



(12) Translation of  
European patent specification

(11) NO/EP 3585442 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

**A61K 47/68 (2017.01)**

**A61K 31/4184 (2006.01)**

**A61K 31/137 (2006.01)**

**A61K 31/4535 (2006.01)**

**A61K 31/138 (2006.01)**

**A61K 31/513 (2006.01)**

**A61K 31/198 (2006.01)**

**A61K 31/517 (2006.01)**

**A61K 31/255 (2006.01)**

**A61K 31/555 (2006.01)**

**A61K 31/33 (2006.01)**

**A61K 31/7068 (2006.01)**

**A61K 31/407 (2006.01)**

**C07K 16/30 (2006.01)**

**Norwegian Industrial Property Office**

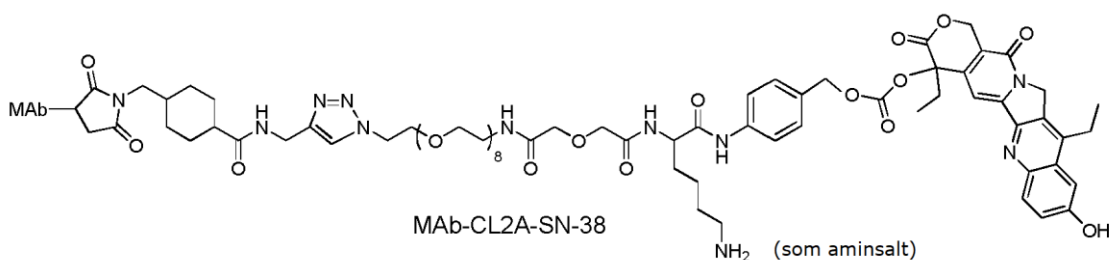
|      |                                                                            |                                                                                                                                                                                                   |
|------|----------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| (45) | Translation Published                                                      | 2024.02.05                                                                                                                                                                                        |
| (80) | Date of The European<br>Patent Office Publication of<br>the Granted Patent | 2023.10.11                                                                                                                                                                                        |
| (86) | European Application Nr.                                                   | 18758120.2                                                                                                                                                                                        |
| (86) | European Filing Date                                                       | 2018.02.21                                                                                                                                                                                        |
| (87) | The European Application's<br>Publication Date                             | 2020.01.01                                                                                                                                                                                        |
| (30) | Priority                                                                   | 2017.02.24, US, 201762463316 P<br>2017.11.22, US, 201715820708                                                                                                                                    |
| (84) | Designated Contracting<br>States:                                          | AL ; AT ; BE ; BG ; CH ; CY ; CZ ; DE ; DK ; EE ; ES ; FI ; FR ; GB ; GR ; HR ; HU ;<br>IE ; IS ; IT ; LI ; LT ; LU ; LV ; MC ; MK ; MT ; NL ; NO ; PL ; PT ; RO ; RS ; SE ; SI ;<br>SK ; SM ; TR |
| (73) | Proprietor                                                                 | Immunomedics, Inc., 300 American Road, Morris Plains, NJ 07950, USA                                                                                                                               |
| (72) | Inventor                                                                   | GOLDENBERG, David M., 300 American Road, Morris Plains, New Jersey 07950,<br>USA<br>GOVINDAN, Serengulam V., 300 American Road, Morris Plains, New Jersey 07950,<br>USA                           |
| (74) | Agent or Attorney                                                          | AWA NORWAY AS, Postboks 1052 Hoff, 0218 OSLO, Norge                                                                                                                                               |

|      |                      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |
|------|----------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| (54) | Title                | <b>THERAPY OF SMALL-CELL LUNG CANCER (SCLC) WITH A TOPOISOMERASE-I<br/>INHIBITING ANTIBODY-DRUG CONJUGATE (ADC) TARGETING TROP-2</b>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
| (56) | References<br>Cited: | WO-A1-2016/172427<br>US-A1- 2016 166 567<br>US-A1- 2016 193 357<br>US-A1- 2017 014 527<br>ALEXANDER STARODUB ET AL: "Trop-2 as a therapeutic target for the antibody-drug<br>conjugate (ADC), sacituzumab govitecan (IMMU-132), in patients (pts) with previously treated<br>metastatic small-cell lung cancer (mSCLC).", JOURNAL OF CLINICAL ONCOLOGY, vol. 34, no.<br>15_suppl, 20 May 2016 (2016-05-20), pages 8559-8559, XP55719443, US ISSN: 0732-183X,<br>DOI: 10.1200/JCO.2016.34.15_suppl.8559 |

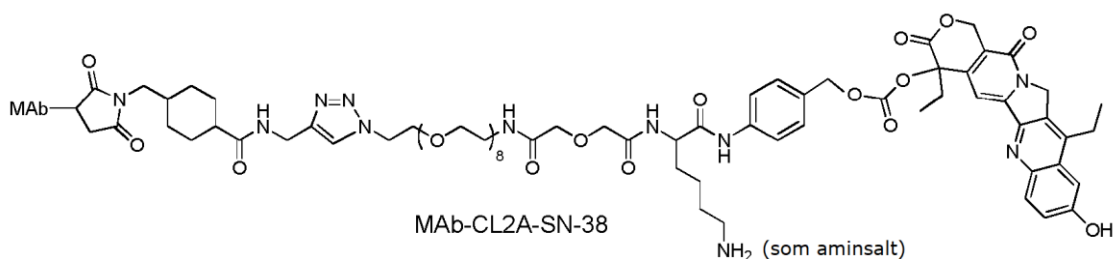
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters 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. Anti-Trop-2-antistoff/legemiddel-konjugat (ADC) omfattende SN-38 konjugert med et anti-Trop-2-antistoff, for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av småcellet lungekreft (SCLC), hvor fremgangsmåten omfatter å administrere (i) anti-Trop-2-antistoff/legemiddel-konjugatet (ADC) og (ii) cisplatin eller karboplatin en human pasient med SCLC, hvor ADC'et administreres som en annenlinje eller senere terapi til pasienter som har mottatt tidligere kreftbehandling mot SCLC, hvor anti-Trop-2-antistoffet er et humanisert RS7-antistoff omfattende de lettkjedede CDR-sekvenser CDR1 (KASQDVSIAVA, SEQ ID NO:1); CDR2 (SASYRYT, SEQ ID NO:2); og CDR3 (QQHYITPLT, SEQ ID NO:3) og de tungkjedede CDR-sekvenser CDR1 (NYGMN, SEQ ID NO:4); CDR2 (WINTYTGEPTYTDDFKG, SEQ ID NO:5) og CDR3 (GGFGSSYWYFDV, SEQ ID NO:6), og hvor det finnes et CL2A-bindeledd mellom SN-38 og antistoffet, og strukturen av ADC'et er MAb-CL2A-SN-38



2. Cisplatin eller karboplatin for anvendelse i en fremgangsmåte for behandling av småcellet lungekreft (SCLC), hvor fremgangsmåten omfatter å administrere (i) et anti-Trop-2-antistoff/legemiddel-konjugat (ADC) omfattende SN-38 konjugert med et anti-Trop-2-antistoff og (ii) cisplatin eller karboplatin til en human pasient med SCLC, hvor ADC'et administreres som en annenlinje eller senere terapi til pasienter som har mottatt tidligere kreftbehandling mot SCLC, hvor anti-Trop-2-antistoffet er et humanisert RS7-antistoff omfattende de lettkjedede CDR-sekvenser CDR1 (KASQDVSIAVA, SEQ ID NO:1); CDR2 (SASYRYT, SEQ ID NO:2); og CDR3 (QQHYITPLT, SEQ ID NO:3) og de tungkjedede CDR-sekvenser CDR1 (NYGMN, SEQ ID NO:4); CDR2 (WINTYTGEPTYTDDFKG, SEQ ID NO: 5) og CDR3 (GGFGSSYWYFDV, SEQ ID NO:6), og hvor det finnes et CL2A-bindeledd mellom SN-38 og antistoffet, og strukturen av ADC'et er MAb-CL2A-SN-38



3. Anti-Trop-2-antistoff/legemiddel-konjugat (ADC) for anvendelse ifølge krav 1, eller cisplatin eller karboplatin for anvendelse ifølge krav 2, hvor kreftsykdommen er metastatisk (mSCLC).
- 5 4. Anti-Trop-2-antistoff/legemiddel-konjugat (ADC) for anvendelse ifølge krav 1, eller cisplatin eller karboplatin for anvendelse ifølge krav 2, hvor ADC'et administreres som en annenlinje eller senere terapi til pasienter som tidligere har fått tilbakefall eller vært resistente mot behandling med et standard anti-kreftmiddel.
- 10 5. Anti-Trop-2-antistoff/legemiddel-konjugat (ADC) for anvendelse ifølge krav 1, eller cisplatin eller karboplatin for anvendelse ifølge krav 2, hvor pasienten tidligere har fått tilbakefall eller vært resistente mot behandling med topotekan eller irinotekan.
- 15 6. Anti-Trop-2-antistoff/legemiddel-konjugat (ADC) for anvendelse ifølge krav 5, eller cisplatin eller karboplatin for anvendelse ifølge krav 5, hvor SCLC'et er resistent mot kjemoterapi med platinholdige midler.
7. Anti-Trop-2-antistoff/legemiddel-konjugat (ADC) for anvendelse ifølge krav 5, eller cisplatin eller karboplatin for anvendelse ifølge krav 5, hvor SCLC'et er følsomt for kjemoterapi med platinholdige midler.
- 20 8. Anti-Trop-2-antistoff/legemiddel-konjugat (ADC) for anvendelse ifølge krav 1, eller cisplatin eller karboplatin for anvendelse ifølge krav 2, hvor ADC'et administreres i en dosering mellom 6 mg/kg og 12 mg/kg.
9. Anti-Trop-2-antistoff/legemiddel-konjugat (ADC) for anvendelse ifølge krav 8, eller cisplatin eller karboplatin for anvendelse ifølge krav 8, hvor doseringen er  
25 mellom 8 mg/kg og 10 mg/kg.

10. Anti-Trop-2-antistoff/legemiddel-konjugat (ADC) for anvendelse ifølge krav 1, eller cisplatin eller karboplatin for anvendelse ifølge krav 2, hvor behandlingen fører til en reduksjon av svulststørrelsen på minst 15%, minst 20%, minst 30% eller minst 40%.
- 5 11. Anti-Trop-2-antistoff/legemiddel-konjugat (ADC) for anvendelse ifølge krav 3, eller cisplatin eller karboplatin for anvendelse ifølge krav 3, hvor fremgangsmåten ytterligere omfatter å redusere størrelsen av eller eliminere metastasene.
- 10 12. Anti-Trop-2-antistoff/legemiddel-konjugat (ADC) for anvendelse ifølge krav 1, eller cisplatin eller karboplatin for anvendelse ifølge krav 2, hvor det er 7-8 SN-38-molekyler festet på hvert antistoffmolekyl.
- 15 13. Anti-Trop-2-antistoff/legemiddel-konjugat (ADC) for anvendelse ifølge krav 1, eller cisplatin eller karboplatin for anvendelse ifølge krav 2, hvor ADC-doseringen administreres til det menneskelige individ én eller to ganger i uken i et skjema med en syklus valgt fra gruppen bestående av: (i) ukentlig; (ii) annenhver uke; (iii) én uke med terapi fulgt av to, tre eller fire uker uten; (iv) to uker med terapi fulgt av én, to, tre eller fire uker uten; (v) tre uker med terapi fulgt av én, to, tre, fire eller fem uker uten; (vi) fire uker med terapi fulgt av én, to, tre, fire eller fem uker uten; (vii) fem uker med terapi fulgt av én, to, tre, fire eller fem uker uten; og (viii) månedlig; fortrinnsvis gjentas syklusen 4, 6, 8, 10, 12, 16 eller 20 ganger.
- 20 14. Anti-Trop-2-antistoff/legemiddel-konjugat (ADC) for anvendelse ifølge krav 1, eller cisplatin eller karboplatin for anvendelse ifølge krav 2, hvor ADC'et administreres i kombinasjon med én eller flere terapeutiske modaliteter valgt fra gruppen bestående av et ukonjugert antistoff, et immunkonjugat, genterapi, kjemoterapi, et terapeutisk peptid, cytokinterapi, lokal strålingsterapi, interferens RNA-terapi, et legemiddel, et toksin og et cytokin, hvor legemidlet, toksinet eller det kjemoterapeutiske middel fortrinnsvis er valgt fra gruppen bestående av 5-fluorouracil, afatinib, aplidin, azaribin, anastrozol, antracykliner, axitinib, AVL-101, AVL-291, bendamustin, bleomycin, bortezomib, bosutinib, bryostatin-1, busulfan, calicheamycin, camptothecin, 10-hydroksycamptothecin, karmustin, celebrex, 30 klorambucil, Coks-2-hemmere, irinotekan (CPT-11), SN-38, cladribin, camptothekaner, cyklofosamid, crizotinib, cytarabin, dakarbazin, dasatinib, dinaciclib, docetaxel, dactinomycin, daunorubicin, doksorubicin, 2-pyrrolinodoksorubicin (2P-DOKS), cyano-morfolinodoksorubicin, doksorubicin-

- glukuronid, epirubicinglukuronid, erlotinib, estramustin, epidofyllotoksin, erlotinib, entinostat, østrogenreceptorbindende midler, etoposid (VP16), etoposidglukuronid, etoposidfosfat, exemestan, fingolimod, flavopiridol, floksuridin (FUdR), 3',5'-O-dioleoyl-FudR (FUdR-dO), fludarabin, flutamid, farnesylproteintransferase-
- 5 hemmere, fostamatinib, ganetespib, GDC-0834, GS-1101, gefitinib, gemcitabin, hydroksyurea, ibrutinib, idarubicin, idelalisib, ifosfamid, imatinib, L-asparaginase, lapatinib, lenolidamid, leucovorin, LFM-A13, lomustin, mekloretamin, melfalan, merkaptopurin, 6-merkaptopurin, metotreksat, mitoksantron, mitramycin, mitomycin, mitotan, navelbin, neratinib, nilotinib, nitrosurea, olaparib, plicomycin,
- 10 prokarbazin, paklitaksel, PCI-32765, pentostatin, PSI-341, raloksifen, semustin, sorafenib, streptozocin, SU11248, sunitinib, tamoksifen, temazolomid (en vandig form for DTIC), transplatinum, talidomid, tioguanin, tiotepa, teniposid, topotekan, uracilsennep, vatalanib, vinorelbin, vinblastin, vinkristin, vinkaalkaloider og ZD1839.
- 15 15. Anti-Trop-2-antistoff/legemiddel-konjugat (ADC) for anvendelse ifølge krav 1, eller cisplatin eller karboplatin for anvendelse ifølge krav 2, hvor ADC'et administreres til den menneskelige pasient som har gjennomgått kirurgi eller som er planlagt for kirurgi.