

【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2年6月25日(2020.6.25)

【公表番号】特表2019-523757(P2019-523757A)

【公表日】令和1年8月29日(2019.8.29)

【年通号数】公開・登録公報2019-035

【出願番号】特願2018-561060(P2018-561060)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/7048 (2006.01)  
A 6 1 K 31/136 (2006.01)  
A 6 1 K 47/54 (2017.01)  
A 6 1 K 47/28 (2006.01)  
A 6 1 K 47/12 (2006.01)  
A 6 1 K 47/24 (2006.01)  
A 6 1 P 35/00 (2006.01)  
A 6 1 P 35/02 (2006.01)  
A 6 1 K 31/337 (2006.01)  
A 6 1 K 31/4365 (2006.01)  
A 6 1 K 31/4188 (2006.01)  
A 6 1 K 31/357 (2006.01)  
A 6 1 K 31/4745 (2006.01)  
A 6 1 K 31/704 (2006.01)  
A 6 1 K 31/475 (2006.01)  
A 6 1 K 31/7068 (2006.01)  
A 6 1 K 9/16 (2006.01)  
A 6 1 P 43/00 (2006.01)  
A 6 1 K 45/00 (2006.01)  
A 6 1 K 31/282 (2006.01)  
A 6 1 K 31/7076 (2006.01)  
A 6 1 K 39/395 (2006.01)  
A 6 1 K 38/19 (2006.01)  
A 6 1 K 38/20 (2006.01)  
A 6 1 K 38/21 (2006.01)  
A 6 1 P 35/04 (2006.01)  
A 6 1 K 47/02 (2006.01)  
A 6 1 K 31/713 (2006.01)  
A 6 1 K 31/7105 (2006.01)  
B 8 2 Y 5/00 (2011.01)  
B 8 2 Y 20/00 (2011.01)

【F I】

A 6 1 K 31/7048  
A 6 1 K 31/136  
A 6 1 K 47/54  
A 6 1 K 47/28  
A 6 1 K 47/12  
A 6 1 K 47/24  
A 6 1 P 35/00  
A 6 1 P 35/02  
A 6 1 K 31/337

A 6 1 K	31/4365	
A 6 1 K	31/4188	
A 6 1 K	31/357	
A 6 1 K	31/4745	
A 6 1 K	31/704	
A 6 1 K	31/475	
A 6 1 K	31/7068	
A 6 1 K	9/16	
A 6 1 P	43/00	1 2 1
A 6 1 K	45/00	
A 6 1 K	31/282	
A 6 1 K	31/7076	
A 6 1 K	39/395	D
A 6 1 K	39/395	N
A 6 1 K	38/19	
A 6 1 K	38/20	
A 6 1 K	38/21	
A 6 1 P	35/04	
A 6 1 K	47/02	
A 6 1 K	31/713	
A 6 1 K	31/7105	
B 8 2 Y	5/00	
B 8 2 Y	20/00	

**【手続補正書】****【提出日】**令和2年5月15日(2020.5.15)**【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】**

(a) 一価薬物部分、

(b) 一価脂質部分、及び

(c) 生分解性結合を含む二価リンカー部分、

から成り、該一価薬物部分と該一価脂質部分とが該リンカー部分を介して結合し、該生分解性結合がジスルフィド結合であり、該一価脂質部分が、コレステロール、オレイン酸、リゾ脂質又はホスホコリンの一価誘導体である、プロドラッグ。

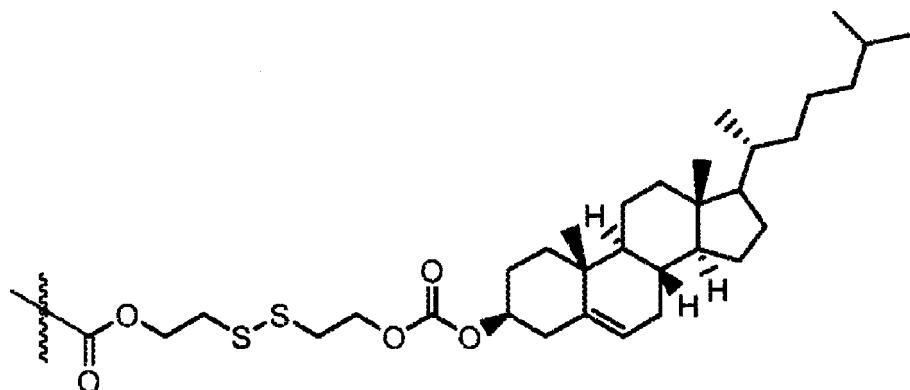
**【請求項2】**

前記一価薬物部分が抗癌剤化合物の一価誘導体である、請求項1に記載のプロドラッグ。

**【請求項3】**

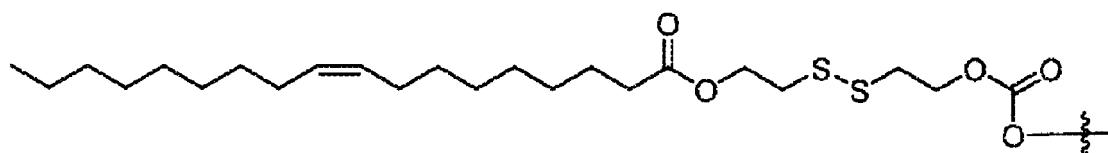
(i) 前記一価脂質部分がコレステロール誘導体であり、前記一価脂質部分と前記二価リンカー部分とが一緒になって下記の構造を有する、又は

【化1】



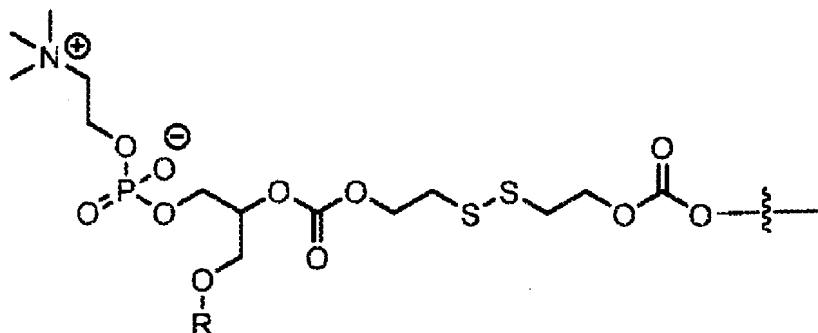
(ii) 前記一価脂質部分がオレイン酸誘導体であり、前記一価脂質部分と前記二価リンカー部分とが一緒になって下記の構造を有する、又は

【化2】



(iii) 前記一価脂質部分がリゾ脂質誘導体であり、前記一価脂質部分と前記二価リンカー部分とが一緒になって下記の構造を有する、又は

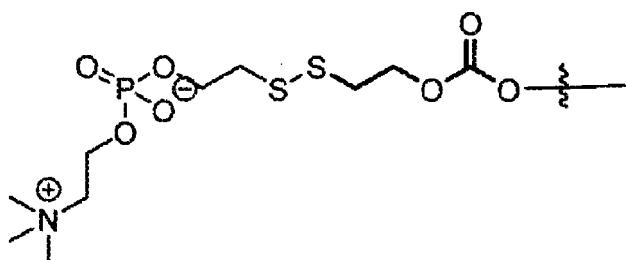
【化3】



(式中、Rは、オレイル、ステアリル又はパルミトレイルから選択される。)

(iv) 前記一価脂質部分がホスホコリン誘導体であり、前記一価脂質部分と前記二価リンカー部分とが一緒になって下記の構造を有する、請求項1又は2に記載のプロドラッグ。

【化4】



【請求項4】

治療を必要とする患者の癌を治療する方法に使用するための組成物であって、該組成物が、請求項1～3のいずれか一項に記載のプロドラッグを含むナノ粒子及び免疫療法剤を含

み、該ナノ粒子がナノスケール配位ポリマーを含む、組成物。

【請求項 5】

前記免疫療法剤が、抗CD52抗体、抗CD20抗体、抗CD47抗体、抗GD2抗体、多糖類K及びサイトカインから成る群から選択される、請求項4に記載の組成物。

【請求項 6】

ピロリン酸亜鉛及び請求項1～3のいずれか一項に記載のプロドラッグを含む組成物であって、該ピロリン酸亜鉛が、ナノ粒子の形態である、組成物。

【請求項 7】

請求項1～3のいずれか一項に記載のプロドラッグ並びにシスプラチン及び/又はオキサリプラチンのプロドラッグを含むナノスケール配位ポリマーを含み、更に、siRNAを含む、組成物。

【請求項 8】

(a) 金属-有機マトリックス材料を含むコア、及び(b) 請求項1～3のいずれか一項に記載のプロドラッグを含み、更に、少なくとも1つの核酸化学療法剤を含む、治療薬を送達するためのナノスケール粒子。

【請求項 9】

前記少なくとも1つの核酸化学療法剤が、該核酸上のリン酸基と前記コアの外表面上の金属イオンとの間の配位結合を介して、前記金属-有機マトリックス材料のコアに結合している、請求項8に記載のナノスケール粒子。

【請求項 10】

前記ナノスケール粒子が、更に、金属-有機マトリックス材料コアの外表面の少なくとも一部を覆う1又はそれ以上のコーティング剤又はコーティング層を含み、該1又はそれ以上のコーティング剤又はコーティング層が、金属酸化物、ポリマー、単一脂質層、脂質二重層、及びそれらの組み合わせから選択される、請求項8又は9に記載のナノスケール粒子。

【請求項 11】

前記金属-有機マトリックス材料コアが、多価金属イオン及びビスホスホネートから成る金属ビスホスホネート配位ポリマーを含み、該金属-有機マトリックス材料コアが、ビスホスホネートを40～50重量%含む、請求項8～10のいずれか一項に記載のナノスケール粒子。

【請求項 12】

治療を必要とする患者の癌を治療する方法に使用するための組成物であって、該組成物が、請求項6又は7に記載の組成物、又は請求項8～11のいずれか一項に記載のナノスケール粒子を含む組成物である、組成物。

【請求項 13】

更に、免疫療法剤を含む、請求項12に記載の組成物。

【請求項 14】

前記免疫療法剤が、抗CD52抗体、抗CD20抗体、抗CD47抗体、抗GD2抗体、多糖類K及びサイトカインから成る群から選択される、請求項13に記載の組成物。

【請求項 15】

請求項6又は7に記載の組成物又は請求項8～11のいずれか一項に記載のナノスケール粒子を含む組成物、及び医薬的に許容される担体を含む、癌治療用の医薬配合物。