



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 3470086 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl.
A61K 47/68 (2017.01)
A61P 35/00 (2006.01)
A61P 39/00 (2006.01)
C07D 519/00 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

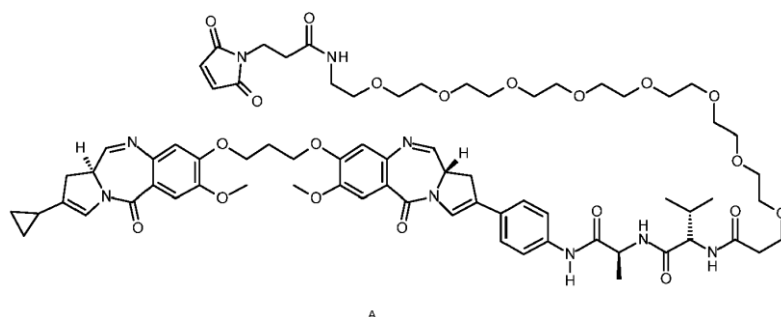
(45)	Translation Published	2021.04.12
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2020.11.25
(86)	European Application Nr.	18187765.5
(86)	European Filing Date	2013.10.11
(87)	The European Application's Publication Date	2019.04.17
(30)	Priority	2012.10.12, US, 201261712924 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	EP2906248, 2013.10.11
(73)	Proprietor	MEDIMMUNE LIMITED, Milstein Building Granta Park, CambridgeCB21 6GH, Storbritannia
(72)	Inventor	Howard, Philip Wilson, MedImmune LimitedMilstein Building Granta Park, Cambridge, CB21 6GH, Storbritannia
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54)	Title	PYRROLOBENZODIAZEPINES AND CONJUGATES THEREOF
(56)	References Cited:	WO-A1-2011/130616 WO-A1-2013/041606

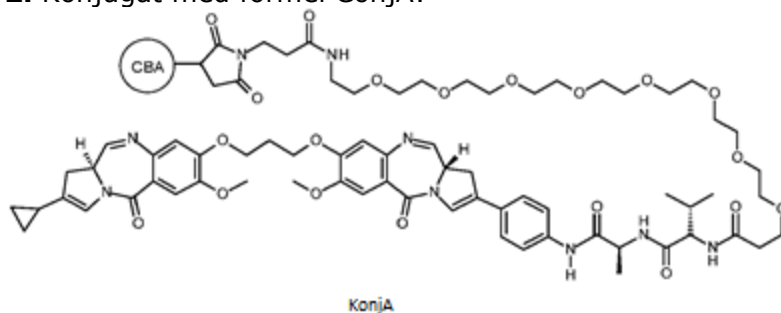
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters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

[EP3470086]

1

Patentkrav**1. Forbindelse som er A:**

og salter og solvater derav.

2. Konjugat med formel ConjA:

der CBA representerer et cellebindende middel.

3. Konjugatet ifølge krav 2, hvori det cellebindende middelet er et antistoff eller antistoffragment for et tumour-assosiert antigen.

4. Konjugatet ifølge krav 3, hvori antistoffet eller antistoffragmentet er et antistoff som binder til ett eller flere tumorassosierte antigener eller celleoverflatereseptorer valgt fra (1)-(88):

- (1)** BMPR1B;
- (2)** E16;
- (3)** STEAP1;
- (4)** 0772P;
- (5)** MPF;

[EP3470086]

2

- 5 **(6)** Napi3b;
 (7) Sema 5b;
 (8) PSCA hlg;
 (9) ETBR;
 (10) MSG783;
 (11) STEAP2;
 (12) TrpM4;
 (13) CRIPTO;
10 **(14)** CD21;
 (15) CD79b;
 (16) FcRH2;
 (17) HER2;
 (18) NCA;
 (19) MDP;
15 **(20)** IL20R-alfa;
 (21) Brevican;
 (22) EphB2R;
 (23) ASLG659;
 (24) PSCA;
20 **(25)** GEDA;
 (26) BAFF-R;
 (27) CD22;
 (28) CD79a;
 (29) CXCR5;
25 **(30)** HLA-DOB;
 (31) P2X5;
 (32) CD72;
 (33) LY64;
 (34) FcRH1;
30 **(35)** IRTA2;
 (36) TENB2;
 (37) PSMA - FOLH1;
 (38) SST;

[EP3470086]

3

- (38.1) SSTR2;
(38.2) SSTR5;
(38.3) SSTR1;
(38.4) SSTR3;
5 (38.5) SSTR4;
(39) ITGAV;
(40) ITGB6;
(41) CEACAM5;
(42) MET;
10 **(43)** MUC1;
(44) CA9;
(45) EGFRvIII;
(46) CD33;
(47) CD19;
15 **(48)** IL2RA;
(49) AXL;
(50) CD30 - TNFRSF8;
(51) BCMA - TNFRSF17;
(52) CT Ags - CTA;
20 **(53)** CD174 (Lewis Y) - FUT3;
(54) CLEC14A;
(55) GRP78 - HSPA5;
(56) CD70;
(57) stamcellespesifikke antigener;
25 **(58)** ASG-5;
(59) ENPP3;
(60) PRR4;
(61) GCC - GUCY2C;
(62) Liv-1 - SLC39A6;
30 **(63)** 5T4;
(64) CD56 - NCMA1;
(65) CanAg;
(66) FOLR1;

[EP3470086]

4

- (67)** GPNMB;
(68) TIM-1 - HAVCR1;
(69) RG-1/prostatatumormål mindin - mindin/RG-1;
(70) B7-H4 - VTCN1;
(71) PTK7;
(72) CD37;
(73) CD138 - SDC1;
(74) CD74;
(75) Claudiner - CLs;
(76) EGFR;
(77) Her3;
(78) RON - MST1R;
(79) EPHA2;
(80) CD20 - MS4A1;
(81) Tenascin C - TNC;
(82) FAP;
(83) DKK-1;
(84) CD52;
(85) CS1 - SLAMF7;
(86) Endoglin - ENG;
(87) Annexin A1 - ANXA1;
(88) V-CAM (CD106) - VCAM1.

5. Konjugatet ifølge et hvilket som helst av kravene 2 til 4, hvori antistoffet eller antistofffragmentet er et cysteinkonstruert antistoff.

6. Konjugatet ifølge et hvilket som helst av kravene 2 til 5, hvori legemiddelbelastningen (p) til legemidler (D) til antistoff (Ab) er et heltall fra 1 til ca. 8.

7. Konjugatet ifølge krav 6, hvori p er 1, 2, 3 eller 4.

[EP3470086]

5

8. Sammensetning omfattende en blanding av legemiddelkonjugatforbindelser ifølge et hvilket som helst av kravene 2 til 7, hvori den gjennomsnittlige legemiddelbelastningen per antistoff i blandingen av antistofflegemiddelkonjugatforbindelser er ca. 1 til ca. 8.

5

9. Konjugatet ifølge et hvilket som helst av kravene 2 til 7 eller sammensetningen ifølge krav 8, for anvendelse i terapi.

10

10. Konjugatet ifølge et hvilket som helst av kravene 2 til 7 eller sammensetningen ifølge krav 8, for anvendelse i behandling av en proliferativ sykdom hos et individ.

15

11. Konjugatet eller sammensetningen for anvendelse ifølge krav 10, hvori sykdommen er kreft.

20

12. Farmasøytisk sammensetning omfattende konjugatet ifølge et hvilket som helst av kravene 2 til 7 eller sammensetningen ifølge krav 8 og en farmasøytisk akseptabel tynner, bærer eller eksipient.

13. Den farmasøytiske sammensetningen ifølge krav 12, ytterligere omfattende en terapeutisk effektiv mengde av et kjemoterapeutisk middel.

25

14. Fremgangsmåte for å fremstille et konjugat ifølge et hvilket som helst av kravene 2 til 7, der fremgangsmåten omfatter trinnet med å reagere et cellebindende middel med forbindelse A som definert i krav 1.