



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 2717914 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 39/395 (2006.01)
A61K 9/08 (2006.01)
A61K 47/30 (2006.01)
A61P 27/02 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2020.02.17
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2019.10.30
(86)	European Application Nr.	12829655.5
(86)	European Filing Date	2012.06.11
(87)	The European Application's Publication Date	2014.04.16
(30)	Priority	2011.06.10, US, 201161495672 P
(84)	Designated Contracting States:	AL ; AT ; BE ; BG ; CH ; CY ; CZ ; DE ; DK ; EE ; ES ; FI ; FR ; GB ; GR ; HR ; HU ; IE ; IS ; IT ; LI ; LT ; LU ; LV ; MC ; MK ; MT ; NL ; NO ; PL ; PT ; RO ; RS ; SE ; SI ; SK ; SM ; TR
(73)	Proprietor	Ramscor, Inc., 180 Sand Hill Circle, Menlo Park, California 94025, USA Icon Bioscience, Inc., 480 Pleasant Street, Suite B300, Watertown, MA 02472, USA
(72)	Inventor	WONG, Vernon, 180 Sand Hill Circle, Menlo Park, CA 94025, USA WOOD, Louis, "-", deceased, USA HUANG, Glenn, 513 Lower Vintners Circle, Fremont, CA 94539, USA
(74)	Agent or Attorney	TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

(54)	Title	SUSTAINED RELEASE FORMULATIONS FOR DELIVERY OF PROTEINS TO THE EYE AND METHODS OF PREPARING SAME
------	-------	---

(56)	References Cited:	US-B2- 7 550 441 US-A1- 2004 001 889 WO-A2-2008/057867 US-A1- 2008 038 316 Anand Om: "Controlled release of insulin and modified insulin from a novel injectable biodegradable gel", The University of Tennessee Health Science Center (Dissertation) , 2008, pages 1-119, XP002737685, Retrieved from the Internet: URL: http://search.proquest.com/docview/304177528 [retrieved on 2015-03-23] NORIYUKI KUNO ET AL: "Recent Advances in Ocular Drug Delivery Systems", POLYMERS, vol. 3, no. 1, 6 January 2011 (2011-01-06) , pages 193-221, XP055030988, DOI: 10.3390/polym3010193 TIVADAR FECZK RECENT PATENTS ON MATERIALS SCIENCE vol. 2, 2009, pages 32 - 42, XP055137948
------	----------------------	---

Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters concerning the validity of the patent, language of the application/patent granted at the EPO will be used as the basis for the decision. The patent documents published by the EPO are available through Espacenet (<http://worldwide.espacenet.com>) or via the search engine on our website here: <https://search.patentstyret.no/>

Patentkrav

1. Flytende farmasøytisk formulering for injeksjon i øyet for vedvarende frigjøring av et terapeutisk protein, omfattende:

- 5 terapeutisk protein;
flytende, biologisk nedbrytbar, biokompatibel ikke-polymerisk eksipiens valgt fra gruppen som består av trietylcitrat og acetyltrietylcitrat; og
biologisk nedbrytbar, biokompatibel poly(D,L-laktid-ko-glykolid) (PLGA)-polymer, hvori PLGA-polymeren har et laktid:glykolid-forhold på 50:50, MWp-område 7 000-17 000, og
10 en alkylesterendegruppe;
hvori forholdet mellom ikke-polymerisk eksipiens:polymer er 90:10 til 99:1 vekt-%, inklusive;
hvori ved og etter injeksjon av 5 µl til 100 µl, inklusive, av formuleringen gjennom en nål av størrelse 25, 27, 28, 30 eller mindre, opprettholder formuleringen sin monolittiske
15 integritet og flytende tilstand; og
hvori formuleringen frigjør det terapeutiske proteinet i en periode på minst 14 dager.

- 2.** Den flytende farmasøytiske formuleringen ifølge krav 1, hvori formuleringen er en enhetsdosering på 5 til 100 µl for injeksjon i øyets bindehinne (subkonjunktiva),
20 periokulært rom, retrobulbært i banen, episclera, i hornhinnen, i senehinnen, fremre kammer, fremre segment, bakkammer, bakre segment, glasslegemehulrom, subretinalt område, suprakorodiale segment eller intraretinalt område i øyet.

- 3.** Den flytende farmasøytiske formuleringen ifølge krav 1, hvori det terapeutiske
25 proteinet er et antistoff.

- 4.** Injiserbar flytende formulering for anvendelse i behandling av en sykdom i øyet til et individ med behov derav, omfattende en terapeutisk effektiv mengde av den flytende farmasøytiske formuleringen ifølge et hvilket som helst foregående krav, hvori
30 formuleringen sørger for vedvarende frigjøring av et terapeutisk protein som hemmer angiogenese.

- 5.** Flytende farmasøytisk formulering for injeksjon i øyet for vedvarende frigjøring av et terapeutisk protein, omfattende:
35 terapeutisk protein;
flytende, biologisk nedbrytbar, biokompatibel ikke-polymerisk eksipiens, hvori eksipiensen er benzybenzoat; og

biologisk nedbrytbar, biokompatibel poly(D,L-laktid-ko-glykolid) (PLGA)-polymer, hvori PLGA-polymeren har et laktid:glykolid-forhold på 50:50, MW-område 7 000-17 000, og en alkylesterendegruppe;

hvori forholdet mellom ikke-polymerisk eksipiens:polymer er 90:10 til 99:1 vekt-%,

5 inklusive;

hvori ved og etter injeksjon av 5 µl til 100 µl, inklusive, av formuleringen gjennom en nål av størrelse 25, 27, 28, 30 eller mindre, opprettholder formuleringen sin monolittiske integritet og flytende tilstand; og

hvori formuleringen frigjør det terapeutiske proteinet i en periode på minst 14 dager.