



(51) МПК
A61K 9/19 (2006.01) *A61P 35/00* (2006.01)
A61K 9/51 (2006.01) *B82B 1/00* (2006.01)
A61K 31/337 (2006.01) *B82Y 40/00* (2011.01)
A61K 39/00 (2006.01)
A61K 39/395 (2006.01)
A61K 39/44 (2006.01)
A61K 47/54 (2017.01)
A61K 47/59 (2017.01)
A61K 47/60 (2017.01)
A61K 47/69 (2017.01)

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2018129118, 10.02.2017

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
10.02.2016 US 62/293,617

(43) Дата публикации заявки: 10.03.2020 Бюл. № 7

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 10.09.2018(86) Заявка РСТ:
IB 2017/050762 (10.02.2017)(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2017/137953 (17.08.2017)Адрес для переписки:
129090, Москва, ул. Б.Спасская, 25, строение 3,
ООО "Юридическая фирма Городисский и
Партнеры"(71) Заявитель(и):
ПФАЙЗЕР ИНК. (US)(72) Автор(ы):
ЗЕЙЛ, Стефен Э. (US)

A

2018129118

RU

R U 2 0 1 8 1 2 9 1 1 8 A

(54) ТЕРАПЕВТИЧЕСКИЕ НАНОЧАСТИЦЫ, СОДЕРЖАЩИЕ ТЕРАПЕВТИЧЕСКИЙ АГЕНТ, И
СПОСОБЫ ИХ ПОЛУЧЕНИЯ И ПРИМЕНЕНИЯ

(57) Формула изобретения

1. Терапевтическая композиция, содержащая терапевтическую наночастицу, содержащую терапевтический агент и дилок-сополимер поли(молочной кислоты)-поли(этилен)гликоля, где терапевтическая наночастица содержит от примерно 10 до примерно 30 мас.% поли(этилен)гликоля; и ингибитор иммунной контрольной точки, где ингибитор иммунной контрольной точки представляет собой антитело против PD-1.
2. Терапевтическая композиция по п.1, отличающаяся тем, что антитело против PD-1 инкапсулировано в терапевтической наночастице вместе с терапевтическим агентом.
3. Терапевтическая композиция по п.1, отличающаяся тем, что антитело против PD-1 конъюгировано с поверхностью наночастицы.
4. Терапевтическая композиция по п.1, отличающаяся тем, что терапевтический агент представляет собой химиотерапевтический агент.
5. Терапевтическая композиция по п.1, отличающаяся тем, что терапевтическая наночастица содержит лиганд для направленной доставки.
6. Терапевтическая композиция по п.5, отличающаяся тем, что лиганд для направленной доставки представляет собой лиганд, направленный на простата-

специфичный мембранный антиген (PSMA).

7. Композиция по п.1, отличающаяся тем, что сополимер поли(молочной кислоты)-поли(этилен)гликоля имеет среднечисленную молекулярную массу поли(молочной кислоты) от примерно 15 кДа до примерно 30 кДа и среднечисленную молекулярную массу поли(этилен)гликоля от примерно 4 кДа до примерно 6 кДа.

8. Способ лечения пациента со злокачественным новообразованием, включающий введение:

а) терапевтической наночастицы, содержащей терапевтический агент и дилок-сополимер поли(молочной кислоты)-поли(этилен)гликоля, где терапевтическая наночастица содержит от примерно 10 до примерно 30 мас.% поли(этилен)гликоля; и

б) ингибитора иммунной контрольной точки.

9. Способ по п.8, отличающийся тем, что ингибитор иммунной контрольной точки представляет собой антитело против PD-1.

10. Способ по любому из пп.8 и 9, отличающийся тем, что терапевтическая наночастица содержит лиганд, направленный на простата-специфичный мембранный антиген (PSMA).

11. Терапевтическая наночастица, содержащая

терапевтический агент;

от примерно 0,2 до примерно 20 мас.% антитела; и

от примерно 50 до примерно 99,75 мас.% дилок-сополимера поли(молочной кислоты)-поли(этилен)гликоля, где терапевтическая наночастица содержит от примерно 10 до примерно 30 мас.% поли(этилен)гликоля.

12. Терапевтическая наночастица по п.11, содержащая от примерно 2 до примерно 5 мас.% антитела.

13. Терапевтическая наночастица по п.11, отличающаяся тем, что антитело представляет собой моноклональное антитело.

14. Терапевтическая наночастица по п.11, отличающаяся тем, что антитело представляет собой антитело против PD-1.

15. Терапевтическая наночастица по п.11, отличающаяся тем, что антитело ассоциировано с гидрофобным противоионом.

16. Терапевтическая наночастица по п.11, отличающаяся тем, что сополимер поли(молочной кислоты)-поли(этилен)гликоля имеет среднечисленную молекулярную массу поли(молочной кислоты) от примерно 15 кДа до примерно 20 кДа и среднечисленную молекулярную массу поли(этилен)гликоля от примерно 4 кДа до примерно 6 кДа.

17. Способ усиления противоопухолевого ответа у пациента, нуждающегося в этом, включающий совместное введение пациенту, нуждающемуся в этом, терапевтически эффективного количества терапевтической наночастицы и ингибитора иммунной контрольной точки.

18. Способ по п.17, отличающийся тем, что терапевтическая наночастица содержит терапевтический агент и дилок-сополимер поли(молочной кислоты)-поли(этилен)гликоля, где терапевтическая наночастица содержит от примерно 10 до примерно 30 мас.% поли(этилен)гликоля.

19. Способ по п.17 или 18, отличающийся тем, что ингибитор иммунной контрольной точки представляет собой антитело против PD-1.

20. Фармацевтическая композиция, содержащая терапевтическую наночастицу, содержащую терапевтический агент и дилок-сополимер поли(молочной кислоты)-поли(этилен)гликоля и лиганд, направленный на простата-специфичный мембранный антиген (PSMA), где терапевтическая наночастица содержит от примерно 10 до примерно 30 мас.% поли(этилен)гликоля, где указанная композиция лиофилизована.

21. Композиция по п.20, отличающаяся тем, что композиция дополнительно содержит

антитело против PD-1.

R U 2 0 1 8 1 2 9 1 1 8 A

R U 2 0 1 8 1 2 9 1 1 8 A