(19) SUOMI - FINLAND
(FI)

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

(10) **FI/EP4087875 T3**

(12) **EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS**
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION

(45) Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning - Translation available to the public **25.10.2024**

(97) Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för det europeiska patentet - Date of grant of European patent **28.08.2024**

(51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering - International patent classification
C07K 16/28 (2006 . 01)
C07K 16/18 (2006 . 01)
A61K 31/573 (2006 . 01)
A61K 39/395 (2006 . 01)
A61P 17/00 (2006 . 01)
A61P 37/06 (2006 . 01)

(96) Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan - European patent application EP21701890.2

(22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date **08.01.2021**

(97) Patenttihakemuksen julkiseksitulopäivä - Patentansökans publiceringsdag - Patent application available to the public **16.11.2022**

(86) Kansainvälinen hakemus - Internationell ansökan - International application **08.01.2021 PCT/EP2021050275**

(30) Etuoikeus - Prioritet - Priority

08.01.2020 US US202062958543 P 13.01.2020 US US202062960647 P

(73) Haltija - Innehavare - Holder

1• Argenx BV , Industriepark Zwijnaarde 7 , 9052 Gent , (BE)

(72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1• VERHEESEN, Peter , c/o Industriepark Zwijnaarde 7 , 9052 Gent , (BE)
2• DUPUY, Patrick , c/o Industriepark Zwijnaarde 7 , 9052 Gent , (BE)

(74) Asiamies - Ombud - Agent

Berggren Oy , P.O. Box 16 Eteläinen Rautatiekatu 10 A , 00101 Helsinki , (FI)

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

Vastasyntyneen ihmisen Fc-reseptorin (FcRn) antagonisteja pemfigus-häiriöiden hoitoon

ANTAGONISTS OF HUMAN NEONATAL FC RECEPTOR (FCRN) FOR TREATING PEMPHIGUS DISORDERS

Patenttivaatimukset

1. FcRn-antagonisti käytettäväksi pemfiguksen hoidossa sitä tarvitsevalla kohteella, jossa

(i) kohteella on

(a) hiljattain diagnosoitu pemfigus,

(b) uusiutuva pemfigus tai

(c) vaikeasti hoidettava pemfigus,

(ii) FcRn-antagonisti koostuu vaihtelevasta Fc-alueesta, jossa mainittu vaihteleva Fc-alue koostuu kahdesta Fc-domeenista, jotka muodostavat homodimeerin, ja jossa kunkin Fc-domeenin aminohapposekvenssi on valittu joukosta, joka koostuu sekvensseistä SEQ ID NO: 1, SEQ ID NO: 2 ja SEQ ID NO: 3, ja

(iii) FcRn-antagonisti annetaan yhdessä kortikosteroidin kanssa, ja kortikosteroidin annos on ≤ 0,5 mg predisonia/kg/vrk tai vastaava.

2. FcRn-antagonisti käytettäväksi patenttivaatimuksen 1 mukaisesti, jossa pemfigus on pemphigus vulgaris (PV), pemphigus foliaceus (PF) tai sekä PV että PF, ja/tai jossa kohteella on lievä, keskivaikea tai vaikea pemfigus luokiteltuna pemfigus-tautialueindeksin (eng. Pemphigus Disease Area Index, PDAI) mukaisesti.

3. FcRn-antagonisti käytettäväksi patenttivaatimuksen 1 tai 2 mukaisesti, jossa FcRn-antagonisti annetaan kerran viikossa tai kahdessa viikossa, kunnes tauti on saatu hallintaan tai täydelliseen remissioon.

4. FcRn-antagonisti käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksen 1–3 mukaisesti, jossa FcRn-antagonisti annetaan laskimonsisäisenä annoksena 10 mg/kg – 30 mg/kg kerran viikossa tai kahden viikon välein,
jossa valinnaisesti FcRn-antagonisti annetaan laskimonsisäisenä annoksena 10 mg/kg kerran viikossa tai kahden viikon välein,
tai jossa valinnaisesti FcRn-antagonisti annetaan laskimonsisäisenä annoksena 25 mg/kg kerran viikossa tai kahden viikon välein.

5. FcRn-antagonisti käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksen 1–3 mukaisesti, jossa FcRn-antagonisti annetaan ihon alle kiinteänä annoksena 750 mg – 3000 mg kerran viikossa tai kahden viikon välein,
jossa valinnaisesti FcRn-antagonisti annetaan ihon alle vakioannoksena 1000 mg tai 2000 mg kerran viikossa tai kahden viikon välein,
tai jossa valinnaisesti FcRn-antagonisti annetaan aluksi ihon alle vakioannoksena noin 1000 mg kaksi kertaa saman vuorokauden kuluessa.

6. FcRn-antagonisti käytettäväksi patenttivaatimuksen 5 mukaisesti, jossa FcRn-antagonisti on samassa valmisteessa hyaluronidaasin kanssa ja se annetaan ihon alle.

7. FcRn-antagonisti käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksen 1–6 mukaisesti, jossa lisäksi annetaan asteittain pienenevä annos kortikosteroidia sen jälkeen, kun tauti on saatu hallintaan tai täydelliseen remissioon.

8. FcRn-antagonisti käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksen 1–7 mukaisesti, jossa asteittain pienenevä annos kortikosteroidia alkaa annoksesta ≤ 0,5 mg predisonia/kg/vrk tai vastaava, tai jossa asteittain pienenevä annos kortikosteroidia alkaa annoksesta 10 mg predisonia/vrk tai vastaava.

9. FcRn-antagonisti käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksen 1–8 mukaisesti, jossa kortikosteroidin asteittainen vähentäminen aloitetaan noin 1 kuukauden, noin 3 viikon, noin 2 viikon tai noin 1 viikon kuluessa FcRn-antagonistin alkuannoksen antamisesta.

10. FcRn-antagonisti käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksen 1–9 mukaisesti, jossa vähentäminen alkuannoksesta tai myöhemmästä asteittain pienenevästä annoksesta voi tapahtua kuukauden, 3 viikon, 2 viikon tai viikon välein.

11. FcRn-antagonisti käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksen 1–10 mukaisesti, jossa kortikosteroidien asteittainen vähentäminen käsittää vähentämisen noin 0,5 mg predisonia/kg/vrk tai vastaavasti, noin 0,25 mg predisonia/kg/vrk tai vastaavasti, tai noin 0,1 mg prednisonia/kg/vrk tai vastaavasti.

12. FcRn-antagonisti käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksen 1–11 mukaisesti, jossa kortikosteroidi on systeeminen kortikosteroidi.

13. FcRn-antagonisti käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksen 1–12 mukaisesti, jossa FcRn-antagonistia annetaan aloitusvaiheessa ja vakautusvaiheessa, jossa

(i) aloitusvaiheen aikana FcRn-antagonistia annetaan kerran viikossa tai kahdessa viikossa ja kortikosteroidia annetaan annoksena ≤ 0,5 mg prednisonia/kg/vrk tai vastaava, kunnes tauti on saatu hallintaan, ja

(ii) vakautusvaiheen aikana FcRn-antagonistiannosta vähennetään tai FcRn-antagonistin annostusväliä pidennetään, ja/tai kortikosteroidiannosta vähennetään tai kortikosteroidin annostusväliä pidennetään, vakautusvaiheen lopetusannokseen tai annostusväliin, joka on tehokas estämään uusien leesioiden ilmaantuminen.

14. FcRn-antagonisti käytettäväksi patenttivaatimuksen 13 mukaisesti, joka käsittää lisäksi ylläpitovaiheen, jossa

(iii) ylläpitovaiheen aikana FcRn-antagonistin ja/tai predisonin tai vastaavan vakautusvaiheen lopetusannosta tai annostusväliä jatketaan, kunnes leesiot ovat kokonaan poistuneet.

15. FcRn-antagonisti käytettäväksi patenttivaatimuksen 13 tai 14 mukaisesti, jossa aloitusvaiheen aikana FcRn-antagonistia:

(i) annetaan laskimonsisäisenä annoksena 10 mg/kg – 30 mg/kg,

(ii) annetaan laskimonsisäisenä annoksena 10 mg/kg,

(iii) annetaan laskimonsisäisenä annoksena 25 mg/kg,

(iv) annetaan ihon alle kiinteänä annoksena 750 mg – 3 000 mg tai

(v) annetaan aluksi ihon alle kiinteänä annoksena noin 1 000 mg kaksi kertaa saman vuorokauden kuluessa.

16. FcRn-antagonisti käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksen 1–15 mukaisesti, jossa:

(i) kohteella on vaikeasti hoidettava pemfigus,

(ii) kohteella on hiljattain diagnosoitu pemphigus vulgaris, jonka pemfigustautialueindeksi (eng. Pemphigus Disease Area Index, PDAI) on ≥ 15,

(iii) kohteella on uusiutuva pemfigus vulgaris,

(iv) kohteella on hiljattain diagnosoitu pemphigus foliaceus, jonka pemfigus-tautialueindeksi (eng. Pemphigus Disease Area Index, PDAI) on ≥ 15,

(v) kohteella on uusiutuva pempphigus foliaceus,

(vi) kohde on vastustuskykyinen rituksimabille, ja/tai

(vii) kohde on yliherkkä kortikosteroidille.

17. FcRn-antagonisti käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksen 1–16 mukaisesti, joka käsittää lisäksi sen, että kohteelle annetaan B-soluja vähentävää ainetta,

jossa valinnaisesti B-soluja vähentävä aine on rituksimabi.