

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

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

(10)

EP/EP2451486 T4

(12)

**MUUTETUSSA MUODOSSA HYVÄKSYTYN EUROOPPAPATENTIN
KÄÄNNÖS
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT I ÄNDRAD FORM
TRANSLATION OF AMENDED EUROPEAN PATENT
SPECIFICATION**

(45)

Käännöksen kuulutuspäivä - Kungörelsedag av översättning -
Translation available to the public

25.04.2023

(97)

Muutetussa muodossa hyväksytyn Eurooppapatentin
myöntämispäivä - Meddelandedatum för det europeiska
patentet i ändrad form - Date of grant of amended European
patent

05.02.2021

(51)

Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -
International patent classification
A61K 47/60 (2017 . 01)
C12N 9/82 (2006 . 01)
A61P 35/02 (2006 . 01)

(96)

Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan -
European patent application

EP10730170.7

Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date

(97)

Patenttihakemuksen julkiseksitulosopäivä - Patentansökans
publiceringsdag - Patent application available to the public

16.05.2012

(86)

Kansainvälinen hakemus - Internationell
ansökan - International application

06.07.2010 PCT/EP2010059599

(30)

Etuoikeus - Prioritet - Priority

06.07.2009 US 223320 P

30.03.2010 WO PCT/EP2010/054156

(73)

Haltija - Innehavare - Holder

1 • Jazz Pharmaceuticals II SAS, 84 Quai Charles de Gaulle Cité Internationale, 69006 Lyon, (FR)

(72)

Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1 • ABRIBAT, Thierry, 124 Chemin de Montray, F-69110 Sainte Foy Les Lyon, (FR)

(74)

Asiamies - Ombud - Agent

LEITZINGER OY, c/o Spaces Mannerheiminaukio 1A, 00100 Helsinki, (FI)

(54)

Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

Pegyloitu L-asparaginaasi

Pegylerad L-asparaginas

PEGYLATED L-ASPARAGINASE

(56)

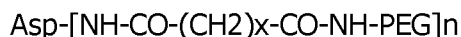
Viitejulkaisut - Anförda publikationer - References cited
WO-A2-03/018742; US-A- 5 672 662;

Patenttivaatimukset

1. Konjugaatti käytettäväksi terapiassa, konjugaatin sisältäessä L-asparaginaasia *Erwinia chrysanthemista*, jolla on vähintään 90 %:n identtisyys SEQ ID NO:1:n aminohapposekvenssin kanssa, ja polyetyleeniglykolia (PEG), jossa PEG:n molekyylipaino on vähemmän tai yhtä paljon kuin noin 5000 Da.
5
2. Konjugaatti käytettäväksi patenttivaatimuksen 1 mukaisesti, jossa mainitulla L-asparaginaasilla on vähintään 95 %:n identtisyys SEQ ID NO:1:n aminohapposekvenssin kanssa, tai vähintään 99 %:n identtisyys SEQ ID NO:1:n aminohapposekvenssin kanssa.
10
3. Konjugaatti käytettäväksi patenttivaatimuksen 1 mukaisesti, jossa mainittu L-asparaginaasi on identtinen SEQ ID NO:1:n kanssa.
15
4. Konjugaatti käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksen 1–3 mukaisesti, jossa mainitun PEG:n molekyylipaino on alueessa vähintään 500 Da.
5. Konjugaatti käytettäväksi patenttivaatimuksen 3 mukaisesti, jossa mainitun PEG:n molekyylipaino on noin 5000 Da, vähemmän kuin noin 5000 Da, vähemmän kuin noin 4000 Da, vähemmän kuin noin 3000 Da tai vähemmän kuin noin 2500 Da.
20
6. Konjugaatti käytettäväksi patenttivaatimuksen 1 mukaisesti, jossa mainittu L-asparaginaasi on identtinen SEQ ID NO:1:n kanssa ja mainitun PEG:n molekyylipaino on noin 5000 Da.
25
7. Konjugaatti käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksen 1–6 mukaisesti, jossa PEG on kovalenttisesti liitetty yhteen tai useampaan mainitun L-asparaginaasin aminoryhmään.
30
8. Konjugaatti käytettäväksi patenttivaatimuksen 7 mukaisesti, jossa PEG on kovalenttisesti liitetty mainittuun yhteen tai useampaan aminoryhmään amidisidoksella.

9. Konjugaatti käytettäväksi patenttivaatimuksen 7 tai 8 mukaisesti, jossa PEG on kovalenttisesti liitetty 40 %:sta 100 %:iin saatavilla olevista aminoryhmistä, kuten 40 %:sta noin 90 %:iin kaikista aminoryhmistä.

- 5 **10.** Konjugaatti käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksen 1–9 mukaisesti, jolla konjugaatilla on kaava:



- 10 jossa Asp on L-asparaginaasi, NH on yksi tai useampi lysiinitähteiden ja/tai N-terminaalin NH-ryhmä Asp:ssa, PEG on polyetyleeniglykoliosa, n on luku, joka esittää ainakin 40 %:sta noin 100 %:iin saatavilla olevista aminoryhmistä (esim. lysiinitähteet ja/tai N-terminaali) Asp:ssä, ja x on kokonaisluku vaihdellen 1:stä 8:aan, kuten jossa x on kokonaisluku vaihdellen 2:sta 5:een.

15

11. Konjugaatti käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksen 1–10 mukaisesti, jossa mainittu PEG on monometoksipolyetyleeniglykoli.

- 20 **12.** Konjugaatti käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksen 1–10 mukaisesti, hoitamalla potilasta sellaisen sairauden osalta, joka on hoidettavissa L-asparagiinin vähenemisellä, valinnaisesti jossa mainittu sairaus on hematologinen pahanlaatuisuus ja potilaalle annetaan annos 10 000 kansainvälisestä yksiköstä per potilaan kehon pinta-alan neliömetri (IU/m^2) 15 000 IU:hun/ m^2 .

- 25 **13.** Konjugaatti käytettäväksi jonkin patenttivaatimuksen 1–10 mukaisesti, hoitamalla potilasta sellaisen sairauden osalta, joka on hoidettavissa L-asparagiinin vähenemisellä, valinnaisesti jossa mainittu L-asparagiinin vähenemisellä hoidettavissa oleva sairaus on syöpä, valinnaisesti jossa mainittu syöpä on valittuna ryhmästä, jonka muodostavat akuutti lymfoblastinen leukemia (ALL), non-Hodgkinin lymfooma,
30 NK-lymfooma ja haimasyöpä.

14. Konjugaatti käytettäväksi patenttivaatimuksen 13 mukaisesti, jossa mainittu syöpä on NK-lymfooma.

15. Konjugaatti käytettäväksi patenttivaatimuksen 13 mukaisesti, jossa mainitulla potilaalla on ollut sairauden uusiutuminen, valinnaisesti jossa mainittu sairauden uusiutuminen tapahtuu *E. coli*n L-asparaginaasilla tai sen PEGyloidulla muodolla hoidon jälkeen.