



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3421051 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 47/64 (2017.01)
A61K 39/09 (2006.01)
A61K 39/095 (2006.01)
A61P 31/04 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2020.09.14
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.05.13
(86)	European Application Nr.	18183661.0
(86)	European Filing Date	2013.08.12
(87)	The European Application's Publication Date	2019.01.02
(30)	Priority	2012.08.16, US, 201261684043 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
(62)	Divided application	EP2885007, 2013.08.12
(73)	Proprietor	Pfizer Inc., 235 East 42nd Street, New York, NY 10017, USA
(72)	Inventor	GU, Jianxin, 267 Voorhis Avenue, River Edge, NJ 07661, USA KIM, Jin-hwan, 44 Somerset Drive, Suffern, NY 10901, USA PRASAD, Krishna A., 105 Worsham Drive, Chapel Hill, NC 27516, USA YANG, Yu-ying, 154 Pepper Ridge RoadUnit 11, Stamford, CT 06905, USA
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 2003 Vika, 0125 OSLO, Norge

(54)	Title	GLYCOCONJUGATION PROCESSES AND COMPOSITIONS
(56)	References Cited:	US-A1- 2007 141 077 WO-A1-2008/157590 WO-A2-2007/071707

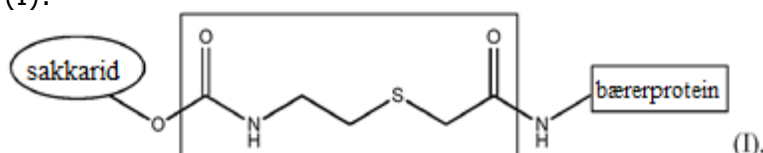
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters 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/>

[P3421051]

1

Patentkrav

1. (2-((2-oksoetyl)tio)etyl)karbamat (eTEC) -bundet glykokonjugat ifølge formel (I):



der atomene som omfatter eTEC-spaceren er rommet i en midtre boks.

2. Glykokonjugatet ifølge krav 1, hvori sakkaridet er et polysakkarid, et oligosakkarid eller et monosakkarid.

3. Glykokonjugatet ifølge krav 1, hvori sakkaridet er et bakterielt kapsulært polysakkarid.

4. Glykokonjugatet ifølge krav 3, hvori det bakterielle polysakkaridet er et kapsulært pneumokokk-polysakkarid valgt fra gruppen bestående av kapsulære polysakkarider av pneumokokk-serotype 1, 3, 4, 5, 6A, 6B, 7F, 8, 9V, 10A, 11A, 12F, 14, 15B, 18C, 19A, 19F, 22F, 23F og 33F.

5. Glykokonjugatet ifølge krav 3, hvori det bakterielle polysakkaridet er et kapsulært pneumokokk-polysakkarid fra serotype 33F.

6. Glykokonjugatet ifølge et hvilket som helst av kravene 3 til 5, hvori polysakkaridet har en molekylvekt på mellom 10 kDa og 2000 kDa.

7. Glykokonjugatet ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6, hvori glykokonjugatet har en molekylvekt på mellom 50 kDa og 20 000 kDa.

8. Glykokonjugatet ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 6, hvori glykokonjugatet har en molekylvekt på mellom 1000 kDa og 3000 kDa.

9. Glykokonjugatet ifølge et hvilket som helst av kravene 3 til 8, hvori polysakkaridet har en O-acetyleringsgrad på mellom 75 og 100 %.

[P3421051]

2

10. Glykokonjugatet ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 9, hvori bærerproteinet er CRM₁₉₇.

5 **11.** Glykokonjugatet ifølge krav 10, hvori CRM₁₉₇ omfatter 2 til 20 lysinrester kovalent bundet til polysakkaridet gjennom en eTEC-spacer.

12. Glykokonjugatet ifølge krav 10, hvori CRM₁₉₇ omfatter 4 til 16 lysinrester kovalent bundet til polysakkaridet gjennom en eTEC-spacer.

10 **13.** Glykokonjugatet ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 12, hvori forholdet sakkarid: bærerprotein (vekt/vekt) er mellom 0,2 og 4.

14. Glykokonjugatet ifølge krav 13, hvori forholdet sakkarid: bærerprotein (vekt/vekt) er mellom 0,4 og 1,7.

15

15. Glykokonjugatet ifølge et hvilket som helst av kravene 3 til 14, omfattende minst én kovalent binding mellom bærerproteinet og polysakkaridet for hver 4., 10., 15. eller 25. sakkaridrepetisjonsenhet av polysakkaridet.

20

16. Glykokonjugatet ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 15, som omfatter mindre enn 15 % fritt sakkarid sammenlignet med den totale mengden sakkarid.

17. Glykokonjugatet ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 16, som har en molekylstørrelsesfordeling (K_d) på ≥ 35 % ved $\leq 0,3$.

25

18. Immunogen sammensetning omfattende glykokonjugatet ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 17 og en farmasøytisk akseptabel eksipient, bærer eller tynner.

30

19. Den immunogene sammensetningen ifølge krav 18, ytterligere omfattende et ytterligere glykokonjugat av et kapsulært polysakkarid avledet fra *S. pneumonia* valgt fra gruppen bestående av pneumokokk-serotype 1, 3, 4, 5, 6A, 6B, 7F, 8, 9V, 10A, 11A, 12F, 14, 15B, 18C, 19A, 19F, 22F, 23F og 33F kapsulære polysakkarider.

35

20. Den immunogene sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 18 til 19, ytterligere omfattende en adjuvant.

[P3421051]

3

21. Den immunogene sammensetningen ifølge krav 20, hvori adjuvanten er valgt fra gruppen bestående av aluminiumfosfat, aluminiumsulfat og aluminiumhydroksid.

5

22. Den immunogene sammensetningen ifølge et hvilket som helst av kravene 18 til 21 for anvendelse som medikament.