

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】令和1年9月19日(2019.9.19)

【公表番号】特表2019-512006(P2019-512006A)

【公表日】令和1年5月9日(2019.5.9)

【年通号数】公開・登録公報2019-017

【出願番号】特願2018-541254(P2018-541254)

【国際特許分類】

A 6 1 K	47/60	(2017.01)
A 6 1 K	47/59	(2017.01)
A 6 1 K	47/34	(2017.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 K	9/16	(2006.01)
A 6 1 K	45/06	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 K	38/10	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
B 8 2 Y	5/00	(2011.01)
B 8 2 Y	30/00	(2011.01)
B 8 2 Y	40/00	(2011.01)
G 0 1 N	33/68	(2006.01)
G 0 1 N	33/50	(2006.01)
G 0 1 N	33/15	(2006.01)
G 0 1 N	21/41	(2006.01)
C 0 7 K	14/485	(2006.01)
C 0 7 K	17/08	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	47/60	Z N A
A 6 1 K	47/59	
A 6 1 K	47/34	
A 6 1 K	45/00	
A 6 1 K	9/16	
A 6 1 K	45/06	
A 6 1 P	43/00	1 2 1
A 6 1 K	38/10	
A 6 1 P	35/00	
B 8 2 Y	5/00	
B 8 2 Y	30/00	
B 8 2 Y	40/00	
G 0 1 N	33/68	
G 0 1 N	33/50	Z
G 0 1 N	33/15	Z
G 0 1 N	21/41	1 0 1
C 0 7 K	14/485	
C 0 7 K	17/08	

【手続補正書】

【提出日】令和1年8月6日(2019.8.6)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

治療剤と、

ジブロックポリ(乳)酸-ポリ(エチレン)グリコールコポリマーまたはジブロックポリ(乳)酸-co-ポリ(グリコール)酸-ポリ(エチレン)グリコールコポリマーと、PLA-PEG-EGFRリガンドとして表されるポリマーコンジュゲートであって、EGFRリガンドは、直接、間接的に、または化学リンカーを介してPEGに結合または会合しており、PLAは、ポリ(乳)酸であり、PEGは、ポリ(エチレン)グリコールである、ポリマーコンジュゲートとを含む治療用ナノ粒子。

【請求項2】

約0.2～約35重量パーセントの治療剤と、

約50～約98重量パーセントのジブロックポリ(乳)酸-ポリ(エチレン)グリコールコポリマーまたはジブロックポリ(乳)酸-co-ポリ(グリコール)酸-ポリ(エチレン)グリコールコポリマーと、

約2%～約12%のPLA-PEG-EGFRリガンド密度であって、EGFRリガンドは、アジド官能化PEG-PLAに結合または会合しており、PLAは、ポリ(乳)酸であり、PEGは、ポリ(エチレン)グリコールである、PLA-PEG-EGFRリガンド密度と

を含む治療用ナノ粒子。

【請求項3】

前記治療用ナノ粒子の流体力学的直径が約60～約150nmである、請求項1から2のいずれか一項に記載の治療用ナノ粒子。

【請求項4】

前記流体力学的直径が約90～約140nmである、請求項1から3のいずれか一項に記載の治療用ナノ粒子。

【請求項5】

約1～約10重量パーセントの前記治療剤を含む、請求項1から4のいずれか一項に記載の治療用ナノ粒子。

【請求項6】

前記EGFRリガンドがペプチドである、請求項1から5に記載の治療用ナノ粒子。

【請求項7】

ペプチドが、クリック化学反応によって、ナノ粒子に共有結合性にコンジュゲートされている、請求項6に記載の治療用ナノ粒子。

【請求項8】

Ac-DPCTWEVWGRECLQGGK(PEG4-DBCO)-CONH<sub>2</sub>、Ac-DACTWEVWGRECLQGGK(PEG4-DBCO)-CONH<sub>2</sub>、Ac-DPCT(2Ind)GEV(5MeO)WGREGCLQGGK(PEG4-DBCO)-CONH<sub>2</sub>、Ac-DPPentWEVWGREPenLQGGK(PEG4-DBCO)-CONH<sub>2</sub>、AcDAPenTWEVWGREPenLQGGK(DBCO)-CONH<sub>2</sub>、Ac-DACT(2Ind)GEV(5MeO)WGREGCLQGGK(DBCO)-CONH<sub>2</sub>、Ac-DAPenT(2Ind)GEV(5MeO)WGREGPenLQGGK(DBCO)-CONH<sub>2</sub>、Ac-DAPenT(2Ind)GEV(5MeO)WGREGPenLQGGK(DBCO)-CONH<sub>2</sub>、Ac-DAPenTWEVWGREPenLQGGK(DBCO)-CONH<sub>2</sub>、Ac-DPCTWEVWGRECLQGGK(PEG5-DBCO)-CONH<sub>2</sub>、Ac-DACT(2Ind)G

E V ( 5 M e O ) W G R E C L Q G G K ( D B C O ) - C O N H 2 、 A c D P P e n T ( 2 I n d ) G E V ( 5 M e O ) W G R E P e n L Q G G K ( D B C O ) - C O N H 2 、 および A c D A P e n T ( 2 I n d ) G E V ( 5 M e O ) W G R E P e n L Q G G K ( D B C O ) - C O N H 2 、 A c - D P C T W E V W G R E C L Q G G K ( P E G 5 - D B C O ) - C O N H 2 、 またはこれらの修飾体からなる群から選択される配列を含むペプチジルリガンドにコンジュゲートさせた P L A - P E G を含むナノ粒子。

**【請求項 9】**

ペプチジルリガンド分子にコンジュゲートさせた約 200 ~ 約 500 の前記 P L A - P E G を含む、請求項 8 に記載のナノ粒子。

**【請求項 10】**

前記 P L A - P E G が、アジド官能化 P L A - P E G を反応させ、歪み促進型アルキン - アジド付加環化を使用することにより、前記ペプチジルリガンド分子にコンジュゲートされている、請求項 8 または 9 に記載のナノ粒子。

**【請求項 11】**

前記 P L A - P E G の P L A が、約 15 ~ 約 17 k D a の数平均分子量を有する、請求項 1 から 10 のいずれか一項に記載のナノ粒子。

**【請求項 12】**

前記 P L A - P E G の P E G が、約 4 ~ 約 6 k D a の数を有する、請求項 1 から 10 のいずれか一項に記載のナノ粒子。

**【請求項 13】**

請求項 1 から 12 のいずれかに記載の複数の治療用ナノ粒子と、薬学的に許容できる添加剤とを含む、薬学的に許容できる組成物。