

(12)

PREVOD ZAHTEVKOV EVROPSKEGA PATENTA

(21) Številka predmeta: **201131368**

(51) Int. Cl. (2018.01)

(22) Datum prijave: **03.06.2011**

C07H 13/00

A61K 39/00

(46) Datum objave prevoda zahtevkov:

30.04.2018

(96) Evropska patentna prijava:

03.06.2011 EP 11725217.1

(30) Prednostna pravica:

11.06.2010 EP 10165707

(87) Objava mednarodne patentne prijave:

WO 2011/155822, 15.12.2011

(86) Mednarodna patentna prijava:

03.06.2011 WO PCT/NL2011/050393

(97) Objava evropskega patenta:

EP 2580226 B1, 29.11.2017

(72) Izumitelji: **VAN BREE Johannes Gernardus Mathias Marie, NL-5223 DE 's-Hertogenbosch, NL;
SCHENKELAARS Everardus Joannes Peter Maria, NL-5223 DE 's-Hertogenbosch, NL;
TURKSTRA Jouwert Anne, NL-8252 HA Dronten, NL;
KRIEK Maria Aldegonda Jacoba, NL-8245 CV Leylstad, NL;
HOF Robert Patrick, NL-9745 DA Groningen, NL;
SCHAAPER Wilhelmus Martinus Maria, NL-1313 Almere, NL**

(73) Imetnik: **Immunovo B.V.,**

Onderwijsboulevard 225, 5223 DE's-Hertogenbosch, NL

(74) Zastopnik: **ZIVKO MIJATOVIC & PARTNERS, d.o.o., Ulica stare pravde 10, 1000 Ljubljana, SI**

(54) **DERIVATI TRISAHARIDA IN NJIHOVA UPORABA ZA ADJUVANSE**

DERIVATI TRISAHARIDA IN NJIHOVA UPORABA ZA ADJUVANSE

PATENTNI ZAHTEVKI

- 5 1. Uporaba derivata trisaharida, ki vsebuje substituirano trisaharidno jedro, to trisaharidno jedro je povsem substituirano s skupinami estrov maščobne kisline, in po možnosti z eno ali več anionskimi skupinami, kot adjuvans.
- 10 2. Uporaba po zahtevku 1, pri čemer se substituirano trisaharidno jedro pridobi iz rafinoze, melezitoze, maltotrioze, nigerotrioze, maltotriuloze ali kestoze, po možnosti iz rafinoze, melezitoze ali maltotrioze, najraje iz rafinoze ali maltotrioze.
- 15 3. Uporaba po zahtevku 1 ali 2, pri čemer substituirano trisaharidno jedro vsebuje eno ali dve skupini sulfatnih estrov ali fosfatnih estrov kot anionski skupini.
- 20 4. Uporaba po katerem koli od zahtevkov 1–3, pri čemer je anionska skupina sulfatni ester.
5. Uporaba po katerem koli od zahtevkov 1–4, pri čemer je skupina estrov maščobne kisline ester ravne, razvejane, nasičene ali

nenasičene maščobne kisline, z dolžino verige od 4 do 20 ogljikovih atomov, po možnosti od 6 do 8, raje od 8 do 16 ogljikovih atomov, še raje od 10 do 14 ogljikovih atomov, najraje 12 ogljikovih atomov.

- 5 6. Uporaba po katerem koli od zahtevkov 1–5, pri čemer je ester maščobne kisline ester lavrinske kisline, miristinske kisline, palmitinske kisline, stearinske kisline ali arašidne kisline, po možnosti lavrinske kisline.
- 10 7. Uporaba po katerem koli od zahtevkov 1–6, pri čemer so skupine estrov maščobne kisline substituiranega trisaharidnega jedra vse identične.
- 15 8. Uporaba po katerem koli od zahtevkov 1–7, pri čemer substituirano trisaharidno jedro izhaja iz rafinoze, melecitoze ali maltotrioze in pri čemer je trisaharidni derivat povsem substituiran z identičnimi skupinami estrov maščobne kisline na substituirani trisaharid.
- 20 9. Uporaba po katerem koli od zahtevkov 1–7, pri čemer substituirano trisaharidno jedro izhaja iz rafinoze, melecitoze ali maltotrioze in pri čemer trisaharidno jedro vsebuje eno skupino sulfatnih estrov ali fosfatnih estrov in deset identičnih skupin estrov maščobne kisline na substituirani trisaharid ali dve skupini sulfatnih estrov ali fosfatnih

estrov in devet identičnih skupin estrov maščobne kisline na substituirani trisaharid.

5 10. Uporaba po katerem koli od zahtevkov 1–9, pri čemer so skupine estrov maščobne kisline estri lavrinske kisline.

11. Adjuvanski sestavek, ki vsebuje trisaharidni derivat po zahtevkih 1–10 ali mešanico le-tega in farmacevtsko sprejemljivi recipient in/ali razredčilo.

10

12. Adjuvanski sestavek po zahtevku 11, formuliran kot olje v vodni emulziji.

15

13. Adjuvanski sestavek po zahtevku 12, pri čemer oljna faza emulzije vsebuje skvalan in/ali polisorbit.

14. Formulacija cepiva, ki vsebuje adjuvanski sestavek po zahtevkih 11–13.

20

15. Komplet, ki vsebuje antigenski sestavek in adjuvanski sestavek po zahtevkih 11–13.

16. Adjuvanski sestavek po zahtevkih 11–13, formulacija cepiva po zahtevku 14 ali komplet po zahtevku 15 za uporabo kot zdravilo.

17. Derivat trisaharida, ki vsebuje substituirano trisaharidno jedro, to trisaharidno jedro je popolnoma substituirano s skupinami estrov maščobne kisline in eno ali več anionskimi skupinami, pri čemer se substituirano trisaharidno jedro pridobi iz rafinoze, melecitoze ali maltotrioze in pri čemer trisaharidno jedro vsebuje eno skupino sulfatnih estrov ali fosfatnih estrov in deset identičnih skupin estrov maščobne kisline na substituirani trisaharid ali dve skupini sulfatnih estrov ali fosfatnih estrov in devet identičnih skupin estrov maščobne kisline na substituirani trisaharid, pri čemer je skupina estrov maščobne kisline ester ravne, razvejane, nasičene ali nenasičene maščobne kisline, z dolžino verige od 4 do 20 ogljikovih atomov.

18. Derivat trisaharida po zahtevku 17, pri čemer je ester maščobne kisline ester lavrinske kisline, miristinske kisline, palmitinske kisline, stearinske kisline ali arašidne kisline

19. Derivat trisaharida po zahtevku 18, pri čemer so skupine estrov maščobne kisline estri lavrinske kisline.

20. Derivat trisaharida po katerem koli zahtevkov 17–19, za uporabo kot zdravilo.

21. Metoda za pripravo derivata trisaharida po katerem koli zahtevkov 17–19, ki vsebuje sledeče korake:

a) priskrbimo trisaharid in ga raztopimo v topilu, pri čemer je trisaharid rafinoza, melequitoza ali maltotrioza; in

b) estrificiramo vse OH-skupine trisaharida, pri čemer vsaj ena od OH-skupin trisaharida reagira z anionsko snovjo, pri čemer je trisaharid estrificiran z v povprečju eno skupino sulfatnih estrov ali skupino fosfatnih estrov in desetimi identičnimi skupinami estrov maščobne kisline na trisaharid ali z dvema skupinama sulfatnih ali fosfatnih estrov in devetimi identičnimi skupinami estrov maščobne kisline na trisaharid, pri čemer maščobna kislina ravna razvejane, nasičena ali nenasičena maščobna kislina z dolžino verige od 4 do 20 ogljikovih atomov.