



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20230733 T1

HR P20230733 T1

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

(51) MKP:

A61K 9/00 (2006.01)
A61P 19/08 (2006.01)
A61K 47/20 (2006.01)
A61K 39/395 (2006.01)
A61P 19/10 (2006.01)
A61P 29/00 (2006.01)
C07K 16/22 (2006.01)
A61K 47/18 (2017.01)
A61K 9/08 (2006.01)
A61K 47/40 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 13.10.2023.

(21) Broj predmeta: P20230733T

(22) Datum podnošenja : 09.03.2017.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/EP2017055594
Datum podnošenja međunarodne prijave: 09.03.2017.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 17710208.4
Datum podnošenja europske prijave patenta: 09.03.2017.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2017153541
Datum međunarodne objave: 14.09.2017.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 3426294 A1
Datum objave europske prijave patenta: 16.01.2019.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 3426294 B1
Datum objave europskog patenta: 17.05.2023.

(31) Broj prve prijave: 201604124

(32) Datum podnošenja prve prijave: 10.03.2016.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: GB

(73) Nositelj patenta:

(72) Izumitelji:

UCB Biopharma SRL, Allée de la Recherche 60, 1070 Brussels, BE
Andrew Jeffrey Yates, c/o UCB Australia Pty. Ltd, 1155 Malvern Road,
3144 Victoria, AU
James Gregory Clipstone, c/o UCB Celltech, 208 Bath Road, SL1 3WE
Slough Berkshire, GB

(74) Zastupnik:

Odvjetnik Tomislav Hadžija, u suradnji sa DENNEMEYER & ASSOCIATES,
10000 Zagreb, HR

(54) Naziv izuma:

FARMACEUTSKA FORMULACIJA KOJA SADRŽI ANTITIJELA, CIKLODEKSTRIN I METIONIN

HR P20230733 T1

PATENTNI ZAHTJEVI

1. Tekuća farmaceutska formulacija uključuje:
 - a. antitijelo ili njegov antigen-vezujući fragment kao aktivnu supstancu;
 - b. ciklodekstrin u koncentraciji od 7.5 mM do 250 mM i
 - c. metionin u koncentraciji od 30 mM do 200 mM.
2. Tekuća formulacija prema zahtjevu 1 koja obuhvaća antitijelo ili njegov antigen-vezujući fragment u koncentraciji od 1 do 200 mg/ml, poželjno od 90 do 180 mg/ml.
3. Tekuća formulacija prema zahtjevu 1 ili 2, što se antitijelo ili njegov antigen-vezujući fragment specifično se veže za ljudski sklerostin.
4. Tekuća formulacija prema bilo kojem od prethodnih zahtjeva, što je antitijelo ljudsko ili je humanizirano antitijelo ili njegov antigen-vezujući fragment.
5. Tekuća formulacija prema bilo kojem od prethodnih zahtjeva, gdje je:
 - a. antitijelo ili njegov antigen-vezujući fragment
 - i. sadrži CDR-H1 koji ima sekvencu kako je definirano u SEQ ID NO:1; CDR-H2 koji ima sekvencu kako je definirano u SEQ ID NO:2; CDR-H3 koji ima sekvencu kako je definirano u SEQ ID NO:3; CDR-L1 koji ima sekvencu kako je definirano u SEQ ID NO:4; CDR-L2 koji ima sekvencu kako je definirano u SEQ ID NO:5 i CDR-L3 koji ima sekvencu kako je definirano u SEQ ID NO:6; ili
 - ii. ima laku varijabilnu regiju koja ima sekvencu kako je definirano u SEQ ID NO: 7 i tešku varijabilnu regiju koja ima sekvencu kako je definirano u SEQ ID NO: 8; ili
 - b. antitijelo ima
 - i. lak lanac koji ima sekvencu kako je definirano u SEQ ID NO: 9 i težak lanac koji ima sekvencu kako je definirano u SEQ ID NO: 10; ili
 - ii. lak lanac koji ima sekvencu kako je definirano u SEQ ID NO: 11 i težak lanac koji ima sekvencu kako je definirano u SEQ ID NO: 12.
6. Tekuća formulacija prema bilo kojem od prethodnih zahtjeva, što je antitijelo romosozumab.
7. Tekuća formulacija prema bilo kojem od prethodnih zahtjeva koja ima pH od 4.0 do 7.5.
8. Tekuća formulacija prema bilo kojem od prethodnih zahtjeva, što je ciklodekstrin izabran između alfa-ciklodekstrina, beta-ciklodekstrina, dimetil-beta-ciklodekstrina, trimetil-beta-ciklodekstrina, nasumično metiliranog beta-ciklodekstrina, hidroksietil-beta-ciklodekstrina, hidroksipropil-beta-ciklodekstrina (tj. 2 hidroksipropil-beta-ciklodekstrin, 3-hidroksipropil-beta-ciklodekstrin ili 2,3-dihidroksipropil-beta-ciklodekstrin), hidroksiizobutil-beta-ciklodekstrina sulfobutiletar beta-ciklodekstrina, glukozil-beta-ciklodekstrina, maltozil-beta-ciklodekstrina, gama-ciklodekstrina, hidroksipropil-gama-ciklodekstrina (tj. 2 hidroksipropil-gama-ciklodekstrin, 3-hidroksipropil-gama-ciklodekstrin ili 2,3-dihidroksipropil-gama-ciklodekstrin) polimera koji sadrže ciklodekstrin ili njihove kombinacije, po potrebi pri čemu je ciklodekstrin izabran između hidroksipropil-gama-ciklodekstrina.
9. Tekuća formulacija prema bilo kojem od prethodnih zahtjeva, gdje je:
 - (i) formulacija sadrži od 1 mg/ml do 200 mg/ml antitijela, od 10 mM do 55 mM natrij acetata, od 0 do 14 mM kalcij acetata, od 0 do 6% saharoze, od 0 do 0.006% polisorbata 20, od 55mM do 80 mM hidroksipropil-gama-ciklodekstrina, od 55 mM do 160 mM metionina pri pH 5,2, po potrebi pri čemu formulacija sadrži od 90 mg/ml do 180 mg/ml, poželjno od 120 mg/ml do 180 mg/ml romosozumaba; i/ili
 - (ii) tekuća formulacija nije hidrogel; i/ili
 - (iii) tekuća formulacija sadrži najmanje 2%, najmanje 5%, najmanje 10%, najmanje 25%, između 2% i 90%, između 2% i 75%, ili između 2% i 50% vode.
10. Tekuća formulacija prema bilo kojem od prethodnih zahtjeva za upotrebu u liječenju poremećaja kostiju povezanog s najmanje jednim od slabog formiranja kostiju, niske mineralne gustoće kostiju, niskog mineralnog sadržaja kostiju, niske koštane mase, slabe kvalitete kostiju i niske čvrstoće kostiju.
11. Tekuća formulacija za upotrebu prema zahtjevu 9, što je poremećaj kostiju osteoporozu.
12. Postupak za smanjenje taloženja antitijela ili njegovog antigen-vezujućeg fragmenta u tekućoj farmaceutskoj formulaciji, postupak obuhvaća osiguravanje tekuće formulacije i dodavanje u formulaciju metionina u koncentraciji od 30 mM do 200 mM i ciklodekstrina u koncentraciji od 7.5 mM do 250 mM.
13. Postupak prema zahtjevu 12, što je ciklodekstrin hidroksipropil-gama-ciklodekstrin.
14. Terapeutski efikasna količina formulacije prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 9 za upotrebu u postupku smanjenja upale na mjestu injekcije kod subjekta sisavaca, koja se sastoji od primjene terapeutski efikasne količine formulacije.