

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

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

- (10) **FI/EP3880186 T3**
- (12) **EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION**
- (45) Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning - **30.05.2024**
Translation available to the public
- (97) Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för **03.04.2024**
det europeiska patentet - Date of grant of European patent
- (51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -
International patent classification
A61K 31/00 (2006 . 01)
A61K 39/00 (2006 . 01)
A61K 39/395 (2006 . 01)
C07K 16/28 (2006 . 01)
A61K 45/06 (2006 . 01)
A61K 9/00 (2006 . 01)
A61P 35/00 (2006 . 01)
- (96) Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan - **EP19817846.9**
European patent application
- (22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date **13.11.2019**
- (97) Patenttihakemuksen julkiseksitulosopäivä - Patentansökans **22.09.2021**
publiceringsdag - Patent application available to the public
- (86) Kansainvälinen hakemus - Internationell **13.11.2019 PCT/US2019061212**
ansökan - International application
- (30) Etuoikeus - Prioritet - Priority
14.11.2018 US US201862767218 P

- (73) Haltija - Innehavare - Holder
1• Regeneron Pharmaceuticals, Inc. , 777 Old Saw Mill River Road , Tarrytown, NY 10591-6706 , (US)
- (72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor
1• FURY, Matthew G. , c/o Regeneron Pharmaceuticals, Inc. 777 Old Saw Mill River Road , Tarrytown, NY 10591 , (US)
2• LOWY, Israel , c/o Regeneron Pharmaceuticals, Inc. 777 Old Saw Mill River Road , Tarrytown, NY 10591 , (US)
- (74) Asiamies - Ombud - Agent
Zacco Sweden AB , P.O. Box 5581 Löjtnantsgatan 21 , 114 85 Stockholm , (SE)
- (54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention
PD-1-inhibiittoreiden intralesionaalinen antaminen ihosyövän hoitamiseksi
INTRALESIONAL ADMINISTRATION OF PD-1 INHIBITORS FOR TREATING SKIN CANCER

PATENTTIVAATIMUKSET

- 1.** Farmaseuttinen koostumus, joka käsittää terapeuttisesti tehokkaan määrän ohjelmoidun solukuoleman 1 (PD-1) inhibiittoria, käytettäväksi kasvaimen kasvun hoito- tai inhibointimenetelmässä, joka käsittää:
- 5 (a) ihosyöpää sairastavan potilaan valitsemisen; ja
- (b) farmaseuttisen koostumuksen yhden tai useamman annoksen intralesionaalisen antamisen potilaan kasvaimeen;
- jolloin PD-1-inhibiittori on anti-PD-1-vasta-aine tai sen antigeeniä sitova fragmentti, joka käsittää kolme komplementaarisuutta määrittävää aluetta (CDR:ää) (HCDR1, HCDR2 ja HCDR3) raskasketjun vaihtelevan alueen (HCVR) sisällä käsittäen
- 10 sekvenssin nro 1 mukaisen aminohapposekvenssin, ja kolme CDR:ää (LCDR1, LCDR2 ja LCDR3) kevyketjun vaihtelevan alueen (LCVR) sisällä käsittäen sekvenssin nro 2 mukaisen aminohapposekvenssin.
- 2.** Farmaseuttinen koostumus patenttivaatimuksen 1 mukaiseen käyttöön, jolloin:
- 15 (a) ihosyöpä on ihon okasolusyöpä (CSCC), tyvisolusyöpä (BCC), merkelinsolukarsinooma tai melanooma;
- (b) ihosyöpä on CSCC; tai
- (c) ihosyöpä on uusiutuva leikattavissa oleva CSCC.
- 3.** Farmaseuttinen koostumus patenttivaatimuksen 1 tai patenttivaatimuksen 2 mukaiseen käyttöön, jolloin:
- 20 (a) potilaan syöpää on hoidettu aiemmin, jolloin aiempi hoito käsittää leikkauksen, sädehoidon, kemoterapian, hoidon PD-1-inhibiittorilla ja/tai muun kasvaimen vastaisen hoidon;
- (b) potilaalla on uusiutumisen riski;
- (c) potilaalla on aiempi leikkauksen jälkeinen uusiutumishistoria; ja/tai
- (d) potilas on saanut aikaisemmin elin- tai kudossiirteen.

- 4.** Farmaseuttinen koostumus jonkin patenttivaatimuksen 1–3 mukaiseen käyttöön, jolloin kukin PD-1-inhibiittorin annos käsittää farmaseuttisen koostumuksen yhden tai useamman intralesionaalisen injektion kasvaimen; jolloin valinnaisesti:
- 5 (a) annetaan vähintään kaksi intralesionaalista injektiota kasvaimen eri kohtiin;
- (b) annetaan kahdesta viiteen intralesionaalista injektiota kasvaimen kahdesta viiteen eri kohtaan;
- (c) annetaan vähintään yksi intralesionaalinen injektio kasvaimen yläpuoliskoon;
- (d) annetaan vähintään yksi intralesionaalinen injektio ihoon kasvaimen yläpuolelle;
- 10 ja/tai
- (e) annetaan vähintään yksi intralesionaalinen injektio kasvaimen ylempään ääripäähän, normaalilta näyttävän ihon rajapinnan viereen.
- 5.** Farmaseuttinen koostumus jonkin patenttivaatimuksen 1–4 mukaiseen käyttöön, jolloin:
- 15 (a) kasvaimen pinnan halkaisija on vähintään 1 cm; ja/tai
- (b) kasvaimen pinnan halkaisija on enintään 2 cm.
- 6.** Farmaseuttinen koostumus jonkin patenttivaatimuksen 1–5 mukaiseen käyttöön, jolloin kukin annos annetaan kerran päivässä, kahden päivän välein, kolmen päivän välein, neljän päivän välein, viiden päivän välein, kuuden päivän
- 20 välein, kerran viikossa tai kahdesti viikossa.
- 7.** Farmaseuttinen koostumus jonkin patenttivaatimuksen 1–6 mukaiseen käyttöön, jolloin:
- (a) kukin annos käsittää 5–200 mg PD-1-inhibiittoria; ja/tai
- (b) kukin annos käsittää 5 mg, 15 mg tai 44 mg PD-1-inhibiittoria.
- 25 **8.** Farmaseuttinen koostumus jonkin patenttivaatimuksen 1–7 mukaiseen käyttöön, jolloin:

(a) PD-1-inhibiittorin antaminen edistää kasvaimen regressiota, vähentää kasvainsolutaakkaa, vähentää kasvaintaakkaa ja/tai estää kasvaimen uusiutumista potilaalla;

(b) PD-1-inhibiittorin antaminen edistää vähintään noin 10 % enemmän kasvaimen regressiota kuin PD-1-inhibiittorin intravenöosi antaminen; ja/tai

(c) PD-1-inhibiittorin antaminen johtaa haittavaikutusten vähäisempään esiintymiseen, haittavaikutusten vähäisempään vaikeusasteeseen ja/tai vähäisempään toksisuuteen kuin PD-1-inhibiittorin intravenöosi antaminen.

9. Farmaseuttinen koostumus jonkin patenttivaatimuksen 1–8 mukaiseen käyttöön, joka käsittää lisäksi:

(a) kasvaimen poistamisen leikkaamalla vaiheen (b) jälkeen; ja/tai

(b) seuraavista valittavan toisen terapeuttisen aineen tai hoidon antamisen: leikkaus, sädehoito, kemoterapia, kortikosteroidi, anti-inflammatorinen lääke ja/tai niiden yhdistelmät; jolloin PD-1-inhibiittoria annetaan valinnaisesti:

(i) ennen toista terapeuttista ainetta tai hoitoa; tai

(ii) toisen terapeuttisen aineen tai hoidon jälkeen.

10. Farmaseuttinen koostumus jonkin patenttivaatimuksen 1–9 mukaiseen käyttöön, jolloin:

(a) HCDR1:llä on sekvenssin nro 3 mukainen aminohapposekvenssi; HCDR2:lla on sekvenssin nro 4 mukainen aminohapposekvenssi; HCDR3:lla on sekvenssin nro 5 mukainen aminohapposekvenssi; LCDR1:llä on sekvenssin nro 6 mukainen aminohapposekvenssi; LCDR2:lla on sekvenssin nro 7 mukainen aminohapposekvenssi; ja LCDR3:lla on sekvenssin nro 8 mukainen aminohapposekvenssi; ja/tai

(b) anti-PD-1-vasta-aine tai sen antigeeniä sitova fragmentti käsittää sekvenssien nro 1/2 mukaisen HCVR/LCVR-sekvenssiparin.

11. Farmaseuttinen koostumus jonkin patenttivaatimuksen 1–10 mukaiseen käyttöön, jolloin anti-PD-1-vasta-aine käsittää raskasketjun ja kevytketjun, jolloin:

(a) raskasketjulla on sekvenssin nro 9 mukainen aminohapposekvenssi;

(b) kevytketjulla on sekvenssin nro 10 mukainen aminohapposekvenssi; tai

(c) raskasketjulla on sekvenssin nro 9 mukainen aminohapposekvenssi ja kevytketjulla on sekvenssin nro 10 mukainen aminohapposekvenssi.

12. Farmaseuttinen koostumus jonkin patenttivaatimuksen 1–11 mukaiseen
5 käyttöön, jolloin PD-1-inhibiittori on semiplimabi tai sen bioekvivalentti.