

【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30年2月22日 (2018.2.22)

【公表番号】特表2017-502985(P2017-502985A)

【公表日】平成29年1月26日 (2017.1.26)

【年通号数】公開・登録公報2017-004

【出願番号】特願2016-546484(P2016-546484)

【国際特許分類】

A 6 1 K 9/127 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 K 47/40 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 9/127

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 K 47/40

【手続補正書】

【提出日】平成30年1月12日 (2018.1.12)

【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】

シクロデキストリン、治療剤、およびリボソームを含むリボソーム組成物であって、前記リボソームは、イオン化可能な化学基で置き換えられている、前記リボソームの内相に向いている少なくとも 1 つのヒドロキシル化学基を有するシクロデキストリンをカプセル化しており、前記シクロデキストリンは、前記治療剤をカプセル化しており、前記シクロデキストリンの少なくとも 1 つの - D - グルコピラノシド単位が、イオン化可能な化学基で置き換えられた C 2、C 3、および C 6 ヒドロキシル化学基からなる群より選択される少なくとも 1 つのヒドロキシル化学基を有する、リボソーム組成物。

【請求項 2】

前記シクロデキストリンの少なくとも 1 つの - D - グルコピラノシド単位が、イオン化可能な化学基で置き換えられた C 2、C 3、および C 6 ヒドロキシル化学基からなる群より選択される少なくとも 2 つのヒドロキシル化学基を有し、必要に応じて、前記シクロデキストリンの少なくとも 1 つの - D - グルコピラノシド単位の前記 C 2、C 3、および C 6 ヒドロキシル化学基が、イオン化可能な化学基で置き換えられている、請求項 1 に記載のリボソーム組成物。

【請求項 3】

前記シクロデキストリンの前記少なくとも 1 つの - D - グルコピラノシド単位が、前記シクロデキストリンの 2、3、4、5、6、7、8、およびすべての - D - グルコピラノシド単位からなる群より選択される、請求項 1 に記載のリボソーム組成物。

【請求項 4】

前記イオン化可能な化学基が、すべての置き換えられた位置で同じである、請求項 1 に記載のリボソーム組成物。

【請求項 5】

前記イオン化可能な化学基が、弱塩基性官能基または弱酸性官能基であり、必要に応じて、前記弱塩基性官能基（X）が、 $\text{CH}_3 - \text{X}$ によって6.5から8.5の間の pK_a を有する、か、または前記弱酸性官能基（Y）が、 $\text{CH}_3 - \text{Y}$ によって4.0から6.5の間の pK_a を有する、請求項1に記載のリボソーム組成物。

【請求項6】

前記弱塩基性官能基または前記弱酸性官能基が、アミノ官能基、エチレンジアミノ官能基、ジメチルエチレンジアミノ官能基、ジメチルアニリノ官能基、ジメチルナフチルアミノ官能基、スクシニル官能基、カルボキシル官能基、スルホニル官能基およびスルフェート官能基からなる群より選択される、請求項5に記載のリボソーム組成物。

【請求項7】

前記シクロデキストリンが、4.0から8.5の間の pK_{a1} を有する、請求項1に記載のリボソーム組成物。

【請求項8】

液体医薬製剤または固体医薬製剤である、請求項1に記載のリボソーム組成物。

【請求項9】

前記治療剤が、中性に荷電しているか、または疎水性である、請求項1に記載のリボソーム組成物。

【請求項10】

前記治療剤が、化学療法剤または小分子である、請求項1に記載のリボソーム組成物。

【請求項11】

前記シクロデキストリンが、 α -シクロデキストリン、 β -シクロデキストリン、および γ -シクロデキストリンからなる群より選択される、請求項1に記載のリボソーム組成物。

【請求項12】

請求項1に記載のリボソーム組成物、および使用するための指示書を含むキット。

【請求項13】

がんを有する被験体を処置する方法において使用するためのリボソーム組成物であって、治療有効量の請求項1に記載のリボソーム組成物を含む、リボソーム組成物。

【請求項14】

前記治療剤が、化学療法剤である、請求項13に記載の使用のためのリボソーム組成物。

【請求項15】

前記リボソーム組成物が、皮下または静脈内の注射によって投与される、請求項13に記載の使用のためのリボソーム組成物。

【請求項16】

前記被験体が、哺乳動物であり、必要に応じてヒトである、請求項13に記載の使用のためのリボソーム組成物。

【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】

さらに別の態様では、がんを有する被験体を処置する方法であって、治療有効量の本明細書に記載されているリボソーム組成物を被験体に投与することを含む、方法を提供する。一実施形態では、治療剤は、化学療法剤である。別の実施形態では、リボソーム組成物は、注射によって皮下または静脈内に投与される。さらに別の実施形態では、被験体は、哺乳動物である。さらに別の実施形態では、哺乳動物は、ヒトである。

本発明は、例えば、以下の項目を提供する。

(項目1)

シクロデキストリン、治療剤、およびリボソームを含むリボソーム組成物であって、前記リボソームは、イオン化可能な化学基で置き換えられている、前記リボソームの内相に向いている少なくとも1つのヒドロキシル化学基を有するシクロデキストリンをカプセル化しており、前記シクロデキストリンは、前記治療剤をカプセル化している、リボソーム組成物。

(項目2)

前記シクロデキストリンの少なくとも1つの - D - グルコピラノシド単位が、イオン化可能な化学基で置き換えられた C 2、C 3、および C 6 ヒドロキシル化学基からなる群より選択される少なくとも1つのヒドロキシル化学基を有する、項目1に記載のリボソーム組成物。

(項目3)

前記シクロデキストリンの少なくとも1つの - D - グルコピラノシド単位が、イオン化可能な化学基で置き換えられた C 2、C 3、および C 6 ヒドロキシル化学基からなる群より選択される少なくとも2つのヒドロキシル化学基を有する、項目2に記載のリボソーム組成物。

(項目4)

前記シクロデキストリンの少なくとも1つの - D - グルコピラノシド単位の前記 C 2、C 3、および C 6 ヒドロキシル化学基が、イオン化可能な化学基で置き換えられている、項目3に記載のリボソーム組成物。

(項目5)

前記シクロデキストリンの前記少なくとも1つの - D - グルコピラノシド単位が、前記シクロデキストリンの 2、3、4、5、6、7、8、およびすべての - D - グルコピラノシド単位からなる群より選択される、項目1から4のいずれか一項に記載のリボソーム組成物。

(項目6)

前記イオン化可能な化学基が、すべての置き換えられた位置で同じである、項目1から5のいずれか一項に記載のリボソーム組成物。

(項目7)

前記イオン化可能な化学基が、弱塩基性官能基または弱酸性官能基である、項目1から6のいずれか一項に記載のリボソーム組成物。

(項目8)

前記弱塩基性官能基 (X) が、CH₃ - X によって 6.5 から 8.5 の間の pK_a を有する、項目7に記載のリボソーム組成物。

(項目9)

前記弱酸性官能基 (Y) が、CH₃ - Y によって 4.0 から 6.5 の間の pK_a を有する、項目7に記載のリボソーム組成物。

(項目10)

前記弱塩基性官能基または前記弱酸性官能基が、アミノ官能基、エチレンジアミノ官能基、ジメチルエチレンジアミノ官能基、ジメチルアニリノ官能基、ジメチルナフチルアミノ官能基、スクシニル官能基、カルボキシル官能基、スルホニル官能基およびスルフェート官能基からなる群より選択される、項目7に記載のリボソーム組成物。

(項目11)

前記シクロデキストリンが、4.0 から 8.5 の間の pK_{a,1} を有する、項目1から10のいずれか一項に記載のリボソーム組成物。

(項目12)

液体医薬製剤または固体医薬製剤である、項目1から11のいずれか一項に記載のリボソーム組成物。

(項目13)

前記治療剤が、中性に荷電しているか、または疎水性である、項目 1 から 1 2 のいずれか一項に記載のリボソーム組成物。

(項目 1 4)

前記治療剤が、化学療法剤である、項目 1 から 1 3 のいずれか一項に記載のリボソーム組成物。

(項目 1 5)

前記治療剤が、小分子である、項目 1 から 1 4 のいずれか一項に記載のリボソーム組成物。

(項目 1 6)

前記シクロデキストリンが、 α -シクロデキストリン、 β -シクロデキストリン、および γ -シクロデキストリンからなる群より選択される、項目 1 から 1 5 のいずれか一項に記載のリボソーム組成物。

(項目 1 7)

前記シクロデキストリンが、 α -シクロデキストリン、 β -シクロデキストリンである、項目 1 6 に記載のリボソーム組成物。

(項目 1 8)

項目 1 から 1 7 のいずれか一項に記載のリボソーム組成物、および使用するための指示書を含むキット。

(項目 1 9)

がんを有する被験体を処置する方法であって、前記被験体に治療有効量の項目 1 から 1 7 のいずれか一項に記載のリボソーム組成物を投与することを含む、方法。

(項目 2 0)

前記治療剤が、化学療法剤である、項目 1 9 に記載の方法。

(項目 2 1)

前記リボソーム組成物が、皮下または静脈内の注射によって投与される、項目 1 9 に記載の方法。

(項目 2 2)

前記被験体が、哺乳動物である、項目 1 9 に記載の方法。

(項目 2 3)

前記哺乳動物が、ヒトである、項目 2 0 に記載の方法。