



(12) Translation of
European patent specification

(11) NO/EP 4241767 B1

NORWAY

(19) NO

(51) Int Cl.

<i>A61K 47/00 (2006.01)</i>	<i>C07D 317/28 (2006.01)</i>
<i>A61K 9/127 (2006.01)</i>	<i>C07D 317/44 (2006.01)</i>
<i>A61K 31/01 (2006.01)</i>	<i>C07D 317/46 (2006.01)</i>
<i>A61K 31/7088 (2006.01)</i>	<i>C07D 317/72 (2006.01)</i>
<i>A61K 31/713 (2006.01)</i>	<i>C07D 319/06 (2006.01)</i>
<i>A61K 39/00 (2006.01)</i>	<i>C07D 405/12 (2006.01)</i>
<i>A61P 33/00 (2006.01)</i>	<i>C07D 491/056 (2006.01)</i>
<i>A61P 35/00 (2006.01)</i>	<i>C07D 491/113 (2006.01)</i>
<i>A61P 37/04 (2006.01)</i>	<i>C12N 15/11 (2006.01)</i>
<i>C07D 203/10 (2006.01)</i>	

Norwegian Industrial Property Office

(45)	Translation Published	2025.01.13
(80)	Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent	2024.10.23
(86)	European Application Nr.	23175192.6
(86)	European Filing Date	2009.11.10
(87)	The European Application's Publication Date	2023.09.13
(30)	Priority	2008.11.10, US, 113179 P, 2009.02.20, US, 154350 P, 2009.04.21, US, 171439 P 2009.06.09, US, 185438 P, 2009.07.15, US, 225898 P, 2009.08.14, US, 234098 P
(84)	Designated Contracting States:	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 ; SE ; SI ; SK ; SM ; TR
(73)	Proprietor	Arbutus Biopharma Corporation, 25th Floor, 700 West Georgia Street, Vancouver, BC V7Y 1B3, Canada
(72)	Inventor	MANOHARAN, Muthiah, Cambridge, 02142, USA JAYARAMAN, Muthusamy, Cambridge, 02142, USA RAJEEV, Kallanthottathil, G., Cambridge, 02142, USA ELTEPU, Laxman, Cambridge, 02142, USA ANSELL, Steven, Cambridge, 02142, USA CHEN, Jianxin, Cambridge, 02142, USA
(74)	Agent or Attorney	ZACCO NORWAY AS, Postboks 488, 0213 OSLO, Norge

(54)	Title	NOVEL LIPIDS AND COMPOSITIONS FOR THE DELIVERY OF THERAPEUTICS
(56)	References Cited:	DE-A1- 3 402 146 US-B1- 6 320 017

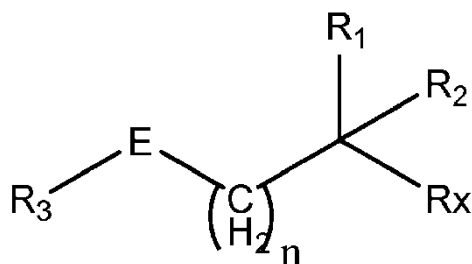
Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters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

4241767

1

PATENTKRAV

1. Lipidpartikkel, som omfatter: (a) et lipid; og (b) et terapeutisk middel; idet lipidet har strukturen



5 eller et salt derav,

hvor

R₃ er valgfritt substituert di(alkyl)aminoalkyl;

E er C(O)O eller OC(O);

10 R₁ og R₂ og R_x er hver uavhengig av hverandre for hver forekomst H, valgfritt substituert C₁-C₁₀-alkyl, valgfritt substituert C₁₀-C₃₀-alkyl, valgfritt substituert C₁₀-C₃₀-alkenyl, valgfritt substituert C₁₀-C₃₀-alkynyl eller valgfritt substituert C₁₀-C₃₀ acyl, forutsatt at i det minste én av R₁, R₂ og R_x ikke er H; og

n er 0, 1, 2 eller 3;

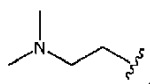
15 hvor uttrykket "substituert" viser til erstatningen av én eller flere hydrogenradikaler i en gitt struktur med radikalen av en spesifisert substituent valgt fra gruppen bestående av halo, alkyl, alkenyl, alkynyl, aryl, heterosyklyl, tiol, alkyltio, okso, tioksy, aryltio, alkyltioalkyl, aryltioalkyl, alkylsulfonyl, alkylsulfonylalkyl, arylsulfonylalkyl, alkoksy, aryloksy, aralkoksy, aminokarbonyl, alkylaminokarbonyl, arylaminokarbonyl, alkoksykarbonyl, aryloksykarbonyl, haloalkyl, amino, 20 trifluormetyl, cyano, nitro, alkylamino, arylamino, alkylaminoalkyl, arylaminoalkyl, aminoalkylamino, hydroksy, alkoksyalkyl, karboksyalkyl, alkoksykarbonylalkyl, aminokarbonylalkyl, acyl, aralkoksykarbonyl, karboksylsyre, sulfosyre, sulfonyl, fosfonsyre, aryl, heteroaryl, heterosyklisk og alifatisk,

4241767

2

og hvor den spesifiserte substituent videre kan substitueres ved erstatning av én eller flere hydrogenradikaler i en gitt struktur med radikalen av en ytterligere substituent valgt fra gruppen bestående av halo, alkyl, alkenyl, alkynyl, aryl, heterosyklisk, tiol, alkyltio, okso, tioksy, aryltio, alkyltioalkyl, aryltioalkyl, alkylsulfonyl, alkylsulfonylalkyl, arylsulfonylalkyl, alkoksy, aryloksy, aralkoksy, aminokarbonyl, alkylaminokarbonyl, arylaminokarbonyl, alkoksykarbonyl, aryloksykarbonyl, haloalkyl, amino, trifluormetyl, cyano, nitro, alkylamino, arylamino, alkylaminoalkyl, arylaminoalkyl, aminoalkylamino, hydroksy, alkoksyalkyl, karboksyalkyl, alkoksykarbonylalkyl, aminokarbonylalkyl, acyl, aralkoksykarbonyl, karboksylsyre, sulfosyre, sulfonyl, fosfonsyre, aryl, heteroaryl, heterosyklisk og alifatisk;

og forutsatt at når E er C(O)O, er R³



og én av R₁, R₂ eller R_x er H, da er de resterende av R₁, R₂ eller R_x ikke begge linoleyl.

15

2. Lipidpartikkel ifølge krav 1, hvor partikkelen videre omfatter et nøytralt lipid og et lipid som er i stand til å redusere aggregasjon.

3. Lipidpartikkel ifølge krav 1, hvor det terapeutiske middel er en nukleinsyre.

20

4. Lipidpartikkel ifølge krav 3, hvor nukleinsyren er en mRNA-sekvens som koder for et terapeutisk nyttig polypeptid.

5. Lipidpartikkel ifølge krav 3, hvor nukleinsyren er et immunstimulatorisk oligonukleotid.

25

4241767

3

6. Lipidpartikkel ifølge krav 3, hvor nukleinsyren velges fra gruppen bestående av et siRNA, et antisense-oligonukleotid, et mikro-RNA, en antagomir, en aptamer og et ribozym.

5 7. Lipidpartikkel ifølge krav 6, hvor nukleinsyren er et siRNA.

8. Lipidpartikkel ifølge et hvilket som helst av kravene 1 til 7, hvor R_1 og R_2 og R_x er hver uavhengig av hverandre for hver forekomst H, C_1 - C_{10} -alkyl, C_{10} - C_{30} -alkyl, C_{10} - C_{30} -alkenyl, C_{10} - C_{30} -alkynyl eller C_{10} - C_{30} acyl, forutsatt at i det minste én av R_1 ,
10 R_2 og R_x ikke er H.

9. Farmasøytisk sammensetning som omfatter en lipidpartikkel ifølge krav 3 og en farmasøytisk akseptierbar eksipiens, bærer eller et farmasøytisk aksepterbart fortynningsmiddel.