

【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】平成29年5月25日(2017.5.25)

【公表番号】特表2016-526011(P2016-526011A)

【公表日】平成28年9月1日(2016.9.1)

【年通号数】公開・登録公報2016-052

【出願番号】特願2016-507628(P2016-507628)

【国際特許分類】

A 6 1 K	9/51	(2006.01)
C 0 7 J	5/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	5/44	(2006.01)
A 6 1 K	33/24	(2006.01)
A 6 1 K	31/616	(2006.01)
A 6 1 K	47/34	(2017.01)
A 6 1 K	47/50	(2017.01)
A 6 1 K	31/573	(2006.01)
A 6 1 K	31/663	(2006.01)
A 6 1 P	19/08	(2006.01)
C 0 7 D	249/04	(2006.01)
C 0 7 C	69/157	(2006.01)
C 0 7 F	9/38	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 K	38/00	(2006.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	9/51	
C 0 7 J	5/00	C S P
A 6 1 P	35/00	Z N A
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	5/44	
A 6 1 K	33/24	
A 6 1 K	31/616	
A 6 1 K	47/34	
A 6 1 K	47/48	
A 6 1 K	31/573	
A 6 1 K	31/663	
A 6 1 P	19/08	
C 0 7 D	249/04	5 0 3
C 0 7 C	69/157	
C 0 7 F	9/38	E
A 6 1 P	43/00	1 2 1
A 6 1 K	37/02	
A 6 1 K	45/00	

【手続補正書】

【提出日】平成29年4月6日(2017.4.6)

【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】

前立腺癌の治療薬の製造における、化学療法剤と抗炎症剤とを含むナノ粒子の使用。

【請求項2】

前記ナノ粒子が親水性コアと前記コアを取り囲む親水性層とを含む、請求項1に記載の使用。

【請求項3】

前記化学療法剤と前記抗炎症剤が前記コアに結合している、請求項1または2に記載の使用。

【請求項4】

前記化学療法剤がシスプラチニンである、請求項1～3のいずれか一項に記載の使用。

【請求項5】

前記抗炎症剤がアスピリンである、請求項1～4のいずれか一項に記載の使用。

【請求項6】

前記前立腺癌が去勢抵抗性前立腺癌である、請求項1～5のいずれか一項に記載の使用。

【請求項7】

前記ナノ粒子は、同等の用量の前記遊離化学療法剤と前記遊離抗炎症剤との組合せよりも前立腺癌細胞に対する細胞毒性が高い、請求項1～6のいずれか一項に記載の使用。

【請求項8】

治療を必要とする対象の前立腺癌の治療のための組成物であって、化学療法剤と抗炎症剤とを含むナノ粒子を治療有効量含む、組成物。

【請求項9】

前記ナノ粒子が親水性コアと前記コアを取り囲む親水性層とを含む、請求項8に記載の組成物。

【請求項10】

前記化学療法剤と前記抗炎症剤が前記コアに結合している、請求項8または9に記載の組成物。

【請求項11】

前記化学療法剤がシスプラチニンである、請求項8～10のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項12】

前記抗炎症剤がアスピリンである、請求項8～11のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項13】

前記前立腺癌が去勢抵抗性前立腺癌である、請求項8～12のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項14】

前記ナノ粒子は、同等の用量の前記遊離化学療法剤と前記遊離抗炎症剤との組合せよりも前立腺癌細胞に対する細胞毒性が高い、請求項8～13のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項15】

コアの少なくとも一部を形成する疎水性ポリマーがポリ乳酸（PLA）を含むポリマーと、ポリ乳酸-コ-グリコール酸（PLGA）を含むポリマーとからなる群から選択される疎水性ナノ粒子コアと；

親水性ポリマー部分が前記コアの少なくとも一部を形成する疎水性ポリマー部分を介して前記コアに結合している、前記コアを取り囲む親水性層と；

前記コアに結合した抗炎症剤と；
前記コアに結合した化学療法剤と；
を含むナノ粒子。

【請求項 16】

前記抗炎症剤がコルチコステロイドまたは非ステロイド系抗炎症薬である、請求項 15 に記載のナノ粒子。

【請求項 17】

前記抗炎症剤がアスピリンである、請求項 15 に記載のナノ粒子。

【請求項 18】

前記抗炎症剤がプレドニゾンである、請求項 15 に記載のナノ粒子。

【請求項 19】

前立腺癌ターゲティング部分をさらに含む、請求項 15 ~ 18 のいずれか一項に記載のナノ粒子。

【請求項 20】

前記ターゲティング部分が、前立腺特異膜抗原に選択的に結合するように構成された部分である、請求項 19 に記載のナノ粒子。

【請求項 21】

前記ターゲティング部分が、アミノ酸配列 W Q P D T A H H W A T L (配列番号 1) を有するペプチド、またはその前立腺特異膜抗原結合断片を含む、請求項 19 に記載のナノ粒子。

【請求項 22】

前記抗炎症剤が、前記疎水性コアの少なくとも一部を形成するポリマーにコンジュゲートしている、請求項 15 ~ 21 のいずれか一項に記載のナノ粒子。

【請求項 23】

前記化学療法剤が、前記疎水性コアの少なくとも一部を形成するポリマーにコンジュゲートしている、請求項 15 ~ 22 のいずれか一項に記載のナノ粒子。

【請求項 24】

前記抗炎症剤がコンジュゲートしているポリマーは、前記化学療法剤がコンジュゲートしているポリマーである、請求項 23 に記載のナノ粒子。

【請求項 25】

骨吸収阻害剤をさらに含む、請求項 15 ~ 24 のいずれか一項に記載のナノ粒子。

【請求項 26】

前記骨吸収阻害剤がパミドロネートである、請求項 25 に記載のナノ粒子。

【請求項 27】

治療を必要とする対象を治療するための、請求項 15 ~ 25 のいずれか一項に記載のナノ粒子を含む組成物。

【請求項 28】

コアの少なくとも一部を形成する疎水性ポリマーがポリ乳酸 (P L A) を含むポリマーと、ポリ乳酸 - c o - グリコール酸 (P L G A) を含むポリマーとからなる群から選択される疎水性ナノ粒子コアと；

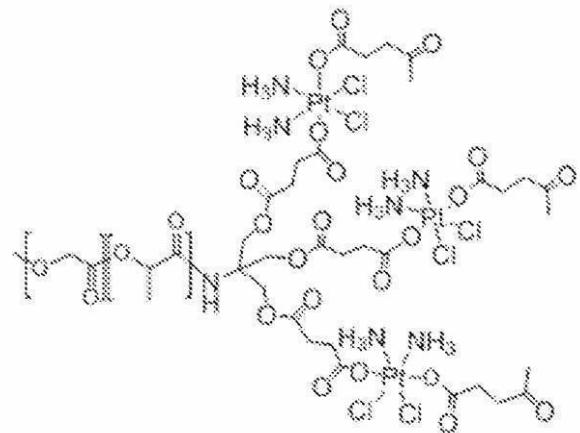
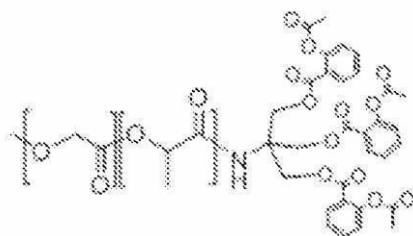
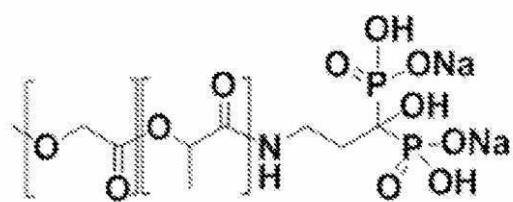
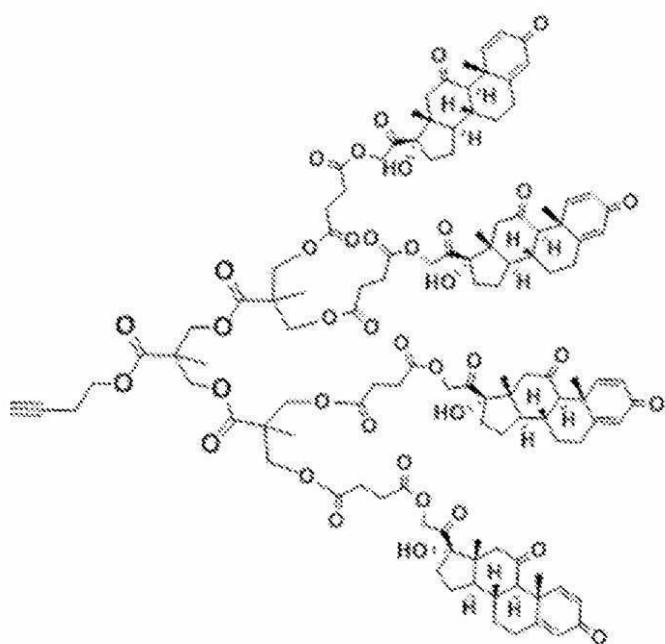
親水性ポリマー部分が前記コアの少なくとも一部を形成する疎水性ポリマー部分を介して前記コアに結合している、前記コアを取り囲む親水性層と；

前記コアに結合した骨吸収阻害剤と；

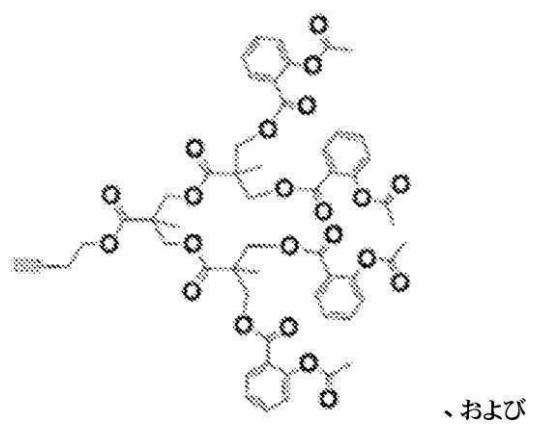
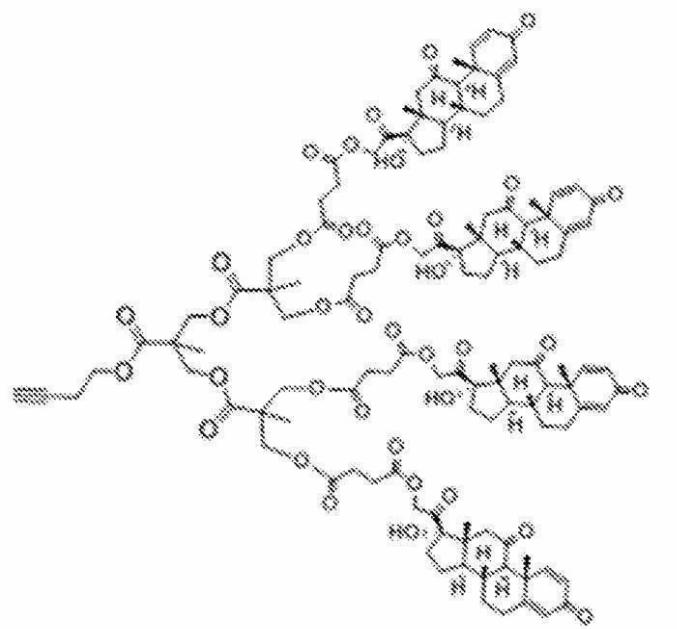
前記コアに結合した化学療法剤と；
を含むナノ粒子。

【請求項 29】

【化 1】

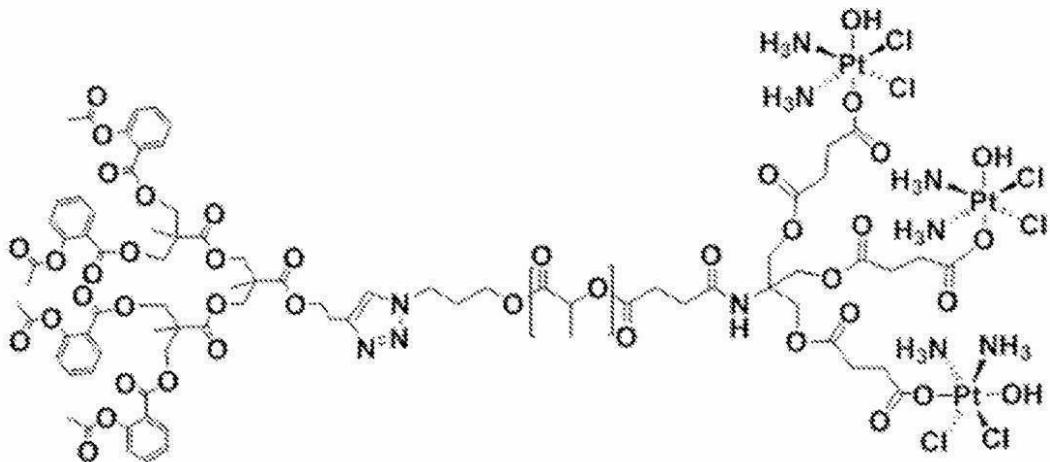


【化 2】



、および

【化3】



からなる群から選択される化合物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0012

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0012】

本明細書に記載の様々な実施形態の1つ以上が従来の療法および治療剤より有利な点は、以下の詳細な説明を添付の図面と併せて読めば、当業者には容易に明らかとなるであろう。

本発明の実施形態において、例えば以下の項目が提供される。

(項目1)

前立腺癌の治療薬の製造における、化学療法剤と抗炎症剤とを含むナノ粒子の使用。

(項目2)

前記ナノ粒子が親水性コアと前記コアを取り囲む親水性層とを含む、項目1に記載の使用。

(項目3)

前記化学療法剤と前記抗炎症剤が前記コアに結合している、項目1または2に記載の使用。

(項目4)

前記化学療法剤がシスプラチンである、項目1～3のいずれか一項に記載の使用。

(項目5)

前記抗炎症剤がアスピリンである、項目1～4のいずれか一項に記載の使用。

(項目6)

前記前立腺癌が去勢抵抗性前立腺癌である、項目1～5のいずれか一項に記載の使用。

(項目7)

前記ナノ粒子は、同等の用量の前記遊離化学療法剤と前記遊離抗炎症剤との組合せよりも前立腺癌細胞に対する細胞毒性が高い、項目1～6のいずれか一項に記載の使用。

(項目8)

治療を必要とする対象の前立腺癌の治療方法において、

化学療法剤と抗炎症剤とを含むナノ粒子を治療有効量、前記対象に投与する工程、を含む方法。

(項目9)

前記ナノ粒子が親水性コアと前記コアを取り囲む親水性層とを含む、項目8に記載の方法。

(項目10)

前記化学療法剤と前記抗炎症剤が前記コアに結合している、項目8または9に記載の方法。

(項目11)

前記化学療法剤がシスプラチニンである、項目7～10のいずれか一項に記載の方法。

(項目12)

前記抗炎症剤がアスピリンである、項目7～11のいずれか一項に記載の方法。

(項目13)

前記前立腺癌が去勢抵抗性前立腺癌である、項目7～12のいずれか一項に記載の方法。

。

(項目14)

前記ナノ粒子は、同等の用量の前記遊離化学療法剤と前記遊離抗炎症剤との組合せよりも前立腺癌細胞に対する細胞毒性が高い、項目7～13のいずれか一項に記載の使用。

(項目15)

コアの少なくとも一部を形成する疎水性ポリマーがポリ乳酸（PLA）を含むポリマーと、ポリ乳酸-*c o*-グリコール酸（PLGA）を含むポリマーとからなる群から選択される疎水性ナノ粒子コアと；

親水性ポリマー部分が前記コアの少なくとも一部を形成する疎水性ポリマー部分を介して前記コアに結合している、前記コアを取り囲む親水性層と；

前記コアに結合した抗炎症剤と；

前記コアに結合した化学療法剤と；

を含むナノ粒子。

(項目16)

前記抗炎症剤がコルチコステロイドまたは非ステロイド系抗炎症薬である、項目15に記載のナノ粒子。

(項目17)

前記抗炎症剤がアスピリンである、項目15に記載のナノ粒子。

(項目18)

前記抗炎症剤がプレドニゾンである、項目15に記載のナノ粒子。

(項目19)

前立腺癌ターゲティング部分をさらに含む、項目15～18のいずれか一項に記載のナノ粒子。

(項目20)

前記ターゲティング部分が、前立腺特異膜抗原に選択的に結合するように構成された部分である、項目19に記載のナノ粒子。

(項目21)

前記ターゲティング部分が、アミノ酸配列W Q P D T A H H W A T L（配列番号1）を有するペプチド、またはその前立腺特異膜抗原結合断片を含む、項目19に記載のナノ粒子。

(項目22)

前記抗炎症剤が、前記疎水性コアの少なくとも一部を形成するポリマーにコンジュゲートしている、項目15～21のいずれか一項に記載のナノ粒子。

(項目23)

前記化学療法剤が、前記疎水性コアの少なくとも一部を形成するポリマーにコンジュゲートしている、項目15～22のいずれか一項に記載のナノ粒子。

(項目24)

前記抗炎症剤がコンジュゲートしているポリマーは、前記化学療法剤がコンジュゲートしているポリマーである、項目23に記載のナノ粒子。

(項目25)

骨吸収阻害剤をさらに含む、項目15～24のいずれか一項に記載のナノ粒子。

(項目26)

前記骨吸収阻害剤がパミドロネートである、項目25に記載のナノ粒子。

(項目27)

治療を必要とする対象を治療するための、項目15～25のいずれか一項に記載のナノ粒子の使用。

(項目28)

コアの少なくとも一部を形成する疎水性ポリマーがポリ乳酸（PLA）を含むポリマーと、ポリ乳酸-*c o*-グリコール酸（PLGA）を含むポリマーとからなる群から選択される疎水性ナノ粒子コアと；

親水性ポリマー部分が前記コアの少なくとも一部を形成する疎水性ポリマー部分を介して前記コアに結合している、前記コアを取り囲む親水性層と；

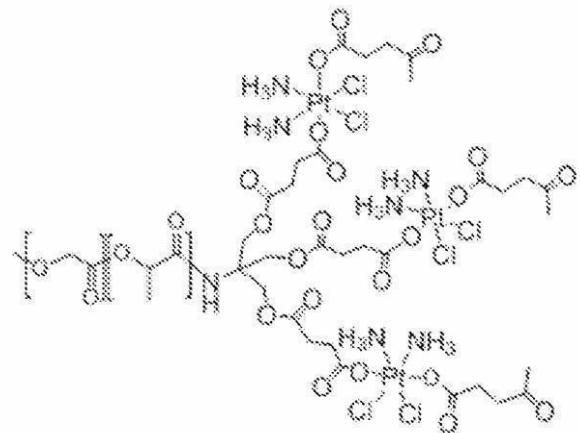
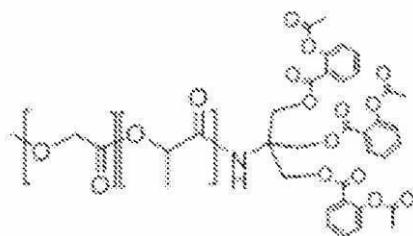
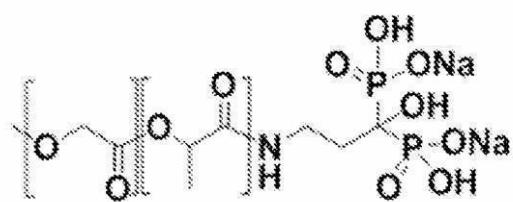
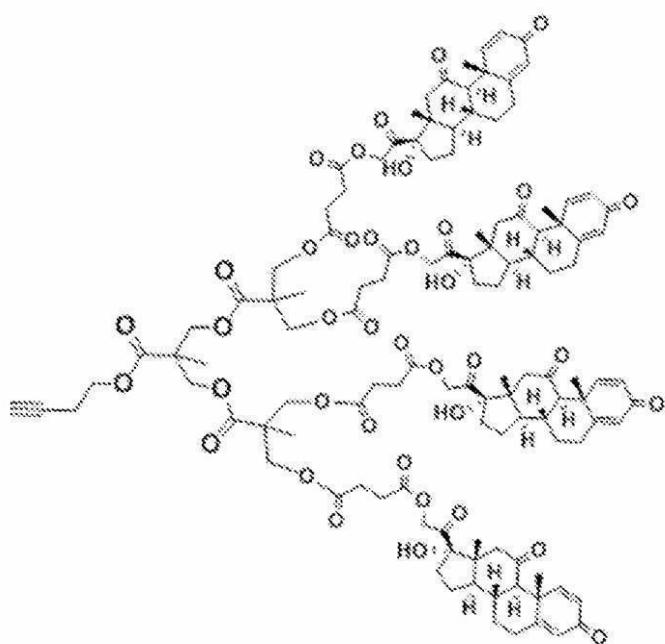
前記コアに結合した骨吸収阻害剤と；

前記コアに結合した化学療法剤と；

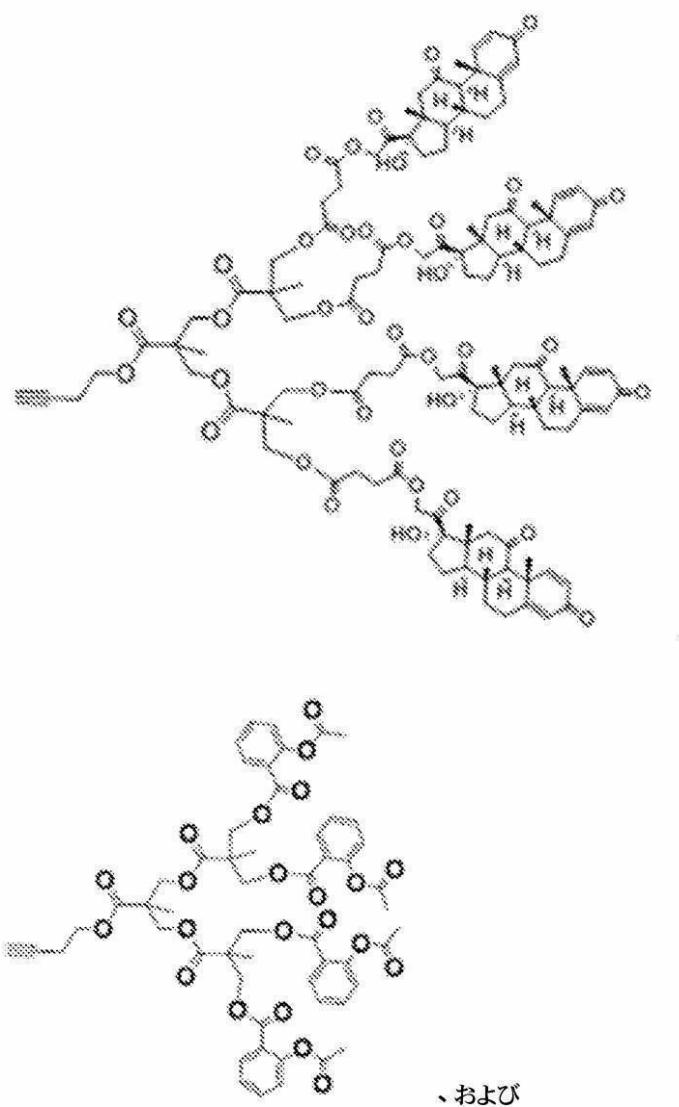
を含むナノ粒子。

(項目29)

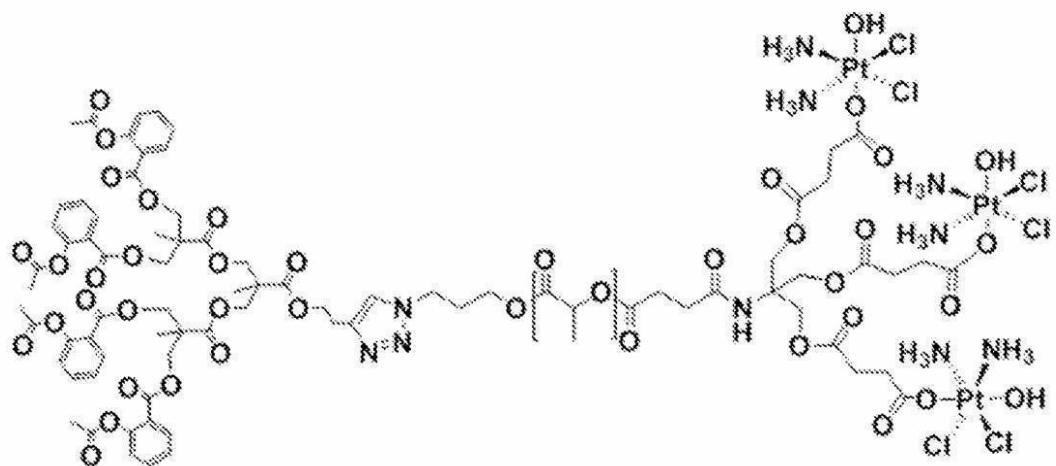
【化 1】



【化 2】



【化 3】



からなる群から選択される化合物。