

(12) 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2015 年 4 月 9 日(09.04.2015)



(10) 国際公開番号
WO 2015/049883 A1

- (51) 国際特許分類:
A61K 31/4745 (2006.01) *A61P 35/00* (2006.01)
A61K 47/48 (2006.01)
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2014/052877
- (22) 国際出願日: 2014 年 2 月 7 日(07.02.2014)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:
特願 2013-209574 2013 年 10 月 4 日(04.10.2013) JP
特願 2013-237219 2013 年 11 月 15 日(15.11.2013) JP
- (71) 出願人: **Delta-Fly Pharma 株式会社 (DELTA-FLY PHARMA, INC.)** [JP/JP]; 〒7710116 徳島県徳島市川内町宮島錦野 3 7 番地の 2 Tokushima (JP).
- (72) 発明者: **チェン ヒー ジン (CHENG, He Jin)**; 92130 カリフォルニア州サンディエゴ トレイヒル レーン 3 7 6 0 California (US). **福島正和 (FUKUSHIMA Masakazu)**; 〒5200863 滋賀県大津市千町二丁目 9 番 7 号 Shiga (JP). **江島 清 (ESHIMA Kiyoshi)**; 〒7710116 徳島県徳島市川内町宮島錦野 3 7 番地の 2 Tokushima (JP). **アシュ**

レー ギャリー (ASHLEY, Gary); 94502 カリフォルニア州アラメダ ベルデマール 1 1 0 2 California (US). **サンティ ダニエル ブイ (SANTI, Daniel V.)**; 94117 カリフォルニア州サンフランシスコ ベルグレイブ 2 1 7 California (US).

(74) 代理人: 平木 祐輔, 外 (HIRAKI Yusuke et al.); 〒1056232 東京都港区愛宕 2 丁目 5 番 1 号 愛宕グリーンヒルズ MORI タワー 3 2 階 Tokyo (JP).

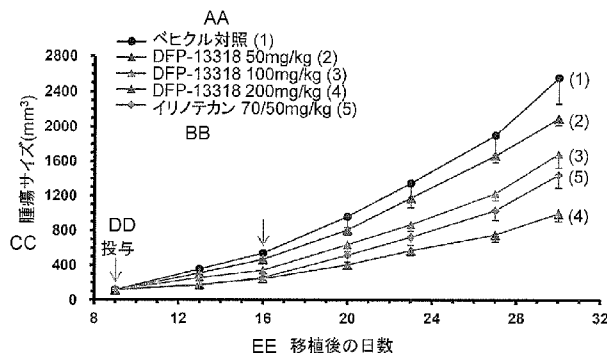
(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BN, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CL, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IR, IS, KE, KG, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PA, PE, PG, PH, PL, PT, QA, RO, RS, RU, RW, SA, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TH, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LR, LS, MW, MZ, NA, RW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーロシ
ア (AM, AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), ヨーロッパ

[続葉有]

(54) Title: ANTICANCER AGENT FREE OF ADVERSE REACTIONS

(54) 発明の名称: 副作用のない抗癌剤



AA Vehicle control (1)
BB Irinotecan 70/50 mg/kg (5)
CC Tumor size (mm³)
DD Administration
EE Number of days after transplant

(57) Abstract: The present invention provides a pharmaceutical composition for treating cancer, the composition comprising as the active ingredient a compound represented by general formula I: C-[-CH₂-O-(-CH₂CH₂-O)-X¹-CHR¹-O-CO-NR²-CH₂-X²]_n (I) (where X¹-CHR¹-O-CO-NR² is a linker, X¹ is a spacer, R¹ is an optionally substituted C₁₋₄ alkyl, R² is a phenyl or substituted phenyl group, X² is SN-38, and n is an integer of 200 to 1,000). The composition is characterized by the following: that the composition can be used in a subject having cancer at a dosage regimen that calls for parenteral administration of a single dose of approximately 0.01 to 11 μmol/kg body weight at a frequency of once a week every other week for at least two administrations; and that the composition does not have irinotecan-like adverse reactions but does impart the same or better cancer proliferation-inhibiting activity as irinotecan at a dose that is 1/10 (molar ratio) or less that of irinotecan. Also provided is a method for treating cancer.

(57) 要約:

[続葉有]

WO 2015/049883 A1



(AL, AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MK, MT, NL, NO, PL, PT, RO, RS, SE, SI, SK, SM, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, KM, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告 (条約第 21 条(3))

この発明は、下記の式 I: $C-[-CH_2-O-(-CH_2CH_2-O-)_n-X^1-CHR^1-O-CO-NR^2-CH_2-X^2]_4$ (I) (式中、 $X^1-CHR^1-O-CO-NR^2$ はリンカーであり、 X^1 は、スペーサーであり、 R^1 は、置換されていてもよい炭素数 1~4 個のアルキルであり、 R^2 は、フェニル基若しくは置換フェニル基であり、 X^2 は、SN-38 であり、並びに、 n は、200~1,000 の整数である。)によって表される化合物を有効成分として含む癌治療用医薬組成物であって、癌をもつ被験体に対し、約 $0.01\mu\text{mol/kg}$ 体重~約 $11\mu\text{mol/kg}$ 体重の単回用量で 1 週間に 1 回の頻度で、1 週おきに少なくとも 2 週にわたり非経口投与する用法及び用量で使用することが可能であること、並びに、イリノテカンの 1/10 (モル比) 以下の用量でイリノテカン様の副作用がなく、かつ、イリノテカンと同程度又はそれ以上の癌増殖抑制活性を付与することを特徴とする組成物、並びに、癌の治療方法を提供する。