

【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3区分

【発行日】平成30年7月19日(2018.7.19)

【公表番号】特表2017-526753(P2017-526753A)

【公表日】平成29年9月14日(2017.9.14)

【年通号数】公開・登録公報2017-035

【出願番号】特願2016-571093(P2016-571093)

【国際特許分類】

C 08 F	293/00	(2006.01)
G 01 N	21/80	(2006.01)
G 01 N	21/78	(2006.01)
G 01 N	21/64	(2006.01)
A 61 B	10/00	(2006.01)
A 61 K	51/06	(2006.01)
A 61 K	51/12	(2006.01)
A 61 K	50/00	(2006.01)
C 12 Q	1/02	(2006.01)
C 08 F	220/34	(2006.01)
C 08 F	8/30	(2006.01)
C 07 C	69/54	(2006.01)
C 09 K	11/06	(2006.01)

【F I】

C 08 F	293/00	
G 01 N	21/80	
G 01 N	21/78	C
G 01 N	21/64	C
G 01 N	21/64	F
A 61 B	10/00	E
A 61 K	51/06	2 0 0
A 61 K	51/12	2 0 0
A 61 K	50/00	2 0 0
C 12 Q	1/02	
C 08 F	220/34	
C 08 F	8/30	
C 07 C	69/54	C S P Z
C 09 K	11/06	

【手続補正書】

【提出日】平成30年6月1日(2018.6.1)

【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

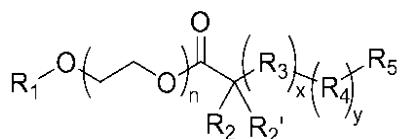
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式：

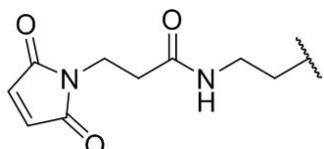
【化1】

(V)

のポリマーであって、

式(V)において、R₁は、水素、アルキル(_C₁₂)、シクロアルキル(_C₁₂)、置換アルキル(_C₁₂)、置換シクロアルキル(_C₁₂)、または

【化2】

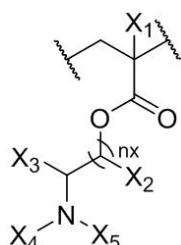


或いは金属キレート基であり；

nは1～500の整数であり；

R₂及びR_{2'}は、それぞれ独立して、水素、アルキル(_C₁₂)、シクロアルキル(_C₁₂)、置換アルキル(_C₁₂)、または置換シクロアルキル(_C₁₂)から選択され；R₃は、式：

【化3】

(II)

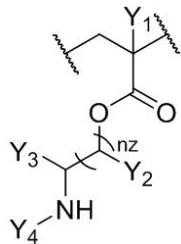
の基であり、

式(II)において、n_xは1～10であり；X₁、X₂、及びX₃は、それぞれ独立して、水素、アルキル(_C₁₂)、シクロアルキル(_C₁₂)、置換アルキル(_C₁₂)、または置換シクロアルキル(_C₁₂)から選択され；X₄はペンチル、n-プロピル、またはエチルであり；X₅はペンチルまたはn-プロピルであり；

xは1～100の整数であり；

R₄は、式：

【化4】

(IV)

の基であり、

式(I V)において、

Y_1 、 Y_2 、及び Y_3 は、それぞれ独立して、水素、アルキル(C_{1-2})、シクロアルキル(C_{1-2})、置換アルキル(C_{1-2})、または置換シクロアルキル(C_{1-2})から選択され；

Y_4 は、水素、アルキル(C_{1-2})、アシル(C_{1-2})、置換アルキル(C_{1-2})、置換アシル(C_{1-2})、色素、または蛍光消光剤であり；そして y は1～6の整数であり；そして

R_5 は、水素、ハロ、ヒドロキシ、アルキル(C_{1-2})、または置換アルキル(C_{1-2})である、ポリマー。

【請求項2】

Y_4 が蛍光色素である請求項1に記載のポリマー。

【請求項3】

前記蛍光色素が、インドシアニングリーンである請求項2に記載のポリマー。

【請求項4】

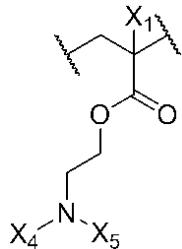
R_1 はアルキル(C_{1-2})である請求項1に記載のポリマー。

【請求項5】

R_2 及び R_3 は、それぞれアルキル(C_{1-2})である請求項1に記載のポリマー。

【請求項6】

R_3 は
【化5】



である請求項1に記載のポリマー。

【請求項7】

X_4 及び X_5 は、それぞれペンチルである請求項6に記載のポリマー。

【請求項8】

X_4 及び X_5 は、それぞれn-プロピルである請求項6に記載のポリマー。

【請求項9】

X_4 はエチルであり、 X_5 はn-プロピルである請求項6に記載のポリマー。

【請求項10】

前記ポリマーが、PEO₁₋₁₄-P(D5A₈₋₀)、PEO₁₋₁₄-P(D5A₁₋₀₀)、PEO₁₋₁₄-P(DPA₈₋₀)、PEO₁₋₁₄-P(DPA₁₋₀₀)、PEO₁₋₁₄-P(EPA₈₋₀)及びPEO₁₋₁₄-P(EPA₁₋₀₀)である請求項1に記載のポリマー。

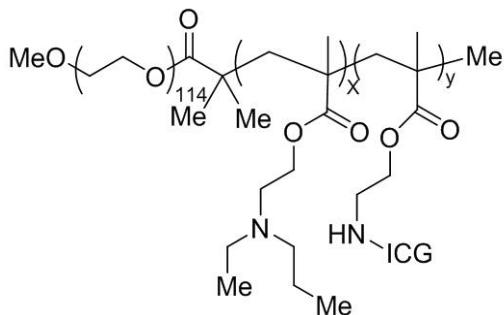
【請求項11】

前記ポリマーが、PEO₁₋₁₄-P(EPA₄₋₀-r-ICG₁)、PEO₁₋₁₄-P(EPA₆₋₀-r-ICG₁)、PEO₁₋₁₄-P(EPA₈₋₀-r-ICG₁)、またはPEO₁₋₁₄-P(EPA₁₋₀₀-r-ICG₁)である請求項1に記載のポリマー。

【請求項12】

式：

【化6】



のポリマーであって、

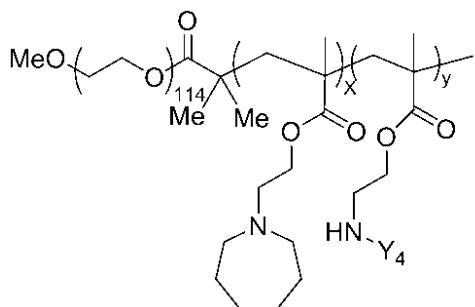
上式において、

xが30～150の整数であり、yが1または2の整数であり；x及びyが当該ポリマー全域にランダムに分布し；そしてICGが蛍光色素インドシアニングリーンである、ポリマー。

【請求項13】

式：

【化7】



のポリマーであって、

上式において、

xが40～120の整数であり、yが1、2または3の整数であり；Y4が蛍光色素インドシアニングリーンである、ポリマー。

【請求項14】

前記ポリマーが、PEO₁₁₄-P(C₇A₄₀-r-ICG₃)、PEO₁₁₄-P(C₇A₆₀-r-ICG₃)、PEO₁₁₄-P(C₇A₈₀-r-ICG₃)、PEO₁₁₄-P(C₇A₁₀₀-r-ICG₃)、またはPEO₁₁₄-P(C₇A₁₂₀-r-ICG₃)である請求項13に記載のポリマー。

【請求項15】

請求項1～14のいずれか1項に記載の1種以上のブロックコポリマーを含むミセル。

【請求項16】

請求項15に記載のミセルを含むpH応答性組成物であって、Y₄が色素であり、ミセルがpH転移点及び発光スペクトルを有する、pH応答性組成物。

【請求項17】

(a) 請求項16のpH応答性組成物を細胞内または細胞外の環境と接触させる工程、
(b) 細胞内または細胞外の環境からの1つ以上の光シグナルを検知する工程であって、その光シグナルの検知が、ミセルがそのpH転移点に到達し、解離したことを示す、工程、を含む細胞内または細胞外の環境のpHをイメージングする方法における使用のための、請求項16に記載のpH応答性組成物。

【請求項18】

細胞内の環境は細胞の一部である請求項17に記載のpH応答性組成物。

【請求項19】

細胞外の環境が腫瘍または血管細胞である請求項17に記載のpH応答性組成物。

【請求項20】

(a) 請求項16に記載のpH応答性組成物を有効量で患者に投与する工程；

(b) 患者の1つ以上の光シグナルを検知する工程であって、その光シグナルは腫瘍の存在を示す、工程；及び

(c) 腫瘍を手術により切除する工程、を含む患者の腫瘍を切除する方法における使用のための、請求項16に記載のpH応答性組成物。

【請求項21】

前記腫瘍が、がんによるものであり、前記がんが、乳がん、頭頸部がん、または結腸直腸の腹膜転移である請求項16に記載のpH応答性組成物。