

【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 17 年 10 月 6 日 (2005.10.6)

【公表番号】 特表 2001-511811(P2001-511811A)

【公表日】 平成 13 年 8 月 14 日 (2001.8.14)

【出願番号】 特願 平 10-535974

【国際特許分類第 7 版】

A 6 1 K 31/59

A 6 1 K 9/00

A 6 1 K 47/48

A 6 1 P 19/08

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00

【F I】

A 6 1 K 31/59

A 6 1 K 9/00

A 6 1 K 47/48

A 6 1 P 19/08

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】 平成 17 年 2 月 14 日 (2005.2.14)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】 明細書

【補正対象項目名】 補正の内容のとおり

【補正方法】 変更

【補正の内容】

手 続 補 正 書

平成 17.2.14 年 月 日

特許庁長官 小 川 洋 殿



1. 事件の表示 平成 10 年特許願第 5 3 5 9 7 4 号

2. 補正をする者

事件との関係 出 願 人

名 称 ボーン ケア インターナショナル
インコーポレイテッド

3. 代 理 人

住 所 東京都千代田区丸の内 3 丁目 3 番 1 号
電話 (代) 3211-8741

氏 名 (5995) 弁理士 中 村 稔



4. 補正命令の日付 自 発

5. 補正対象書類名 明細書

6. 補正対象項目名 請求の範囲

7. 補正の内容 別紙記載の通り

請求の範囲

1. 関係する組織に対する親和性を有する標的分子部分と会合したビタミンD部分を1種以上含む複合体。
2. 前記1種以上のビタミンD部分の前記1種以上の標的分子部分に対するモル比が1:1である請求の範囲第1項記載の複合体。
3. 前記ビタミンD部分が連結基により前記標的分子部分と会合している請求の範囲第1項記載の複合体。
4. 前記連結基が、前記ビタミンD部分及び前記標的分子部分間の結合を形成するために、両者の修飾により形成された結合基である請求の範囲第3項記載の複合体。
5. 前記連結基が二官能性コネクタである請求の範囲第3項記載の複合体。
6. 前記ビタミンD部分が連結基及び1種以上の追加の連結基により前記標的分子部分と会合している請求の範囲第3項記載の複合体。
7. 前記標的分子部分がビスホスホネート部分である請求の範囲第1項記載の複合体。
8. 前記標的分子部分がデヒドロエピアンドロステロン部分である請求の範囲第1項記載の複合体。
9. 前記ビスホスホネートが、ビタミンD部分のC-1、C-3、C-24またはC-25位で前記ビタミンD部分と結合している請求の範囲第7項記載の複合体。
10. 前記標的分子部分が金属イオンである請求の範囲第1項記載の複合体。
11. 前記二官能性コネクタが、前記標的分子部分とキレート結合し、前記ビタミンD部分とアミド結合により結合しているアミノ酸である請求の範囲第5項記載の複合体。
12. 前記金属イオンが、 Sr^{2+} 、 Zn^{2+} 、 Mg^{2+} 、 Fe^{2+} 、 Cu^{2+} 、 Mn^{2+} 、 Ca^{2+} 、 Cu^{2+} 、 Co^{2+} 、 Cr^{2+} または Mo^{2+} からなる群から選択された二価の金属イオンである請求の範囲第10項記載の複合体。
13. 前記標的分子部分が抗体である請求の範囲第1項記載の複合体。
14. 前記抗体標的分子部分がビオチン-アビジン結合により前記ビタミンD部分と会合しており、前記ビオチンが前記抗体と結合し、前記アビジンが前記ビタ

ミンD部分と結合している請求の範囲第13項記載の複合体。

15. 前記標的分子部分が単クローン性抗体である請求の範囲第13項記載の複合体。

16. 前記標的分子部分が多クローン性抗体である請求の範囲第13項記載の複合体。

17. 複合されているビタミンD部分以外の1種以上の治療剤を更に含む請求の範囲第1項記載の複合体。

18. 前記治療剤が、複合エストロゲンまたはその等価物、抗エストロゲン、カルシトニン、ビスホスホネート、カルシウム補助薬、コバラミン、百日咳トキシン、ホウ素、デヒドロエピアンドロステロン、形質転換骨成長因子 β 、アクチビン、及び骨の形態形成タンパク質からなる群から選択された骨の治療剤である請求の範囲第17項記載の複合体。

19. 前記治療剤が、estromustene、ホスフェート、prednimustine、シスプラチン、S-フルオロウラシル、メルファラン、ヒドロキシ尿素、マイトマイシン、イダルビシン、メトトレキセート、アドリアマイシン及びダウノマイシンからなる群から選択された細胞障害剤である請求の範囲第17項記載の複合体。

20. 関係する組織に対する親和性を有する標的分子部分1種以上と会合したビタミンD部分を1種以上含む複合体、及び適する薬学的に許容しうるキャリアーを含む薬学的組成物。

21. 時間に合わせた複合体の放出のために、複合体をカプセル化する異なる分解性の塗膜を更に含む請求の範囲第20項記載の薬学的組成物。

22. 前記塗膜が腸溶コーティングである請求の範囲第20項記載の薬学的組成物。

23. 患者に関係する組織にビタミンD部分をサイト特異的に運搬するための医薬組成物であって、薬学的に許容しうるキャリアー中にビタミンD部分を含む複合体を治療上有効量で含み、該複合体が標的分子部分1種以上と結合しているビタミンD部分を1種以上有し、該標的分子部分が該関係する組織に対して親和性を有している、医薬組成物。

24. 該複合体が骨の病気の患者に経口的に投与するのに適していて、該複合体

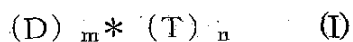
の治療上有効量が単位投与量当たり 0.5 乃至 50 nmol である、請求の範囲第 23 記載の医薬組成物。

25. 該複合体が過剰増殖の病気の患者に経口的に投与するのに適していて、該複合体の治療上有効量が単位投与量当たり約 1 乃至約 100 nmol である、請求の範囲第 23 項記載の医薬組成物。

26. 該標的分子部分の親和性が、該関係する組織への該複合体の運搬を達成するのに十分である、請求の範囲第 23 項記載の医薬組成物。

27. 該標的分子部分が該関係する組織において切断され、それにより該複合体のビタミン D 部分の有効性が増大される請求の範囲第 26 項記載の医薬組成物。

28. 以下の式(I)の複合体。



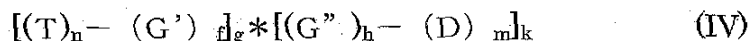
(式中、各 D はビタミン D 部分を表し、各 T は標的分子部分を表し、n 及び m は 1 以上の整数を表し、かつ * は標的分子部分がビタミン D 部分と会合していることを示す。)

29. 前記 T が、癌細胞のビタミン D 受容体に向かう能力を有する薬剤である請求の範囲第 28 項記載の複合体を含む抗増殖性組成物。

30. 前記 T が、単クローン性、多クローン性抗体またはそのフラグメント、金属イオン、向骨剤、または向腫瘍剤である請求の範囲第 28 項記載の複合体。

31. 前記向骨剤が、ビスホスホネート、テトラサイクリン、ポリマロネートまたはデヒドロエピアンドロステロンである請求の範囲第 30 項記載の複合体。

32. 以下の式(IV)の複合体。

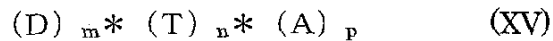


(式中の各 G' は連結基を表し、各 G'' は G' と同種または異種の連結基を表し、各 D はビタミン D 部分を表し、各 T は標的分子部分を表し、g、k、n 及び m は 1 以上の整数を表し、f 及び h は 0 以上の整数を表し、- は連結基が存在する場合には結合を示し、かつ * は各 D が、コネクタ G' または G'' により、または両方のコネクタが存在する場合にはコネクタ G' 及び G'' により各 T と会合していることを示す。)

33. 前記 G' がビオチンであり、G'' がアビジンであり、* がビオチン-アビ

ジン結合を表す請求の範囲第32項記載の複合体。

34. 以下の式(XV)の複合体。



(式中の各DはビタミンD部分を表し、各Tは標的分子部分を表し、各AはビタミンD以外の治療剤を表し、m、n及びpは1以上の整数であり、かつ*は標的分子部分がビタミンD部分及びビタミンD以外の治療剤と会合していることを示す。)

35. 前記Aが細胞障害剤または骨の治療剤である請求の範囲第34項記載の複合体。

36. 前記Tが向骨剤である請求の範囲第34項記載の複合体。

37. 骨の病気を治療するための医薬組成物であって、治療上有効な量の請求の範囲第36項記載の複合体を含む医薬組成物。

38. 前記Tが向骨剤であり、かつ前記Aが向骨剤である請求の範囲第34項記載の複合体。

39. 骨の病気を治療するための医薬組成物であって、治療上有効な量の請求の範囲第38項記載の複合体を含む医薬組成物。

40. 前記Tが癌細胞のビタミンD受容体に向かう能力を有する薬剤であり、かつ前記Aが細胞障害剤である請求の範囲第34項記載の複合体を含む抗増殖性組成物。