

【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24年3月8日(2012.3.8)

【公表番号】特表2011-518868(P2011-518868A)
 【公表日】平成23年6月30日(2011.6.30)
 【年通号数】公開・登録公報2011-026
 【出願番号】特願2011-506742(P2011-506742)
 【国際特許分類】

A 6 1 K 9/107 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 9/107

【手続補正書】

【提出日】平成24年1月20日(2012.1.20)

【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】

それぞれ一つまたは二つの重合可能な、ジアセチレン、ビニル、アクリレートまたはスチレン型の部分を含む1もしくは2本の脂質鎖を有し、極性を有する頭部に結合された両親媒性分子から出発して得られる、重合させた両親媒性分子を含むことを特徴とする、重合ミセル。

【請求項2】

一般式：A - X - B - L - Z

[式中、

Aは、 $\text{CH}_3 - (\text{CH}_2)_m - \text{C} \quad \text{C} - \text{C} \quad \text{C} - (\text{CH}_2)_n -$ 、 $\text{CH}_2 = \text{CH} -$ または $\text{CH}_2 = \text{CH} - \text{C}_6\text{H}_4 -$ を表し、nおよびmは、同じであるか、または異なってもよく、1～16の整数であり；

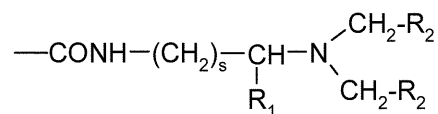
Xは、 $\text{CO} - \text{NH}$ もしくは $\text{NH} - \text{CO}$ または結合を表し、Bが結合であり、Lが結合であるならば、Xは、結合であり；

Bは、 $-(\text{CH}_2)_m - \text{C} \quad \text{C} - \text{C} \quad \text{C} - (\text{CH}_2)_n -$ もしくは $-\text{CH} = \text{CH} - \text{C}_6\text{H}_4 -$ または結合を表し、nおよびmは、同じであるか、または異なってもよく、1～16の整数であり；

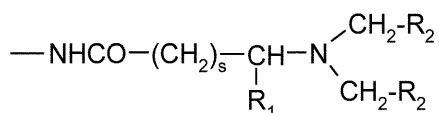
Lは、 $-(\text{CH}_2)_r - \text{CH}[\text{NH} - \text{CO} - \text{A}'] -$ または結合を表し、rは、1～16の整数であり、A'は、Aを表し；

Zは、

【化15】



または



を表し、 s は、1 ~ 16 の整数であり、 R_2 は、 COOH 、 SO_3H 、 OSO_3H 、 OPO_3H_2 または OPO_2H_2 を表し、 R_1 は、 H または基 COOH 、 SO_3H 、 OSO_3H 、 OPO_3H_2 もしくは OPO_2H_2 または基 $-\text{CO}-\text{NH}-(\text{CH}_2)_t-\text{CH}_3$ を表し、 t は、1 ~ 16 の整数であるか、あるいは

Z は、糖または多糖類型の中性で親水性の、極性を有する頭部であってもよい] で示される両親媒性分子から出発して得られる、重合させた両親媒性分子を含むことを特徴とする、請求項 1 記載の重合ミセル、および薬学的に許容され得る酸または塩基とのその付加塩。

【請求項 3】

一般式： $\text{A}-\text{X}-\text{B}-\text{L}-\text{Z}$

[式中、

A は、 $\text{CH}_3-(\text{CH}_2)_m-\text{C}-\text{C}-\text{C}-(\text{CH}_2)_n-$ を表し、 n および m は、同じであるか、または異なってもよく、1 ~ 16 の整数であり；

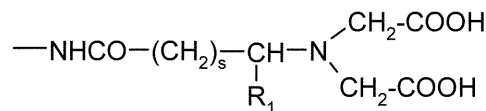
X は、 $\text{CO}-\text{NH}$ もしくは $\text{NH}-\text{CO}$ または結合を表し、 B が結合であり、 L が結合であるならば、 X は、結合であり；

B は、 $-(\text{CH}_2)_m-\text{C}-\text{C}-\text{C}-(\text{CH}_2)_n-$ または結合を表し、 n および m は、同じであるか、または異なってもよく、1 ~ 16 の整数であり；

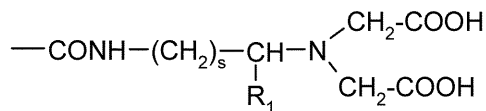
L は、 $-(\text{CH}_2)_r-\text{CH}[\text{NH}-\text{CO}-\text{A}']-$ または結合を表し、 r は、1 ~ 16 の整数であり、 A' は、 A または $\text{CH}_2=\text{CH}-$ もしくは $\text{CH}_2=\text{CH}-\text{C}_6\text{H}_4-$ を表し；

Z は、

【化 16】



または



を表し、 s は、1 ~ 16 の整数であり、 R_1 は、 H または基 COOH もしくは基 $-\text{CO}-\text{NH}-(\text{CH}_2)_t-\text{CH}_3$ を表し、 t は、1 ~ 16 の整数であるか、あるいは

Z は、糖または多糖類型の中性で親水性の、極性を有する頭部であってもよい] で示される両親媒性分子から出発して得られる、重合させた両親媒性分子を含むことを特徴とする、請求項 1 および 2 に記載の重合ミセル、ならびに薬学的に許容され得る酸または塩基とのその付加塩。

【請求項 4】

極性を有する頭部 Z が機能化されていることを特徴とする、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の重合ミセル。

【請求項 5】

極性を有する頭部 Z が葉酸によって機能化されていることを特徴とする、請求項 4 記載の重合ミセル。

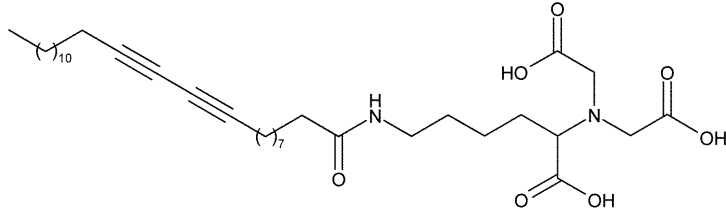
【請求項 6】

一つまたはそれ以上の疎水性化合物を含むことを特徴とする、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の重合ミセル。

【請求項 7】

重合させた両親媒性分子が、式：

【化 1 7】

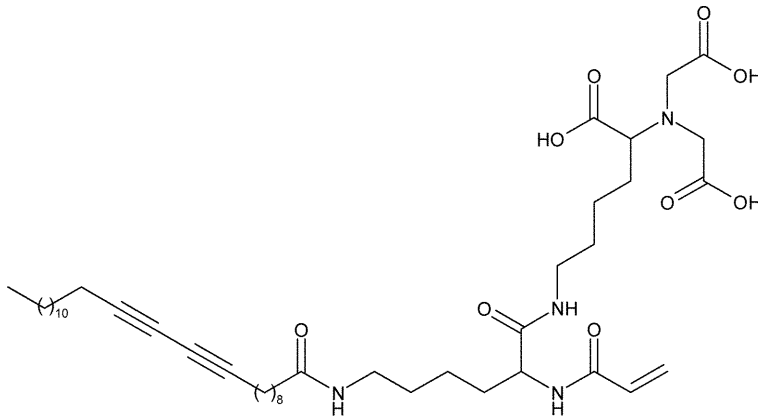


で示される両親媒性分子II - 4 から出発して得られることを特徴とする、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の重合ミセル。

【請求項 8】

重合させた両親媒性分子が、式：

【化 1 8】

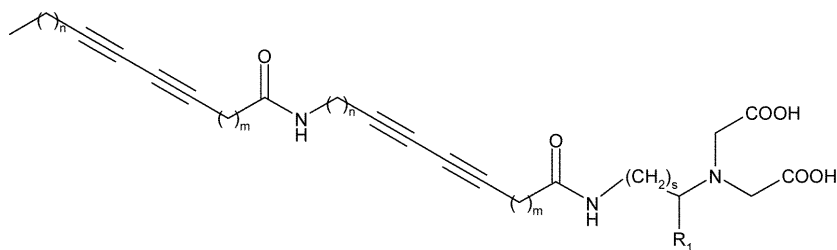


で示される両親媒性分子II - 23 から出発して得られることを特徴とする、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の重合ミセル。

【請求項 9】

重合させた両親媒性分子が、式：

【化 1 9】

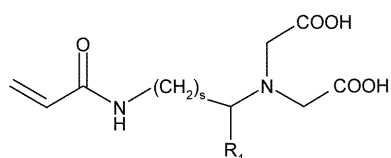


で示される両親媒性分子から出発して得られることを特徴とする、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の重合ミセル。

【請求項 10】

重合させた両親媒性分子が、式：

【化 20】

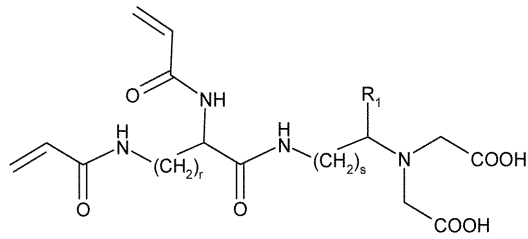


で示される両親媒性分子から出発して得られることを特徴とする、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の重合ミセル。

【請求項 1 1】

重合させた両親媒性分子が、式：

【化 2 1】

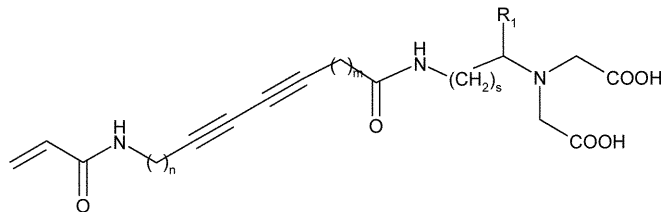


で示される両親媒性分子から出発して得られることを特徴とする、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の重合ミセル。

【請求項 1 2】

重合させた両親媒性分子が、式：

【化 2 2】

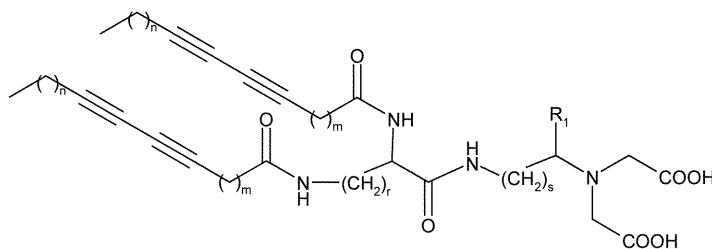


で示される両親媒性分子から出発して得られることを特徴とする、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の重合ミセル。

【請求項 1 3】

重合させた両親媒性分子が、式：

【化 2 3】



で示される両親媒性分子から出発して得られることを特徴とする、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の重合ミセル。

【請求項 1 4】

請求項 1 ~ 1 3 のいずれか一項に記載の重合ミセルを含むことを特徴とする組成物。

【請求項 1 5】

薬学的に許容され得る一つまたはそれ以上の賦形剤を含むことを特徴とする、請求項 1 4 記載の組成物。

【請求項 1 6】

疎水性分子のベクターとしての請求項 1 ~ 1 3 のいずれか一項に記載の重合ミセルの使用。

【請求項 1 7】

疎水性分子が疎水性の活性成分であることを特徴とする、請求項 1 6 記載の重合ミセル

の使用。

【請求項 18】

下記の工程：

重合させようとする請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の両親媒性化合物を、球状ミセルへと自己組織化させる工程、および

自己組織化した球状ミセルを重合させる工程

を含むことを特徴とする、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の重合ミセルを得る方法

【請求項 19】

自己組織化した球状ミセルを光重合させることを特徴とする、請求項 18 記載の方法。

【請求項 20】

自己組織化した球状ミセルをフリーラジカル重合によって重合させることを特徴とする、請求項 18 記載の方法。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0009

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0009】

本発明は、それぞれ一つまたは二つの重合可能な、ジアセチレン、ビニル、アクリレートまたはスチレン型の部分を含む 1 もしくは 2 本の脂質鎖を有し、極性を有する頭部に結合された両親媒性分子から出発して得られる、重合させた両親媒性分子を含むことを特徴とする、重合ミセルに関するものである。