

(12)

PREVOD ZAHTEVKOV EVROPSKEGA PATENTA

(21) Številka predmeta: **200632240**

(51) Int. Cl. (2018.01)

(22) Datum prijave: **27.12.2006**

C07K 14/00

A61K 38/00

(46) Datum objave prevoda zahtevkov:

31.05.2018

(96) Evropska patentna prijava:

27.12.2006 EP 06848187.8

(30) Prednostna pravica:

29.12.2005 US 754903 P

(87) Objava mednarodne patentne prijave:

WO 2007/079096, 12.07.2007

(86) Mednarodna patentna prijava:

27.12.2006 WO PCT/US2006/049322

(97) Objava evropskega patenta:

EP 1981519 B1, 27.12.2017

(72) Izumitelj: **LADNER Robert C., Ijamsville, Maryland 21754, US**

(73) Imetnik: **Dyax Corp.,
55 Network Drive, Burlington, MA 01803, US**

(74) Zastopnik: **ZIVKO MIJATOVIC & PARTNERS, d.o.o., Ulica stare pravde 10, 1000 Ljubljana, SI**

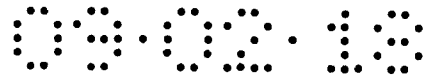
(54) **INHIBICIJA PROTEAZE**



INHIBICIJA PROTEAZE

PATENTNI ZAHTEVKI

1. Izoliran protein, ki inhibira vsaj človeški tkivni kalikrein (h.K1) in človeški plazemski kalikrein, izolirani protein, ki obsega vsaj dve inženirski domeni Kunitz, pri čemer vsebuje vsaj ena od Kunitz domen okvir inhibitorja poti tkivnega faktorja (TFPI) Kunitz domene 1 in obsega substitucijo ali modifikacijo pri enem ali več ostankih 11-19, 31, 32, 34 in 38-40, oštevilčena glede na zaporedje goveji pankreasni tripsinski inhibitor (BPTI), podan v tabeli 7.
2. Izolirani protein po zahtevku 1, kjer sta vsaj dve inženirski Kunitzovi domeni vsaj 90 ali 95% identični.
3. Izolirani protein po zahtevku 1, ki inhibira vsako humano proteazo s K_i z manj kot 10 nM.
4. Izolirani protein po zahtevku 1, kjer protein obsega tri, štiri, pet ali šest Kunitz domen.
5. Izolirani protein po zahtevku 1, kjer vsaj ena izmed inženirskih Kunitz domen vsebuje samo dve disulfidne vezi.
6. Izolirani protein po zahtevku 1:
 - a) ki ima molekulsko maso najmanj 15 kilodaltonov;



- b) ki ima beta-fazno razpolovno dobo najmanj 30 minut;
- c) ki je modificiran z dvema ali večimi PEG deli;
- d) ki inhibira človeške proteaze v prisotnosti nevtrofilnih defenzinov;
- e) ki je odporen na razkroj z MT6-MMP (leukolizin); ali
- f) ki ne vključuje cepitvenih mest, ki jih priznava MMP-8 ali MMP-12.

7. Izolirani protein po zahtevku 1, kjer se vsaj dve inženirski domeni Kunitz razlikujeta druga od druge.

8. Izolirani protein po zahtevku 1, kjer sta vsaj dve inženirski Kunitzovi domeni povezani s prilagodljivim hidrofilnim linkerjem.

9. Izolirani protein po zahtevku 1, kjer vsaj dve inženirski domeni Kunitz nista ločeni s serumskim albuminskim delom.

10. Izolirani protein po zahtevku 1:

- a) ki ima manj kot tri mesta za glikozilacijo;
- b) ki nima glikozilacijskih mest; ali
- c) ki nima N-vezavnih glikozilacijskih mest.

11. Izolirani protein po zahtevku 1, kjer ima vsaj ena izmed inženirskih domen Kunitz aminokislinsko sekvenco

EAMHSFCAFKADDGPCRAAHPRWFFNIFTRQCEEFIYGGCEGNQNRFSLE
ECKKMCT RD.



12. Farmacevtski sestavek, ki obsega izoliran protein po katerem koli od zahtevkov 1-10 in farmacevtsko sprejemljiv nosilec.
13. Izolirani protein po katerem koli od zahtevkov od 1 do 10 ali farmacevtski sestavek po zahtevku 12, za uporabo pri zdravljenju motnje, povzročene z človeškim tkivnim kalikreinom in človeškim plazemskim kalikreinom.