

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

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

(10)

FI/EP2714004 T3

(12)

**EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION**

(45)

Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning -
Translation available to the public

15.07.2024

(97)

Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för
det europeiska patentet - Date of grant of European patent

15.05.2024

(51)

Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -
International patent classification

A61K 9/00 (2006 . 01)

A61K 9/127 (2006 . 01)

A61K 38/00 (2006 . 01)

A61K 47/10 (2017 . 01)

A61K 47/14 (2017 . 01)

A61K 47/24 (2006 . 01)

A61P 1/00 (2006 . 01)

A61P 1/12 (2006 . 01)

A61P 1/18 (2006 . 01)

A61P 3/04 (2006 . 01)

A61P 5/00 (2006 . 01)

A61P 5/02 (2006 . 01)

A61P 5/14 (2006 . 01)

A61P 5/46 (2006 . 01)

A61P 9/00 (2006 . 01)

A61P 9/10 (2006 . 01)

A61P 27/02 (2006 . 01)

A61P 35/00 (2006 . 01)

A61P 35/04 (2006 . 01)

A61P 43/00 (2006 . 01)

(96)

Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan -
European patent application

EP12731315.3

(22)

Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date

25.05.2012

(97)

Patenttihakemuksen julkiseksitulosopäivä - Patentansökans
publiceringsdag - Patent application available to the public

09.04.2014

(86)

Kansainvälinen hakemus - Internationell
ansökan - International application

25.05.2012 PCT/EP2012059917

(30)

Etuoikeus - Prioritet - Priority

25.05.2011 US US201161489886 P

(73)

Haltija - Innehavare - Holder

1• Camurus AB, Ideon Science Park, 223 70 Lund, (SE)

(72)

Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1• TIBERG, Fredrik, SE-223 70 Lund, (SE)

2• NISTOR, Catalin, SE-223 70 Lund, (SE)

3• JOHNSSON, Markus, SE-223 70 Lund, (SE)

(74)

Asiamies - Ombud - Agent

Novagraaf International SA, Chemin de l'Echo, 3, 1213 Onex, (CH)

(54)

Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

DEPOTPEPTIDIFORMULAATIOITA

CONTROLLED RELEASE PEPTIDE FORMULATIONS

DEPOTPEPTIDIFORMULAATIOITA

Patenttivaatimukset

- 5 **1.** Esiformulaatio, joka käsittää alhaisen viskositeetin seoksena
- a) 20–80 paino-% vähintään yhtä diasyyloglyserolia ja/tai tokoferolia
- b) 20–80 paino-% vähintään yhtä fosfatidyylikoliinia (PC)
- c) 5–20 paino-% vähintään yhtä bioyhteensopivaa, orgaanista
- monoalkoholiliuotinta, joka käsittää etanolia
- 10 d) 1,2–20 painoprosenttia polaarista liuotinta, joka on valittu vedestä,
- propyleeniglykolista tai niiden seoksista; ja
- e) vähintään yhtä somatostatiinianalogia;
- jolloin ainesosien a:b suhde on 40:60–54:46;
- jolloin esiformulaation viskositeetti on 0,1–5 000 mPas 20 °C:ssa;
- 15 jolloin esiformulaatio muodostaa tai pystyy muodostamaan vähintään yhden
- nestemäisen kiteisen faasin rakenteen joutuessaan ylimääräisen
- vesipitoisen nesteen kanssa.
- 20 **2.** Patenttivaatimuksen 1 mukainen esiformulaatio, jossa ainesosa a) käsittää
- glyserolidioleaatia (GDO).
- 3.** Patenttivaatimuksen 1 tai 2 mukainen esiformulaatio, jossa ainesosa b) käsittää
- soija-PC:n.
- 25 **4.** Jonkin patenttivaatimuksen 1–3 mukainen esiformulaatio, jossa ainesosa d)
- koostuu propyleeniglykolista.
- 5.** Jonkin patenttivaatimuksen 1–4 mukainen esiformulaatio, jossa mainittu
- somatostatiinianalogi on valittu somatostatiini 14:stä, somatostatiini 28:sta,
- 30 oktreotidista, lanreotidista, pasireotidista ja vapreotidista.
- 6.** Patenttivaatimuksen 5 mukainen esiformulaatio, jossa mainittu
- somatostatiinianalogi on oktreotidi.

7. Jonkin patenttivaatimuksen 6 mukainen esiformulaatio, joka käsittää lisäksi antioksidanttia, joka valitaan edullisesti askorbiinihaposta, EDTA:sta tai sitruunahaposta.

5 **8.** Patenttivaatimusten 1–7 mukainen esiformulaatio, jossa ainesosaa a) on 33–60 paino-%:n pitoisuutena.

9. Jonkin patenttivaatimuksen 1–8 mukainen esiformulaatio, jossa ainesosaa b) on 33–55 paino-%:n pitoisuutena.

10

10. Patenttivaatimusten 9 mukainen esiformulaatio, jossa ainesosaa c) on 5–18 paino-%:n, edullisesti 5–16 paino-%:n tai 8–15 paino-%:n pitoisuutena.

15

11. Patenttivaatimusten 1–10 mukainen esiformulaatio, jossa ainesosaa d) on 5–20 paino-%:n, edullisemmin 5–18 paino-%:n, edullisimmin 8–15 paino-%:n pitoisuutena.

20

12. Patenttivaatimusten 1–11 mukainen esiformulaatio, jossa ainesosaa e) on vähintään 1,8 paino-%:n pitoisuutena.

13. Jonkin patenttivaatimuksen 1–12 mukainen esiformulaatio, jossa ainesosien c:d suhde on 40:60–70:30.

25

14. Jonkin patenttivaatimuksen 13 mukainen esiformulaatio, jossa suhde a:b on 45:55–52:48, edullisesti 48:52–52:48.

15. Patenttivaatimuksen 1 mukainen esiformulaatio, joka käsittää

30

- a) 36–44 paino-% vähintään yhtä diasyyloglyserolia ja/tai tokoferolia
- b) 36–44 paino-% vähintään yhtä fosfatidyylikoliinia (PC)
- c) 3–18 paino-% vähintään yhtä bioyhteensopivaa, orgaanista monoalkoholiliuotinta, joka käsittää etanolia
- d) 5–18 paino-% polaarista liuotinta, joka on valittu vedestä, propyleeniglykolista tai niiden seoksista; ja
- e) 0,5–4 paino-% oktreotidia.

16. Patenttivaatimuksen 15 mukainen esiformulaatio, joka käsittää 1–3 paino-% oktreotidia.

5 **17.** Jonkin patenttivaatimuksen 1–7, 10, 11 tai 13–15 mukainen esiformulaatio, jolloin esiformulaation viskositeetti on 1–1 000 mPas 20 °C:ssa.

18. Patenttivaatimuksen 17 mukainen esiformulaatio, jossa esiformulaation viskositeetti on 10–750 mPas 20 °C:ssa.

10

19. Menetelmä sellaisen jonkin patenttivaatimuksen 1–18 mukaisen esiformulaation muodostamiseksi, joka soveltuu bioaktiivisen peptidiaineen antamiseen hoidettavalle (edullisesti nisäkkäälle), jolloin mainittu menetelmä käsittää sellaisen alhaisen viskositeetin seoksen muodostamisen, joka koostuu

15

a) 20–80 paino-%:sta vähintään yhtä diasyyloglyserolia ja/tai tokoferolia

b) 20–80 paino-%:sta vähintään yhtä fosfatidyylikoliinia (PC)

c) 5–20 paino-%:sta vähintään yhtä bioyhteensopivaa, orgaanista monoalkoholiliuotinta, joka käsittää etanolia

20

d) 1,2–20 paino-%:sta polaarista liuotinta, joka on valittu vedestä, propyleeniglykolista tai niiden seoksista

e) vähintään yhtä somatostatiinianalogia ja

f) mahdollisesti vähintään yhtä antioksidanttia;

jolloin ainesosien a:b suhde on 40:60–54:46;

ja vähintään yhden somatostatiinianalogin liuottamisen tai dispergoinnin

25

alhaisen viskositeetin seokseen tai ainakin yhteen ainesosista a), b), c), d) ja mahdollisesti f) ennen alhaisen viskositeetin seoksen muodostamista.

30

20. Jonkin patenttivaatimuksen 1–18 mukainen esiformulaatio käytettäväksi in vivo -depotannoksen muodostamisessa ainakin yhden sellaisen tautitilan hoitamiseksi, joka on valittu seuraavista: akromegalia, syövät, karsinoomat, melanoomat, vähintään yhtä somatostatiinireseptoria ilmentävät kasvaimet, sst(2)-positiiviset kasvaimet, sst(5)-positiiviset kasvaimet, eturauhassyövät, maha-suolikanavan ja haiman neuroendokriiniset (GEP NE) kasvaimet, karsinoidikasvaimet, insulinoomat, gastrinoomat, vasoaktiivisen intestinaalisen peptidin (VIP) kasvaimet

ja glukagonoomat, kohonnut kasvuhormonipitoisuus (GH), kohonnut insuliinin kaltaisen kasvutekijä I:n (IGF-I) pitoisuus, suonikohjun verenvuoto (erityisesti ruokatorvessa), kemoterapian aiheuttamat ruoansulatuskanavan ongelmat (kuten ripuli), lymforrea, diabeettinen retinopatia, kilpirauhaseen liittyvä silmäsairaus, 5 liikalihavuus, haimatulehdus ja liittyvät sairaudet.

21. Esitäytetty annostelulaite, joka sisältää mahdollisesti jonkin patenttivaatimuksen 1–18 mukaista esiformulaatiota, jolloin mainittu esiformulaatio tuottaa mainitun vaikuttavan aineen annoksen, joka on 1–10 mg/viikko.

22. Tarvikesarja, joka käsittää patenttivaatimuksen 21 mukaisen annostelulaitteen.