

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2011140491/10, 05.03.2010

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
06.03.2009 US 61/158,143

(43) Дата публикации заявки: 20.04.2013 Бюл. № 11

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 06.10.2011(86) Заявка РСТ:
US 2010/026429 (05.03.2010)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2010/111018 (30.09.2010)

Адрес для переписки:

109012, Москва, ул. Ильинка, 5/2, ООО
"Союзпатент"

(71) Заявитель(и):

ЭДЖЕНСИС, ИНК. (US),
СИЭТЛ ДЖИНЕТИКС, ИНК. (US)

(72) Автор(ы):

ГУДАС Джин (US),
ДЖЕЙКОВОВИТЦ Ая (US),
ЭН Зили (US),
МОРРИСОН Роберт Кендол (US),
МОРРИСОН Карен Джин Мейрик (US),
ДЗИА Ксяо-Чи (US),
БЕНДЖАМИН Деннис (US),
МОУЗЕР Рут (US),
СЕНТЕР Питер (US)(54) **КОНЬЮГАТЫ АНТИТЕЛО-ЛЕКАРСТВЕННОЕ СРЕДСТВО, КОТОРЫЕ СВЯЗЫВАЮТ БЕЛКИ 24P4C12**

(57) Формула изобретения

1. Конъюгат антитело-лекарственное средство, содержащий антитело или антигенсвязывающий фрагмент конъюгированный с монометилауростатином E (ММАЕ), где антитело или фрагмент содержат переменную область тяжелой цепи, состоящую из аминокислотной последовательности, начиная с 20 Q по 143 S последовательности SEQ ID NO:20 и переменную область легкой цепи, состоящую из аминокислотной последовательности, начиная с 23 D по 130 R последовательности SEQ ID NO:22.

2. Конъюгат антитело-лекарственное средство, содержащий антитело или фрагмент, которое содержит переменные области тяжелой и легкой цепей антитела, продуцируемого гибридомой, помещенной на хранение в Американскую коллекцию типовых культур (American Type Culture Collection, ATCC) с учетным номером РТА-8602, конъюгированное с монометилауростатином E (ММАЕ).

3. Конъюгат антитело-лекарственное средство по п.2, в котором антитело содержит тяжелую и легкую цепи антитела, продуцируемого гибридомой, помещенной на хранение в ATCC с учетным номером РТА-8602.

4. Конъюгат антитело-лекарственное средство по п.1, в котором антитело содержит тяжелую цепь, состоящую из аминокислотной последовательности, начиная с 20 Q по 469 K последовательности SEQ ID NO: 20, и легкую цепь, состоящую из аминокислотной последовательности, начиная с 23 D по 236 C последовательности SEQ ID NO:22.

5. Конъюгат антитело-лекарственное средство по п.1, в котором фрагмент является фрагментом Fab, F(ab')₂, Fv или sFv.

6. Конъюгат антитело-лекарственное средство по п.1, в котором антитело является полностью человеческим антителом.

7. Конъюгат антитело-лекарственное средство по п.1, в котором антитело получают рекомбинантно.

8. Фармацевтическая композиция, которая содержит конъюгат антитело-лекарственное средство по п.1 в единичной лекарственной форме для человека.

9. Фармацевтическая композиция по п.8, в которой композиция предназначена для лечения злокачественных новообразований.

10. Фармацевтическая композиция по п.9, в которой злокачественное новообразование представляет собой рак толстой кишки, рак поджелудочной железы, рак яичников, рак предстательной железы или рак желудка.

11. Способ ингибирования роста злокачественных опухолевых клеток в объекте, включающий введение указанному объекту конъюгата антитело-лекарственное средство по п.1.

12. Способ лечения опухоли в млекопитающем, включающий обработку млекопитающего эффективным количеством конъюгата антитело-лекарственное средство по п.1.

13. Способ уменьшения роста опухоли в млекопитающем, включающий обработку млекопитающего эффективным количеством комбинации конъюгата антитело-лекарственное средство и ионизирующего излучения.

14. Способ уменьшения роста опухоли в млекопитающем, включающий обработку млекопитающего эффективным количеством комбинации конъюгата антитело-лекарственное средство и химиотерапевтического средства.

15. Способ уменьшения роста опухоли в млекопитающем, включающий обработку млекопитающего эффективным количеством комбинации конъюгата антитело-лекарственное средство и лекарственного средства или биологически активной терапии.

RU 2011140491 A

RU 2011140491 A