

【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 150 nm 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 140 nm 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-DPCTWEVWGRECLQG G K (PEG4-DBCO)-CONH<sub>2</sub>、Ac-DACTWEVWGRECLQG G K (PEG4-DBCO)-CONH<sub>2</sub>、Ac-DPCT(2Ind)GEV(5MeO)WGRECLQG G K (PEG4-DBCO)-CONH<sub>2</sub>、Ac-DPPenTWEVWGREPenLQG G K (PEG4-DBCO)-CONH<sub>2</sub>、AcDAPenTWEVWGREPenLQG G K (DBCO)-CONH<sub>2</sub>、Ac-DACT(2Ind)GEV(5MeO)WGRECLQ、GGK(DBCO)-CONH<sub>2</sub>、Ac-DPPenT(2Ind)GEV(5MeO)WGREPenLQG G K (DBCO)-CONH<sub>2</sub>、Ac-DAPenT(2Ind)GEV(5MeO)WGREPenLQG G K (DBCO)-CONH<sub>2</sub>、Ac-DAPenTWEVWGREPenLQG G K (DBCO)-CONH<sub>2</sub>、Ac-DPCTWEVWGRECLQG G K (PEG5-DBCO)-CONH<sub>2</sub>、Ac-DACT(2Ind)G

EV(5MeO)WGRELQGGK(DBCO)-CONH<sub>2</sub>、AcDPPenT(2Ind)GEV(5MeO)WGREPenLQGGK(DBCO)-CONH<sub>2</sub>、およびAcDAPenT(2Ind)GEV(5MeO)WGREPenLQGGK(DBCO)-CONH<sub>2</sub>、Ac-DPCTWEVWGRELQGGK(PEG5-DBCO)-CONH<sub>2</sub>、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PLA-PEG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PLA-PEGを含む、請求項8に記載のナノ粒子。

【請求項 10】

前記PLA-PEGが、アジド官能化PLA-PEG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PLA-PEGのPLAが、約15～約17kDa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PLA-PEGのPEGが、約4～約6kDa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。