



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3372232 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 31/7068 (2006.01)
A61K 9/127 (2006.01)
A61K 31/337 (2006.01)
A61K 47/24 (2006.01)
A61K 47/28 (2006.01)
A61K 47/64 (2017.01)
A61P 35/00 (2006.01)
A61P 43/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2021.08.02
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2021.04.14
(86)	European Application Nr.	16862068.0
(86)	European Filing Date	2016.11.01
(87)	The European Application's Publication Date	2018.09.12
(30)	Priority	2015.11.02, JP, 2015215768
(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	FUJIFILM Corporation, 26-30, Nishiazabu 2-chome, Minato-ku, Tokyo 106-8620, Japan
(72)	Inventor	KITAHASHI, Tsukasa, c/o FUJIFILM Corporation577UshijimaKaisei-machi, Ashigarakami-gun Kanagawa 258-8577, Japan MIMA, Shinji, c/o FUJIFILM Corporation577UshijimaKaisei-machi, Ashigarakami-gun Kanagawa 258-8577, Japan MATSUMOTO, Takeshi, c/o FUJIFILM Corporation577UshijimaKaisei-machi, Ashigarakami-gun Kanagawa 258-8577, Japan SEKIGUCHI, Takahiro, c/o FUJIFILM Corporation577UshijimaKaisei-machi, Ashigarakami-gun Kanagawa 258-8577, Japan MORI, Mikinaga, c/o FUJIFILM Corporation577UshijimaKaisei-machi, Ashigarakami-gun Kanagawa 258-8577, Japan
(74)	Agent or Attorney	TANDBERG INNOVATION AS, Postboks 1570 Vika, 0118 OSLO, Norge

(54)	Title	TUMOR THERAPEUTIC AGENT COMPRISING GEMCITABINE LIPOSOME COMPOSITION AND KIT
(56)	References Cited:	EP-A1- 3 138 557 JP-A- 2015 514 109

US-A1- 2005 249 795

WO-A1-2014/110555

WO-A1-2015/166987

WO-A2-2005/000266

WO-A1-2017/192863

WO-A1-2015/166985

WO-A1-2005/021012

HIDEKI UENO ET AL.: 'Systemic chemotherapy for advanced pancreatic cancer' JOURNAL OF CLINICAL AND EXPERIMENTAL MEDICINE vol. 252, no. 8, 21 February 2015, pages 887 - 892, XP009506356

ANNE-LAURE PAPA ET AL: "PEGylated liposomal Gemcitabine: insights into a potential breast cancer therapeutic", CELLULAR ONCOLOGY, vol. 36, no. 6, 1 October 2013 (2013-10-01), pages 449-457, XP055511227, Dordrecht ISSN: 2211-3428, DOI: 10.1007/s13402-013-0146-4

VON HOFF D. DANIEL ET AL.: 'Increased Survival in Pancreatic Cancer with nabPaclitaxel plus Gemcitabine' N ENGL J MED. vol. 369, no. 18, 2013, pages 1691- 1703, XP055250743

LIBOIRON D. BARRY ET AL.: 'Nanoscale delivery systems for combination chemotherapy' DRUG DELIVERY IN ONCOLOGY vol. 2, 2012, pages 1013- 1050, XP055384114

COSCO DONATO ET AL.: 'In vivo activity of gemcitabine-loaded PEGylated small unilamellar liposomes against pancreatic cancer' CANCER CHEMOTHER PHARMACOL vol.64, no. 5, 2009, pages 1009 - 1020, XP019738527

ZHOU Q ET AL: "Analysis of gemcitabine liposome injection by HPLC with evaporative light scattering detection", JOURNAL OF LIPOSOME RESEARCH, TAYLOR & FRANCIS, PHILADELPHIA, PA, US, vol. 22, no. 4, 1 January 2012 (2012-01-01), pages 263-269, XP009508406, ISSN: 0898-2104, DOI: 10.3109/08982104.2012.668553 [retrieved on 2012-03-20]

DONATO COSCO ET AL: "Liposomes as multicompartamental carriers for multidrug delivery in anticancer chemotherapy", DRUG DELIVERY AND TRANSLATIONAL RESEARCH, vol. 1, no. 1, 1 February 2011 (2011-02-01), pages 66-75, XP055384113, Germany ISSN: 2190-393X, DOI: 10.1007/s13346-010-0007-x

COSCO DONATO ET AL.: 'Liposomes as multicompartamental carriers for multidrug delivery in anticancer chemotherapy' DRUG DELIVERY AND TRANSLATIONAL RESEARCH vol. 1, no. 1, 2011, pages 66 - 75, XP055384113

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. Terapeutisk tumormiddel oppnådd ved å kombinere et taksan-antitumormiddel med
5 en liposomsammensetning der gemcitabin eller et salt derav inneholdes i et liposom,
hvor
taksanantitumormidlet er nab-paklitaksel,
et innholdsforhold av kolesteroler til en total mengde av et lipid som danner liposomet er
10 10 mol-% til 35 mol-%,
lipidet som danner liposomet inneholder hydrogenert soyabønnefosfatidylkolin, og et
osmotisk trykk av en indre vandig fase av liposomet er 2 til 8 ganger et osmotisk trykk
av en ytre vandig fase av liposomet.
2. Det terapeutiske tumormidlet ifølge krav 1,
15 hvor liposomet er en enkelt lamell.
3. Det terapeutiske tumormidlet ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 2,
hvor en frigjøringsrate for gemcitabinet eller saltet derav fra liposomsammensetningen i
plasma er 10 masse-%/24 timer til 70 masse-%/24 timer.
20
4. Det erapeutiske tumormidlet ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 3,
hvor lipidet som danner liposomet inneholder hydrogenert soyabønnefosfatidylkolin, 1,2-
distearoyl-3-fosfatidyletanolamin-polyetylenglykol og kolesterol.
- 25 5. Det terapeutiske tumormidlet ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 4,
hvor en gjennomsnittlig partikkeldiameter av liposomet er 2 nm til 200 nm.
6. Sett omfattende:
en liposomsammensetning der gemcitabin eller et salt derav er inneholdt i et liposom; og
30 et taksanantitumormiddel, hvor
taksanantitumormidlet er nab-paklitaksel
et innholdsforhold av kolesteroler til en total mengde av et lipid som danner liposomet er
10 mol-% til 35 mol-%,
lipidet som danner liposomet inneholder hydrogenert soyabønnefosfatidylkolin, og et
35 osmotisk trykk av en indre vandig fase av liposomet er 2 til 8 ganger et osmotisk trykk
av en ytre vandig fase av liposomet.