

(19)



SUOMI - FINLAND
(FI)

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

(10)

FI/EP3236934 T3

(12)

**EUROOPPAPATENTIN KÄÄNNÖS
ÖVERSÄTTNING AV EUROPEISKT PATENT
TRANSLATION OF EUROPEAN PATENT SPECIFICATION**

(45)

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

22.07.2024

(97)

Eurooppapatentin myöntämispäivä - Meddelandedatum för
det europeiska patentet - Date of grant of European patent

22.05.2024

(51)

Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassificering -
International patent classification

A61K 9/00 (2006 . 01)

A61K 51/12 (2006 . 01)

A61K 47/50 (2017 . 01)

A61K 9/127 (2006 . 01)

A61K 41/00 (2020 . 01)

A61K 31/704 (2006 . 01)

A61K 47/69 (2017 . 01)

A61P 35/00 (2006 . 01)

(96)

Eurooppapatenttihakemus - Europeisk patentansökan -
European patent application

EP15798435.2

(22)

Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date

24.11.2015

(97)

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

01.11.2017

(86)

Kansainvälinen hakemus - Internationell
ansökan - International application

24.11.2015 PCT/EP2015077425

(30)

Etuoikeus - Prioritet - Priority

25.11.2014 EP EP14306875

(73)

Haltija - Innehavare - Holder

1• CURADIGM SAS, 60 rue de Wattignies, 75012 Paris, (FR)

(72)

Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1• GERMAIN, Matthieu, 6 rue de la Fontaine, 77163 Dammartin Sur Tigeaux, (FR)

2• MEYRE, Marie-Edith, 3 Square Nungesser, 94160 Saint Mande, (FR)

3• POTTIER, Agnès, 6 rue Sainte-Beuve, 75006 Paris, (FR)

4• LEVY, Laurent, 246 Boulevard Raspail, 75014 Paris, (FR)

(74)

Asiamies - Ombud - Agent

Kolster Oy Ab, Salmisaarenaukio 1, 00180 Helsinki, (FI)

(54)

Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

Farmaseuttinen koostumus, valmiste ja sen käytöt

PHARMACEUTICAL COMPOSITION, PREPARATION AND USES THEREOF

Patenttivaatimukset

1. Farmaseuttinen yhdistelmä, jossa on (i) ainakin yksi bioyhteensopiva lipidipohjainen nanohiukkanen ja (ii) ainakin yksi kantoaine, joka käsittää ainakin yhden farmaseuttisen yhdisteen, jossa bioyhteensopivan nanohiukkasen pisin ulottuvuus on 4 - 500 nm mitattuna dynaamisella valonsironnalla (DLS), ja bioyhteensopivan nanohiukkasen pintavarausarvo on negatiivinen ja alle -10 mV, jossa kantoaine on lipidinen kantoaine ja jossa kantoaineen pinta on vailla tai ei paljasta polymeeriä, joka valitaan joukosta dekstraani, polysialohappo (PSA), hyaluronihappo, kitosaani, hepariini, polyvinyylipyrrolidoni (PVP), polyvinyylialkoholi (PVA), polyakryyliamidi, poly(etyleeniglykoli) (PEG) ja PEG-pohjainen kopolymeri, käytettäväksi terapeuttisena, profylaktisena tai diagnostisena koostumuksena tutkittavassa, joka tarvitsee mainittua ainakin yhtä farmaseuttista yhdistettä terapeuttisen, profylaktisen tai diagnostisen menetelmän yhteydessä, mainitun menetelmän käsittäessä vaiheen, jossa annetaan tutkittavalle ainakin yksi kantoaine, joka käsittää ainakin yhden farmaseuttisen yhdisteen, ja erillisen vaiheen, jossa annetaan ainakin yksi bioyhteensopiva nanohiukkanen, annettaessa mainittu ainakin yksi bioyhteensopiva nanohiukkanen tutkittavalle yli 5 minuuttia - 24 tuntia ennen ainakin yhden farmaseuttisen yhdisteen käsittävää ainakin yhtä kantoainetta, ja jossa bioyhteensopivaa nanohiukkasta ei käytetä sellaisenaan farmaseuttisena yhdisteenä.

2. Farmaseuttinen yhdistelmä käytettäväksi patenttivaatimuksen 1 mukaisesti, jossa bioyhteensopivan nanohiukkasen pintavarausarvo on negatiivinen ja alle -15 mV.

3. Farmaseuttinen yhdistelmä käytettäväksi patenttivaatimuksen 1 tai 2 mukaisesti, jossa nanohiukkanen on edelleen päällystetty bioyhteensopivalla pinnoitteella.

4. Farmaseuttinen yhdistelmä käytettäväksi patenttivaatimuksen 1 mukaisesti, jossa kantoaine on tasomainen kantoaine.

5. Farmaseuttinen yhdistelmä käytettäväksi patenttivaatimuksen 1 mukaisesti, jossa kantoaine on ontto kantoaine.

6. Farmaseuttinen yhdistelmä käytettäväksi minkä tahansa patenttivaatimuksen 1-5 mukaisesti, jossa lipidinen kantoaine on liposomi tai miselli.

7. Farmaseuttinen yhdistelmä käytettäväksi patenttivaatimuksen 6 mukaisesti, jossa lipidinen kantoaine on liposomi ja liposomi käsittää 62 mooliprosenttia dipalmitoyylifosfatidyylikoliinia (DPPC), 22 mooliprosenttia hydrogenoitua soijapapufosfatidyylikoliinia (HSPC) ja 16 mooliprosenttia kolesterolia (Chol);

90 mooliprosenttia dipalmitoyylifosfatidyylikoliinia (DPPC) ja 10 mooliprosenttia monopalmitoyylifosfatidyylikoliinia (MPPC); tai 1-palmitoyyli-2-oleoyyli-sn-glysero-3-fosfokoliinia (POPC) ja 1,2-dioleoyyli-sn-glysero-3-fosfoetanoliamiinia (DOPE) moolisuhteessa 3:1 ja vastaavan määrän α -(3'-O-kolesteryylioksikarbonyyli)- δ -(N-etyylimorfoliini)-sukkiniamidia (MoChol) ja kolesteryylihemisukki-naattia (CHEMS).

8. Farmaseuttinen yhdistelmä käytettäväksi minkä tahansa patenttivaatimuksen 1-7 mukaisesti, jossa ainakin yhden bioyhteensopivan lipidipohjaisen nanohiukkasen ja farmaseuttisen yhdisteen (yhdisteet) käsittävän ainakin yhden kantoaineen yhdistetty antaminen säilyttää mainit(tu)je)n farmaseuttis(t)en yhdiste(id)en terapeuttisen hyödyn alentunutta toksisuutta varten tai lisää mainit(tu)je)n farmaseuttis(t)en yhdiste(id)en terapeuttista hyötyä vastaavaa tai alentunutta toksisuutta varten tutkittavalle verrattuna mainit(tu)je)n yhdiste(id)en terapeuttisen vakioannoksen (terapeuttisten vakioannosten) aikaansaamaan terapeuttiseen hyötyyn ja toksisuuteen minkä tahansa bioyhteensopivan nanohiukkasen ja/tai kantoaineen puuttuessa.

9. Farmaseuttinen yhdistelmä käytettäväksi minkä tahansa patenttivaatimuksen 1-7 mukaisesti, jossa ainakin yhden bioyhteensopivan lipidipohjaisen nanohiukkasen ja farmaseuttisen yhdisteen (yhdisteet) käsittävän ainakin yhden kantoaineen yhdistetty antaminen sallii annet(tu)je)n farmaseuttis(t)en yhdiste(id)en terapeuttis(t)en annoksen (annosten) pienentämisen ainakin 10 %:lla verrattuna mainit(tu)je)n yhdiste(id)en terapeuttiseen vakioannokseen (terapeuttisiin vakioannoksiin) säilytettäessä sama terapeuttinen hyöty vastaavaa toksisuutta tai alentunutta toksisuutta varten tutkittavalle tai kasvatettaessa terapeuttista hyötyä vastaavaa tai alentunutta toksisuutta varten tutkittavalle minkä tahansa bioyhteensopivan nanohiukkasen ja/tai kantoaineen puuttuessa.

10. Farmaseuttinen yhdistelmä käytettäväksi minkä tahansa patenttivaatimuksen 1-9 mukaisesti, jossa nanohiukkanen poistuu tutkittavasta, jolle se on annettu, yhden tunnin ja kuuden viikon sisällä sen antamisesta tutkittavalle, joka tarvitsee patenttivaatimuksessa 1 viitattua ainakin yhtä farmaseuttista yhdistettä.

11. Farmaseuttinen yhdistelmä käytettäväksi minkä tahansa patenttivaatimuksen 1-10 mukaisesti, jossa farmaseuttinen yhdiste valitaan pienestä molekyylistä, erityisesti kohdennetusta pienestä molekyylistä, sytotoksisesta yhdisteestä ja siirtymämetallikoordinaatiokompleksista.

12. Farmaseuttinen yhdistelmä käytettäväksi minkä tahansa patenttivaatimuksen 1–11 mukaisesti, jossa farmaseuttinen yhdiste kapseloidaan kantoaineeseen, impregnoidaan kantoaineeseen tai sidotaan kantoaineeseen.

5 13. Farmaseuttinen yhdistelmä käytettäväksi minkä tahansa patenttivaatimuksen 1–12 mukaisesti, jossa farmaseuttinen yhdiste vapautuu kantoaineesta ajallisesti valvotulla diffuusiolla, kantoaineen eroosiolla ja/tai kantoaineen degradaatiolla.

10 14. Farmaseuttinen yhdistelmä käytettäväksi minkä tahansa patenttivaatimuksen 1–12 mukaisesti, jossa farmaseuttinen yhdiste vapautuu kantoaineesta vastineena solunsisäiseen tai solunulkoiseen ärsykkeeseen.

15 15. Farmaseuttinen yhdistelmä käytettäväksi minkä tahansa patenttivaatimuksen 1–12 mukaisesti, jossa farmaseuttinen yhdiste vapautuu kantoaineesta, kun mainittu kantoaine altistuu sähkömagneettisille säteilyille, ultraäänille ja magneettikentälle.

20 16. Farmaseuttinen yhdistelmä käytettäväksi patenttivaatimuksen 6 mukaisesti, jossa lipidinen kantoaine on synteettisen fosfolipidin käsittävä liposomi, liposomi, joka käsittää peptidin, joka muuttaa konformaatiotaan (alfa-heliksistä beeta-levyksi) pH- tai lämpötilärsykkeestä, tai amfoteerinen liposomi, joka käsittää 1-palmitoyyli-2-oleoyyli-sn-glysero-3-fosfokoliinia (POPC) ja 1,2-dioleoyyli-sn-glysero-3-fosfoetanoliamiinia (DOPE) moolisuhteessa 3:1 ja vastavan määrän heikkoa kationista ja heikkoa anionista amfifiliä, molemmat johdettuna kolesterolista, α -(3'-0-kolesteryylioksidikarbonyyli)- δ -(N-etyylimorfoliini)sukkiiniamidista (MoChol) ja kolesteryylihemisukkinaatista (CHEMS).