve prijave: 09.09.2009.
16.09.2009.
26.03.2010.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US
US
US

(73) Nositelj patenta:

**Regeneron Pharmaceuticals, Inc., 777 Old Saw Mill River Road,
Tarrytown, NY 10591, US**

(72) Izumitelji:

**Lynn MacDonald, c/o Regeneron Pharmaceuticals, Inc., 777 Old Saw Mill
Road, Tarrytown, NY 10591, US**

**Andrew J. Murphy, c/o Regeneron Pharmaceuticals, Inc., 777 Old Saw
Mill Road, Tarrytown, NY 10591, US**

**Nicholas J. Papadopoulos, c/o Regeneron Pharmaceuticals, Inc., 777 Old
Saw Mill Road, Tarrytown, NY 10591, US**

**Marc R. Morra, c/o Regeneron Pharmaceuticals, Inc., 777 Old Saw Mill
Road, Tarrytown, NY 10591, US**

**Robert R. Salzler, c/o Regeneron Pharmaceuticals, Inc., 777 Old Saw Mill
Road, Tarrytown, NY 10591, US**

**Michael L. Lacroix-Fralish, c/o Regeneron Pharmaceuticals, Inc., 777 Old
Saw Mill Road, Tarrytown, NY 10591, US**

(74) Zastupnik:

FORINPRO d.o.o., 10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma:

**LJUDSKA ANTITIJELE VISOKOG AFINITETA ZA LJUDSKI 2 PROTEAZOM AKTIVIRANI
RECEPTOR**

HR P20170324 T1

PATENTNI ZAHTEJEVI

1. Izolirano ljudsko antitijelo ili njegov antigen vezujući fragment koji se specifično vezuje za ljudski PAR-2 (SEQ ID NO:851) i stupa u interakciju s Val-42 i Asp-43 ljudskog PAR-2, naznačen time, što se antitijelo ili antigen vezujući fragment sastoji od regija koje određuju komplementarnost (CDR) koje sadrže sekvence aminokiselina HCDR1-HCDR2-HCDR3 / LCDR1-LCDR2-LCDR3 odabrane iz grupe koja se sastoji od: (a) SEQ ID NO:100-102-104 / 108-110-112; i (b) SEQ ID NO: 700-702-704 / 708-710-712.
2. Izolirano ljudsko antitijelo ili antigen vezujući fragment prema zahtjevu 1, naznačen time, što antitijelo ili antigen vezujući fragment također stupa u interakciju s jednim ili više ostataka odabranih iz grupe koja se sastoji od Ser-37, Leu-38, Ile-39, Gly-40 i Gly-44 ljudskog PAR-2.
3. Izolirano ljudsko antitijelo ili antigen vezujući fragment prema zahtjevu 1 ili 2, naznačen time, što antitijelo ili antigen vezujući fragment ne stupa u interakciju s Lys-41 ljudskog PAR-2.
4. Izolirano ljudsko antitijelo ili antigen vezujući fragment prema bilo kojem zahtjevu od 1 do 3, naznačeno time, što antitijelo ili antigen vezujući fragment stupa u interakciju sa Ser-37, Leu-38, Ile-39, Gly-40, Val-42 i Asp-43 ljudskog PAR-2, ali ne stupa u interakciju s Lys-41 ljudskog PAR-2.
5. Izolirano ljudsko antitijelo ili antigen vezujući fragment prema bilo kojem zahtjevu od 1 do 4, naznačen time, što antitijelo ili antigen vezujući fragment blokira klanje tripsina ljudskog PAR-2 na aktivirajućem mjestu klanja koje se nalazi na čvoru ostataka Arg-36 i Ser-37 ljudskog PAR-2.
6. Izolirano ljudsko antitijelo ili antigen vezujući fragment prema zahtjevu 5, naznačen time, što antitijelo ili antigen vezujući fragment ne blokira klanje tripsina ljudskog PAR-2 na jednom ili više neaktivirajućih mjesta klanja odabranih iz neaktivirajućeg mjesta klanja koje se nalazi na čvoru ostataka Arg-31 i Ser-32 ljudskog PAR-2 i neaktivirajućeg mjesta klanja koje se nalazi na čvoru ostataka Lys-34 i Gly-35 ljudskog PAR-2.
7. Izolirano ljudsko antitijelo ili antigen vezujući fragment prema zahtjevu 1, naznačen time, što je spomenuto antitijelo ili antigen vezujući fragment odabran iz grupe koja se sastoji od: (a) antitijela koje sadrži varijabilnu regiju teškog lanca (HCVR) koja ima sekvencu aminokiseline SEQ ID NO:714 i varijabilnu regiju lakog lanca (LCVR) koja ima sekvencu aminokiseline SEQ ID NO:692; i (b) antitijela koje sadrži HCVR koja ima sekvencu aminokiseline SEQ ID NO:98 i LCVR koja ima sekvencu aminokiseline SEQ ID NO:106.
8. Farmaceutski pripravak koji sadrži antitijelo ili antigen vezujući fragment prema bilo kojem zahtjevu od 1 do 7 i farmaceutski prihvatljivi nosač ili otapalo.
9. Izolirano ljudsko antitijelo ili antigen vezujući fragment prema bilo kojem zahtjevu od 1 do 7 ili farmaceutski pripravak prema zahtjevu 8 za primjenu u načinu liječenja bolesnika, naznačen time, što spomenuti bolesnik ima jedan ili više simptoma ili indikatora bolesti ili poremećaja izazvanog aktivnošću PAR-2, pri čemu je bolest ili poremećaj izazvan aktivnošću PAR-2 bolest ili poremećaj odabran iz grupe koja se sastoji od boli, pruritusa, astme, reumatoidnog artritisa, fibroze, atopičnog dermatitisa, upalne bolesti crijeva, ulcerativnog kolitisa, pankreatitisa, čira, Chronove bolesti, raka i Nethertonove bolesti.
10. Izolirano antitijelo, antigen vezujući fragment ili pripravak prema zahtjevu 9, za primjenu prema zahtjevu 9, pri čemu se način dodatno sastoji od davanja bolesniku najmanje jednog dodatnog terapijski aktivnog sastojka odabranog iz grupe koja se sastoji od inhibitora IL-1, inhibitora IL-18, inhibitora IL-4, inhibitora receptora IL-4, inhibitora IL-6, inhibitora receptora IL-6, inhibitora nervnog faktora rasta (NGF), inhibitora faktora nekroze tumora (TNF) i inhibitora receptora TNF-a, inhibitora sinteze mokraćne kiseline i kortikosteroida.
11. Primjena izoliranog antitijela ili antigen vezujućeg fragmenta prema bilo kojem zahtjevu od 1 do 7 ili farmaceutskog pripravka prema zahtjevu 8, u proizvodnji lijeka za primjenu u liječenju bolesnika koji ima jedan ili više simptoma ili indikatora bolesti ili poremećaja izazvanog aktivnošću PAR-2, pri čemu je bolest ili poremećaj izazvan aktivnošću PAR-2 bolest ili poremećaj odabran iz grupe koja se sastoji od boli, pruritusa, astme, reumatoidnog artritisa, fibroze, atopičnog dermatitisa, upalne bolesti crijeva, ulcerativnog kolitisa, pankreatitisa, čira, Chronove bolesti, raka i Nethertonove bolesti.
12. Molekula nukleinske kiseline koja kodira antitijelo ili njegov antigen vezujući fragment prema bilo kojem zahtjevu od 1 do 7, rekombinantni vektor ekspresije koji nosi nukleinsku kiselinu ili stanicu domaćin u koju je vektor uveden.
13. Način proizvodnje antitijela ili njegovog antigen vezujućeg fragmenta prema bilo kojem zahtjevu od 1 do 7, pri čemu se spomenuti način sastoji od kultiviranja stanice domaćina prema zahtjevu 12 u uvjetima koji omogućavaju proizvodnju antitijela i prikupljanje proizvedenih antitijela.