

【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19年2月22日(2007.2.22)

【公表番号】特表2006-519766(P2006-519766A)

【公表日】平成18年8月31日(2006.8.31)

【年通号数】公開・登録公報2006-034

【出願番号】特願2005-508639(P2005-508639)

【国際特許分類】

A 6 1 K	47/48	(2006.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 K	47/30	(2006.01)
A 6 1 K	31/337	(2006.01)
A 6 1 K	31/475	(2006.01)
A 6 1 K	31/136	(2006.01)
A 6 1 K	31/7048	(2006.01)
A 6 1 K	31/513	(2006.01)
A 6 1 K	31/704	(2006.01)
A 6 1 K	31/519	(2006.01)
A 6 1 K	31/407	(2006.01)
A 6 1 K	38/04	(2006.01)
A 6 1 K	38/22	(2006.01)
A 6 1 K	47/04	(2006.01)
A 6 1 K	47/42	(2006.01)
A 6 1 K	47/16	(2006.01)
A 6 1 K	47/36	(2006.01)
A 6 1 K	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/02	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	37/08	(2006.01)
A 6 1 P	9/14	(2006.01)
A 6 1 P	39/06	(2006.01)
A 6 1 P	41/00	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	37/00	(2006.01)
A 6 1 M	37/00	(2006.01)
A 6 1 F	2/84	(2006.01)
C 08 G	65/32	(2006.01)
A 6 1 M	25/00	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	47/48
A 6 1 K	45/00
A 6 1 K	47/30
A 6 1 K	31/337
A 6 1 K	31/475
A 6 1 K	31/136
A 6 1 K	31/7048
A 6 1 K	31/513
A 6 1 K	31/704

A 6 1 K	31/519
A 6 1 K	31/407
A 6 1 K	37/43
A 6 1 K	37/24
A 6 1 K	47/04
A 6 1 K	47/42
A 6 1 K	47/16
A 6 1 K	47/36
A 6 1 K	9/10
A 6 1 P	35/00
A 6 1 P	35/02
A 6 1 P	29/00
A 6 1 P	37/08
A 6 1 P	9/14
A 6 1 P	39/06
A 6 1 P	41/00
A 6 1 P	43/00 1 0 5
A 6 1 P	43/00 1 1 1
A 6 1 P	37/00
A 6 1 M	37/00
A 6 1 M	29/02
C 0 8 G	65/32
A 6 1 M	25/00 3 0 4

【手続補正書】**【提出日】**平成18年12月27日(2006.12.27)**【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】**

合成ポリマーおよび薬物を含む組成物であって、ポリマーが複数の活性基を含み、活性基が求電子性部位を有し、ここで薬物が、タキサン、代謝拮抗物質、アルキル化剤、ビンカアルカルイド、カンプトテシンまたはその類似体もしくは誘導体、ミトキサントロン、エトポシド、5-フルオロウラシル、ドキソルビシン、メトトレキサート、マイトマイシン-C、およびCDK-2阻害剤から選択される細胞周期阻害剤である組成物。

【請求項2】

合成ポリマーが結合基Qをさらに含み、式(ポリマー骨格)-(Q-Y)_nにより表すことができ、式中、Yは活性基を表し、nは1より大きな整数である、請求項1記載の組成物。

【請求項3】

合成ポリマーが生物分解可能な基であるDをさらに含み、式(ポリマー骨格)-(D-Q-Y)_nにより表される、請求項2記載の組成物。

【請求項4】

Dがラクチド、グリコリド、-カプロラクトンおよびポリ(-ヒドロキシ酸)、ポリ(アミノ酸)、ポリ(無水物)、またはポリ(オルトエステル)である、請求項3記載の組成物。

【請求項5】

Qが、-G-(CH₂)_n- (式中、GはO、S、NH、-O-CO-および-O-CO-NH-(CH₂)_nより選択される) ; O₂C-CR¹H- (式中、R¹は水素およびアルキルより選択される) ; ならびにO-R²-CO-NH(

式中、R²はCH₂およびCO-NH-CH₂CH₂より選択される)である、請求項3記載の組成物。

【請求項6】

活性基がタンパク質に反応性である、請求項1記載の組成物。

【請求項7】

活性基がヒドロキシル基、アミノ基、またはチオール基に反応性である、請求項6記載の組成物。

【請求項8】

求電子性部位がカルボニル基である、請求項1記載の組成物。

【請求項9】

活性基が脱離基をさらに含む、請求項1記載の組成物。

【請求項10】

脱離基がN-オキシスクシンイミドまたはN-オキシマレイミドである、請求項9記載の組成物。

【請求項11】

ポリマーが2~12個の活性基を有する、請求項1記載の組成物。

【請求項12】

合成ポリマーが環状コアを有する、請求項1記載の組成物。

【請求項13】

環状コアが6員炭素環式基、イノシトール残基、ラクチトール残基、またはソルビトル残基を含む、請求項12記載の組成物。

【請求項14】

合成ポリマーが分枝鎖コアを有する、請求項1記載の組成物。

【請求項15】

分枝鎖コアが多価化合物残基、グリセロール残基、ペンタエリスリトール残基、ジグリセロール残基、ポリ(カルボン酸)化合物残基、ポリアミン化合物残基、またはポリアミノ酸である、請求項14記載の組成物。

【請求項16】

合成ポリマーがポリ(アルキレン)オキシドを含む、請求項1、2、または3記載の組成物。

。

【請求項17】

ポリ(アルキレン)オキシドがエチレンオキシド残基またはプロピレンオキシド残基を含む、請求項16記載の組成物。

【請求項18】

複数の活性基を有する第1のポリマーおよび第2の合成ポリマーを含む組成物であって、第1のポリマーおよび第2のポリマーが同一でない、請求項1記載の組成物。

【請求項19】

合成ポリマーが組成物の重量の0.5から40%に寄与する、請求項1記載の組成物。

【請求項20】

組成物のpHを4から10の範囲内に維持する緩衝剤をさらに含む、請求項1記載の組成物。

【請求項21】

コラーゲンをさらに含む、請求項1記載の組成物。

【請求項22】

薬物がパクリタキセルである、請求項1記載の組成物。

【請求項23】

以下の段階を含む、組織の治療方法に使用するための組成物:

(a)官能基Xを含むインビボ生体組織を選択する段階;

(b)合成ポリマーおよび薬物を含む組成物を供給する段階であって、ポリマーが複数の活性基Yを含み、ここでYはXに反応性である、段階;

(c) (i)XがYと反応し、かつ(ii)組織の近傍の生物学的プロセスが薬物によって影響される条件下で、段階(a)の組織を段階(b)の組成物と接触させる段階。

【請求項 2 4】

以下の段階を含む、合成ポリマーを調製するための方法：

(a)複数の活性基を含む合成ポリマーを供給する段階；

(b)合成ポリマーを6未満のpHを有する緩衝剤と合わせて、均質な溶液を形成する段階；

(c)均質な溶液のpHを約7.8よりも高いpHまで上昇させ、それによって合成ポリマーを反応性にする段階。

【請求項 2 5】

合成ポリマーが、細胞分裂、細胞分泌、細胞移動、細胞接着、炎症性活性化因子の産生および/または放出、血管形成、ならびにフリーラジカルの形成および/または放出からなる群より選択される細胞活性の1つまたは組み合わせの阻害に有効である薬物と合わせられる、請求項32記載の方法。

【請求項 2 6】

以下を含む組成物：

各活性基がヒドロキシ基、アミノ基、またはチオール基に反応性である複数の活性基を含む、合成ポリマー；

疎水性薬物；および

薬物を取り込む第2の担体。

【請求項 2 7】

組成物が6未満のpHを有する均質な溶液である、水性緩衝剤をさらに含む請求項26記載の組成物。

【請求項 2 8】

第2の担体が水性緩衝剤中に分散される、請求項27記載の組成物。

【請求項 2 9】

第2の担体がミセルまたはナノスフェアの形態である、請求項26に記載の組成物。

【請求項 3 0】

合成ポリマーがアルキレンオキシド残基を含む、請求項26に記載の組成物。

【請求項 3 1】

各活性基がチオール反応性基である、請求項26記載の組成物。

【請求項 3 2】

チオール反応性基がN-オキシスクシンイミジル基を含む、請求項31に記載の組成物。

【請求項 3 3】

合成ポリマーが4アームポリエチレングリコール(PEG)である、請求項26に記載の組成物。

。

【請求項 3 4】

疎水性薬物が、タキサン、代謝拮抗物質、アルキル化剤、ビンカアルカロイド、カンプトテシンまたはその類似体もしくは誘導体、ミトキサントロン、エトポシド、5-フルオロウラシル、ドキソルビシン、メトトレキサート、マイトマイシン-C、およびCDK-2阻害剤から選択される細胞周期阻害剤である、請求項26記載の組成物。

【請求項 3 5】

疎水性薬物がパクリタキセルである、請求項34記載の組成物。