

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

PATENTTI- JA REKISTERIHALLITUS
PATENT- OCH REGISTERSTYRELSEN
FINNISH PATENT AND REGISTRATION OFFICE

- (10) **FI/EP3930847 T3**
- (12) **EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION**
- (45) Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning - **23.04.2024**
Translation available to the public
- (97) Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för **14.02.2024**
det europeiska patentet - Date of grant of European patent
- (51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -
International patent classification
A61P 35/00 (2006 . 01)
C07K 14/705 (2006 . 01)
C07K 16/28 (2006 . 01)
- (96) Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan - **EP20714383.5**
European patent application
- (22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date **25.02.2020**
- (97) Patenttihakemuksen julkiseksitulospäivä - Patentansökans **05.01.2022**
publiceringsdag - Patent application available to the public
- (86) Kansainvälinen hakemus - Internationell **25.02.2020 PCT/US2020019690**
ansökan - International application
- (30) Etuoikeus - Prioritet - Priority
26.02.2019 US US201962810841 P

(73) Haltija - Innehavare - Holder
1• Inspirna, Inc. , 30-02 48th Ave 350 , Long Island City, New York 11101 , (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor
1• TAVAZOIE, Masoud , 310 East 67th Street, Suite 1-11 , New York, NY 10065 , (US)
2• KURTH, Isabel , 310 East 67th Street, Suite 1-11 , New York, NY 10065 , (US)
3• TAKEDA, Shugaku , 310 East 67th Street, Suite 1-11 , New York, NY 10065 , (US)
4• ANDREU-AGULLO, Celia , 310 East 67th Street, Suite 1-11 , New York, NY 10065 , (US)
5• LORENZ, Ivo , 413 East 69th Street, Box 300 , New York, NY 10021 , (US)

(74) Asiamies - Ombud - Agent
Kolster Oy Ab , Salmisaarenaukio 1 , 00180 Helsinki , (FI)

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention
Korkea-affinisia anti-MERTK-vasta-aineita ja niiden käyttäjä
HIGH-AFFINITY ANTI-MERTK ANTIBODIES AND USES THEREOF

Patenttivaatimukset

1. Vasta-aine tai sen antigeenia sitova fragmentti, joka spesifisesti sitoutuu ihmisen Mer-tyrosiinikinaasiin (MERTK), jossa vasta-aine tai antigeenia sitova fragmentti käsittää raskasketjun variaabelialueen (VH) ja kevytketjun variaabelialueen (VL), jossa VH käsittää sekvenssin SEQ ID nro 105 aminohapposekvenssin ja VL käsittää sekvenssin SEQ ID nro 106 aminohapposekvenssin.
2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen vasta-aine tai sen antigeenia sitova fragmentti, jossa mainittu vasta-aine on monoklonaalinen vasta-aine.
3. Patenttivaatimuksen 1 tai 2 mukainen vasta-aine tai sen antigeenia sitova fragmentti, jossa vasta-aine on immunoglobuliini, joka käsittää kaksi identtistä raskasketjua ja kaksi identtistä kevytketjua.
4. Minkä tahansa patenttivaatimuksen 1–3 mukainen vasta-aine tai sen antigeenia sitova fragmentti, jossa vasta-aine käsittää ihmisperäiset raskas- ja kevytketjun vakioalueet; tai jossa vasta-aine käsittää osan ihmisperäisistä raskas- ja kevytketjun vakioalueista.
5. Minkä tahansa patenttivaatimuksen 1–4 mukainen vasta-aine tai sen antigeenia sitova fragmentti, jossa vasta-aine on IgG:tä.
6. Bispesifinen vasta-aine, joka käsittää kaksi erilaista antigeenia sitovaa aluetta, jossa yksi antigeenia sitova alue käsittää patenttivaatimuksen 1 mukaisen vasta-aineen tai antigeenia sitovan fragmentin, ja jossa toinen antigeenia sitova alue sitoutuu kohteena olevaan antigeeniin; valinnaisesti jossa kohteena oleva antigeeni on immuunisolureseptori tai kasvaimen liittyvä antigeeni.
7. Vasta-aine-lääkekonjugaatti, joka käsittää: (a) vasta-aineosan, joka on minkä tahansa patenttivaatimuksen 1–6 mukainen vasta-aine tai sen antigeenia sitova fragmentti; (b) yhden tai useamman lääkeosan, kunkin lääkeosan ollessa sytotoksista ainetta; ja (c) valinnaisesti linkkerin, jossa sytotoksinen aine on konjugoitu suoraan vasta-aineosaan tai on konjugoitu vasta-aineosaan linkkerin välityksellä.
8. Patenttivaatimuksen 7 mukainen vasta-aine-lääkekonjugaatti, jossa sytotoksinen aine on valittu ryhmästä, joka koostuu auristatiinista, maytansinoidista, pyrrolobentsodiatsepiinista, indolinobentsodiatsepiinista, kalikeamisiinista, kamptotekiinianalogista, duokarmysiinistä, tubuliini-inhibiittorista, tubulysiinistä tai tubulysiinianalogista, amberstatiini269:stä, doksorubisiinista, SN-38:sta, antibiootista, antrasykliinistä, mikrotubulusinhibiittorista, spliseostatiinista, thailansitatiinista, monometyyliauristatiini E:stä (MMAE), monometyyliauristatiini F:stä (MMAF), DM1:stä, DM4:stä ja monometyyliauristatiini E:stä.

9. Patenttivaatimuksen 7 tai 8 mukainen vasta-aine-lääkekonjugaatti, jossa vasta-aine-lääkekonjugaatti käsittää linkkerin, ja linkkeri on katkeava linkkeri tai katkeamaton linkkeri; valinnaisesti jossa linkkeri on maleimidokaproyyli-valiinisitrulliini-p-aminobentsyylioksikarbonyyli, CL2 tai CL2A.

5 10. Patenttivaatimuksen 8 mukainen vasta-aine-lääkekonjugaatti, jossa vasta-aineosa on konjugoitu MMAE:hen mc-vc-PABC-linkkerin välityksellä.

11. Patenttivaatimuksen 8 mukainen vasta-aine-lääkekonjugaatti, jossa vasta-aineosa on konjugoitu SN-38:aan CL2A-linkkerin välityksellä.

10 12. Yksi tai useampi polynukleotidi, joka koodittaa (jotka koodittavat) minkä tahansa patenttivaatimuksen 1–5 mukaista vasta-ainetta tai sen antigeenia sitovaa fragmenttia.

13. *Ex vivo* -solu, joka sisältää yhden tai useamman polynukleotidin, joka koodittaa (jotka koodittavat) minkä tahansa patenttivaatimuksen 1–5 mukaista vasta-ainetta tai antigeenia sitovaa fragmenttia.

15 14. Menetelmä vasta-aineen tai antigeenia sitovan fragmentin tuottamiseksi, menetelmän käsittäessä patenttivaatimuksen 13 mukaisen solun viljelemisen sellaisissa olosuhteissa, että mainittu yksi tai useampi polynukleotidi ekspressoituu solussa polynukleotidien koodittaman vasta-aineen tai antigeenia sitovan fragmentin tuottamiseksi.

20 15. Farmaseuttinen koostumus, joka käsittää terapeuttisesti tehokkaan määrän minkä tahansa patenttivaatimuksen 1–5 mukaista vasta-ainetta tai antigeenia sitovaa fragmenttia, patenttivaatimuksen 6 mukaista bispesifistä vasta-ainetta tai minkä tahansa patenttivaatimuksen 7–11 mukaista vasta-aine-lääkekonjugaattia ja farmaseuttisesti hyväksyttävää kantajaa.

25 16. Patenttivaatimuksessa 15 määritelty farmaseuttinen koostumus käytettäväksi menetelmässä, jolla hoidetaan syöpää sen tarpeessa olevassa kohdessa, valinnaisesti jossa kohde on ihminen.

30 17. Farmaseuttinen koostumus käytettäväksi patenttivaatimuksen 16 mukaisesti, jossa mainittu syöpä on pään ja kaulan alueen syöpä, keuhkosyöpä, rintasyöpä, luusyöpä, munasarjasyöpä, mahasyöpä, haimasyöpä, kurkunpääsyöpä, ruokatorvisyöpä, kivessyöpä, maksasyöpä, korvasylkirauhassyöpä, sappitiesyöpä, paksusuolisyöpä, peräsuolisyöpä, kohdunkaulasyöpä, kohtusyöpä, kohdunrunkosyöpä, munuaissyöpä, virtsarakkosyöpä, eturauhassyöpä tai kilpirauhassyöpä; tai
35 jossa syöpä on melanooma, sarkooma, leukemia, levyepiteelikarsinooma, melanooma, gliooma, glioblastooma, neuroblastooma, Kaposin sarkooma, vatsasyöpä, kolorektaalisyöpä, ei-pienisolainen keuhkokarsinooma, pään ja kaulan alueen

syöpä, multippeli myelooma tai lymfooma, tai on akuutti myeloinen leukemia tai akuutti lymfaattinen leukemia.

5 18. Farmaseuttinen koostumus käytettäväksi patenttivaatimuksen 17 mukaisesti, jossa mainittu syöpä on rintasyöpä, valinnaisesti kolmoisnegatiivinen rintasyöpä.

19. Farmaseuttinen koostumus käytettäväksi minkä tahansa patenttivaatimuksen 16–18 mukaisesti, jossa mainitun syövän syöpäiset solut yliekspressoivat MERTK:ta, valinnaisesti yliekspressoivat fosforyloitua MERTK:ta; tai

10 jossa MERTK on konstitutiivisesti aktiivinen mainitun syövän syöpäisissä soluissa; tai

jossa mainittuun syöpään liittyy MERTK:n yliekspressio; tai mainittuun syöpään liittyy konstitutiivisesti aktiivinen MERTK.