



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3091029 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61P 37/08 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2023.03.13
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2022.12.28
(86)	European Application Nr.	16169916.0
(86)	European Filing Date	2012.10.30
(87)	The European Application's Publication Date	2016.11.09
(30)	Priority	2011.10.31, US, 201161553916 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	F. Hoffmann-La Roche AG, Grenzacherstrasse 124, 4070 Basel, Sveits
(72)	Inventor	DESHMUKH, Ajay, c/o Genentech, Inc. 1 DNA Way, South San Francisco, CA 94080, USA ZEID, Joumana, c/o Genentech, Inc., South San Francisco, CA 94080, USA SCHERER, Thomas M., c/o Genentech, Inc., South San Francisco, CA 94080, USA
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54) Title **ANTI-IL13 ANTIBODY FORMULATIONS**

(56) References
Cited:

WO-A2-2007/076062, WO-A2-2006/044908, WO-A2-2005/062967,
VEYSEL KAYSER ET AL: "Glycosylation influences on the aggregation propensity of therapeutic monoclonal antibodies", BIOTECHNOLOGY JOURNAL, vol. 6, no. 1, 14 January 2011 (2011-01-14), pages 38-44, XP055188291, ISSN: 1860-6768, DOI: 10.1002/biot.201000091
KAI ZHENG ET AL: "Influence of glycosylation pattern on the molecular properties of monoclonal antibodies", MABS, vol. 6, no. 3, 24 March 2014 (2014-03-24), pages 649-658, XP055507193, US ISSN: 1942-0870, DOI: 10.4161/mabs.28588
AKERS MICHAEL J ET AL: "FORMULATION DEVELOPMENT OF PROTEIN DOSAGE FORMS", PHARMACEUTICAL BIOTECHNOLOGY, KLUWER, DORDRECHT, NL, vol. 14, 1 January 2002 (2002-01-01), pages 47-127, XP001537612, ISSN: 1078-0467
KAI ZHENG ET AL: "The impact of glycosylation on monoclonal antibody conformation and stability", MABS, vol. 3, no. 6, 1 November 2011 (2011-11-01), pages 568-576, XP055084671, ISSN: 1942-0862, DOI: 10.4161/mabs.3.6.17922
CORREN JONATHAN ET AL: "Lebrikizumab Treatment in Adults with Asthma", NEW ENGLAND JOURNAL OF MEDICINE, MASSACHUSETTS MEDICAL SOCIETY, US, vol. 365, no. 12, 22 September 2011 (2011-09-22), pages 1088-1098, XP055188240, ISSN: 0028-4793
ANONYMOUS: "Recommended International Nonproprietary Names, List 63", WHO DRUG INFORMATION, vol. 24, no. 1, 1 January 2010 (2010-01-01), pages 1-80, XP055506826,
CARPENTER J F ET AL: "Rational design of stable lyophilized protein formulations: Some practical advice", PHARMACEUTICAL RESEARCH, SPRINGER NEW YORK LLC, US, vol. 14, no. 8, 1 January 1997 (1997-01-01), pages 969-975, XP002303280, ISSN: 0724-8741, DOI: 10.1023/A:1012180707283

Ramesh S Kashi: "Challenges in the Development of Stable Protein Formulations for Lung Delivery", , 9 September 2011 (2011-09-09), XP055187174, AAPS Symposium, Baltimore, MD Retrieved from the Internet: URL:https://www.aaps.org/uploadedFiles/Content/Sections_and_Groups/Focus_Groups/INTF_GKashiSep2011.pdf [retrieved on 2015-05-04]

MARTIN S. NEERGAARD ET AL: "Stability of Monoclonal Antibodies at High-Concentration: Head-to-Head Comparison of the IgG 1 and IgG 4 Subclass", JOURNAL OF PHARMACEUTICAL SCIENCES, vol. 103, no. 1, 26 November 2013 (2013-11-26), pages 115-127, XP055160507, ISSN: 0022-3549, DOI: 10.1002/jps.23788

WANG WEI ED - BARRATT GILLIAN ET AL: "Instability, stabilization, and formulation of liquid protein pharmaceuticals", INTERNATIONAL JOURNAL OF PHARMACEUTICS, ELSEVIER BV, NL, vol. 185, no. 2, 20 August 1999 (1999-08-20), pages 129-188, XP002323952, ISSN: 0378-5173, DOI: 10.1016/S0378-5173(99)00152-0

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/>

EP3091029

1

Patentkrav

- 5 **1.** Formulering omfattende et anti-IL13-antistoff, hvori konsentrasjonen av antistoff i formuleringen er minst 100 mg/ml og viskositeten til formuleringen er mindre enn 15 centipoise (cP) ved 25 °C, hvori anti-IL13-antistoffet omfatter en tung kjede som har aminosyresekvensen ifølge SEQ ID NO: 10 og en lett kjede som har aminosyresekvensen ifølge SEQ ID NO: 14, og hvori formuleringen omfatter mellom 5 mM og 40 mM histidinacetatbuffer, pH 5,4 til 6,0, og et polyol og et overflateaktivt middel, hvori konsentrasjonen av polyolet i formuleringen er mellom 100 mM og 200 mM og konsentrasjonen av det overflateaktive midlet i formuleringen er mellom 0,01 % og 0,1 %, hvori polyolet er sukrose og det overflateaktive midlet er polysorbat 20.
- 10 **2.** Formuleringen ifølge krav 1, hvori konsentrasjonen av antistoff er 125 mg/ml.
- 15 **3.** Formuleringen ifølge krav 1, hvori konsentrasjonen av antistoff er 150 mg/ml.
- 20 **4.** Formuleringen ifølge krav 1, hvori histidinacetatbufferen er pH 5,7 og histidinacetatkonsentrasjonen i bufferen er 20 mM, og hvori konsentrasjonen av sukrose i formuleringen er 175 mM og konsentrasjonen av polysorbat 20 er 0,03 %.
- 25 **5.** Formuleringen ifølge krav 4, hvori konsentrasjonen av antistoff er 125 mg/ml.
- 6.** Formuleringen ifølge krav 4, hvori konsentrasjonen av antistoff er 150 mg/ml.
- 7.** Gjenstand for fremstilling omfattende formuleringen ifølge et hvilket som helst av kravene 1–6 og en subkutan administreringsanordning.
- 30 **8.** Gjenstanden for fremstillingen ifølge krav 7, hvori den subkutane administreringsanordningen omfatter en forhåndsfylt sprøyte.
- 9.** Gjenstanden for fremstillingen ifølge krav 8, hvori den forhåndsfylte sprøyten omfatter et glassrør, en nål og et nåleskjold.
- 35

EP3091029

2

10. Gjenstanden for fremstillingen ifølge krav 9, videre omfattende en stempelstang og en stempelstopper.

5 **11.** Gjenstanden for fremstillingen følge krav 10, videre omfattende en nålsikkerhetsanordning.

10 **12.** Gjenstanden for fremstillingen ifølge et hvilket som helst av kravene 9–11, hvori glassrøret omfatter borosilikatglass og inneholder 0,3 ml, 1,0 ml eller 2,0 ml av formuleringen.

13 **13.** Gjenstanden for fremstillingen ifølge et hvilket som helst av kravene 9–12, hvori nålen er innsatt, rustfritt stål, 27G tynnvegget, 1/2 tomme lang og 5-faset spiss.

15 **14.** Formulering ifølge et hvilket som helst av kravene 1–6 for anvendelse i behandlingen av astma.

20 **15.** Formuleringen for anvendelse ifølge krav 14, hvori formuleringen administreres i en mengde på 0,3 ml, én ml eller to ml.

20 **16.** Formulering ifølge et hvilket som helst av kravene 1–6 for anvendelse i behandlingen av idiopatisk lungefibrose.

25 **17.** Formuleringen for anvendelse ifølge krav 16, hvori formuleringen administreres i en mengde på 0,3 ml, én ml eller to ml.

30 **18.** Formulering ifølge et hvilket som helst av kravene 1–6 for anvendelse i behandlingen av atopisk dermatitt.