



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3157527 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

A61K 31/5377 (2006.01)

A61K 31/4412 (2006.01)

A61K 31/444 (2006.01)

A61P 35/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2023.08.07
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2023.05.24
(86)	European Application Nr.	15809540.6
(86)	European Filing Date	2015.06.17
(87)	The European Application's Publication Date	2017.04.26
(30)	Priority	2014.06.17, US, 201462013522 P 2014.08.12, US, 201462036265 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
	Designated Extension States:	BA; ME
(73)	Proprietor	Epizyme, Inc., 400 Technology Square, 4th Floor, Cambridge, MA 02139, USA Eisai R&D Management Co., Ltd., 6-10, Koishikawa 4-chome, Bunkyo-ku, Tokyo 112-8088, Japan
(72)	Inventor	KEILHACK, Heike, 3 Falmouth Street, Belmont, Massachusetts 02478, USA OTTESEN, Lone, 8 Estelle Road FlatC, London, NW3 2JY, Storbritannia REYDERMAN, Larisa, 40 High Tor Dr., Watchung, NJ 07069, USA JOHNSTON, L. Danielle, 400 Technology Square, 4th Floor, Cambridge, MA 02139, USA KNUTSON, Sarah K., 26 Deerhaven Road, Lincoln, MA 01773, USA
(74)	Agent or Attorney	BRYN AARFLOT AS, Stortingsgata 8, 0161 OSLO, Norge

(54)	Title	EZH2 INHIBITORS FOR TREATING LYMPHOMA
(56)	References Cited:	US-A1- 2013 303 555, WO-A2-2014/062720, WO-A1-2014/194254, WO-A1-2014/071109, WO-A1-2013/138361, KNUTSON, SK ET AL.: 'Selective Inhibition of EZH2 by EPZ-6438 Leads to Potent Antitumor Activity in EZH2-Mutant Non-Hodgkin Lymphoma.' MOLECULAR CANCER THERAPEUTICS vol. 13, 21 February 2014, pages 842 - 854, XP055247668 DYER, MJS ET AL.: 'A New Human B- Cell Non-Hodgkin's Lymphoma Cell Line (Karpas 422) Exhibiting Both t(14; 18) and t(4;11) Chromosomal Translocations.' BLOOD vol. 75, 1990, pages 709 - 714, XP055247666 'View of NCT01897571 on 2014_03_27 on ClinicalTrials.gov Archive. Study of E7438 (EZH2 Histone Methyl Transferase [HMT] Inhibitor) as a Single Agent in Subjects With Advanced Solid Tumors or With B Cell Lymphomas.', [Online] 27 March 2014, XP055247664 Retrieved from the Internet: <URL:https://clinicaltrials.gov/archive/NCT 01897571/2014_03_27> [retrieved on 2015-07-09] 'Study of E7438 (EZH2 Histone Methyl Transferase [HMT] Inhibitor) as a Single Agent in Subjects With Advanced Solid Tumors or With B Cell Lymphomas (AN: NCT01897571)', Clinical Trials Gov., 27 March 2014 (2014-03-27), pages 1-8, XP055247664, Retrieved from the Internet: URL:https://clinicaltrials.gov/archive/NCT 01897571/2014_03_27 [retrieved on 2016-02-04]

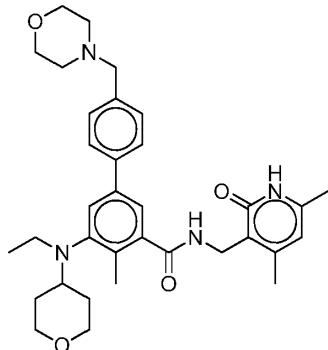
HASSAN, U ET AL.: 'Prognostic Sub-Grouping of Diffuse Large B- Cell Lymphomas into Germinal Centre And Post Germinal Centre Groups by Immunohistochemistry after 6 Cycles of Chemotherapy.' ASIAN PACIFIC JOURNAL OF CANCER PREVENTION. vol. 13, 2012, pages 1341 - 1347, XP055247670

S. K. KNUTSON ET AL: "Selective Inhibition of EZH2 by EPZ-6438 Leads to Potent Antitumor Activity in EZH2-Mutant Non-Hodgkin Lymphoma", MOLECULAR CANCER THERAPEUTICS, vol. 13, no. 4, 1 April 2014 (2014-04-01), pages 842-854, XP055247668, US ISSN: 1535-7163, DOI: 10.1158/1535-7163.MCT-13-0773

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. EZH2-inhibitor for anvendelse i behandling av et non-Hodgkins lymfom (NHL) hvori NHL er diffust storcellet B-cellelymfom (DLBCL), og hvori EZH2-inhibitoren er EPZ-6438 som har den følgende formelen:



5 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav.

2. EZH2-inhibitoren for anvendelse ifølge krav 1, hvori NHL er en EZH2 villtype NHL.

10 3. EZH2-inhibitoren for anvendelse ifølge krav 1, hvori NHL er en EZH2-mutant NHL.

4. EZH2-inhibitoren for anvendelse ifølge krav 1, hvori NHL er et avledet lymfom fra et germinalt senter.

15 5. EZH2-inhibitoren for anvendelse ifølge krav 1, hvori NHL er et avledet lymfom fra et ikke-germinalt senter.

6. EZH2-inhibitoren for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–5, hvori EZH2-inhibitoren administreres oralt.

20 7. EZH2-inhibitoren for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–6, hvori EZH2-inhibitoren administreres til individet i en dose på ca. 100 mg til ca. 3200 mg daglig.

25 8. EZH2-inhibitoren for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–7, hvori EZH2-inhibitoren administreres til individet i en dose på ca. 100 mg BID til ca. 1600 mg BID.

9. EZH2-inhibitoren for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–8, hvori EZH2-inhibitoren administreres til individet i en dose på ca. 100 mg BID, 200 mg BID, 400 mg BID, 800 mg BID eller ca. 1600 mg BID.
- 5 10. EZH2-inhibitoren for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–9, hvori EZH2-inhibitoren administreres til individet i en dose på ca. 800 mg BID.
11. EZH2-inhibitoren for anvendelse ifølge krav 1, hvori en terapeutisk effektiv mengde av EZH2-inhibitoren administreres til et individ med behov derav.
- 10 12. EZH2-inhibitoren for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–11, hvori EZH2-inhibitoren administreres som en del av en kombinasjonsterapi med andre biologisk aktive bestanddeler og ikke-legemiddelterapi, for eksempel kirurgi eller stråling.
- 15 13. EZH2-inhibitoren for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–11, i kombinasjon med (i) ett eller flere andre terapeutiske midler; eller (ii) strålebehandling.
14. EZH2-inhibitoren for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–13, hvori individet uttrykker en mutant EZH2 eller en villtype EZH2; eller hvori individet har en mutasjon
- 20 i EZH2-genet eller har et villtype EZH2-gen.
15. EZH2-inhibitoren for anvendelse ifølge et hvilket som helst av kravene 1–14, hvori individet er et menneske.