

【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6月7日(2012.6.7)

【公開番号】特開2011-21026(P2011-21026A)

【公開日】平成23年2月3日(2011.2.3)

【年通号数】公開・登録公報2011-005

【出願番号】特願2010-211089(P2010-211089)

【国際特許分類】

A 6 1 K 9/127 (2006.01)

A 6 1 K 47/24 (2006.01)

A 6 1 K 47/28 (2006.01)

A 6 1 K 47/44 (2006.01)

A 6 1 K 47/16 (2006.01)

A 6 1 K 9/51 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 9/127

A 6 1 K 47/24

A 6 1 K 47/28

A 6 1 K 47/44

A 6 1 K 47/16

A 6 1 K 9/51

【手続補正書】

【提出日】平成24年4月2日(2012.4.2)

【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】

少なくとも1種の正電荷担体と、少なくとも1種の負電荷担体と、少なくとも1種の中性脂質とを含む両性リポソームであって、該リポソームが4～8の間に等電点を有し、該リポソームが、pH4.2及び7.5で安定であることを特徴とする、両性リポソーム。

【請求項2】

前記リポソームが、5～7の間に等電点を有する、請求項1記載の両性リポソーム。

【請求項3】

前記中性脂質が、ホスファチジルコリン、ホスファチジルエタノールアミン、コレステロール、テトラエーテル脂質、セラミド、スフィンゴ脂質及びジアシルグリセロールからなる群より選ばれる、請求項1に記載の両性リポソーム。

【請求項4】

前記負電荷担体が、弱陰イオン性脂質であり、前記正電荷担体が、強陽イオン性脂質である、請求項1に記載の両性リポソーム。

【請求項5】

前記負電荷担体が、弱陰イオン性脂質であり、前記正電荷担体が、弱陽イオン性脂質である、請求項1に記載の両性リポソーム。

【請求項6】

前記負電荷担体が、強陰イオン性脂質であり、前記正電荷担体が、弱陽イオン性脂質である、請求項1に記載の両性リポソーム。

【請求項 7】

前記弱陰イオン性脂質が、コレステロールヘミスクシネート（C H E M S）、ヘミコハク酸ジアシルグリセロール、脂肪酸、及びホスファチジルセリンからなる群から選択される、請求項 4 又は 5 に記載の両性リポソーム。

【請求項 8】

前記強陽イオン脂質が、D O T A P、D C - C h o l、D O R I E、D D A B、T C - C h o l、D O T M A、D O G S、(C18)₂Gly⁺ N,N-ジオクタデシルアミド-グリシン、C T A B、C p y C、及びD O E P C からなる群から選択される、請求項 4 に記載の両性リポソーム。

【請求項 9】

前記弱陽イオン性脂質が、His-Chol 及びMo-Chol からなる群から選択される、請求項 5 又は 6 に記載の両性リポソーム。

【請求項 10】

前記強陰イオン性脂質が、硫酸コレステロール、リン酸コレステロール、ホスファチジルグリセロール、ホスファチド酸、ホスファチジルイノシトール、及びリン酸セチルからなる群から選択される、請求項 6 に記載の両性リポソーム。

【請求項 11】

50 ~ 1000 n m の平均サイズを有する、請求項 1 に記載の両性リポソーム。

【請求項 12】

70 ~ 250 n m の平均サイズを有する、請求項 11 に記載の両性リポソーム。

【請求項 13】

60 ~ 130 n m の平均サイズを有する、請求項 11 に記載の両性リポソーム。

【請求項 14】

有効成分を含む、請求項 1 に記載の両性リポソーム。

【請求項 15】

前記有効成分が、タンパク質、ペプチド、D N A、R N A、アンチセンスヌクレオチド及び / 又はデコイヌクレオチドである、請求項 14 に記載の両性リポソーム。

【請求項 16】

前記有効成分の少なくとも80% が、前記リポソームの内部にある、請求項 14 に記載の両性リポソーム。

【請求項 17】

請求項 1 の両性リポソームに、有効成分を充填する方法であって、前記有効成分を封入するために決められたp H が用いられ、結合していない有効成分を分離するために第二のp H が用いられることを特徴とする方法。

【請求項 18】

決められたp H で透過化処理され閉鎖される請求項 17 に記載の方法。

【請求項 19】

ナノカプセルを製造するための請求項 1 に記載の両性リポソームの使用。

【請求項 20】

診断における放出システムを製造するための請求項 1 に記載の両性リポソームの使用。

【請求項 21】

請求項 14 に記載の両性リポソームを含む、有効成分を運搬及び / 又は放出するための医薬製剤。

【請求項 22】

請求項 14 に記載の両性リポソームを含む、徐放性製剤。

【請求項 23】

請求項 14 に記載の両性リポソームを含む、循環デポ。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 1 5

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 1 5】

弱陽イオン化合物の例は、His-Chol ヒスタミニル-コレステロールヘミスクシネート、Mo-Chol モルホリン-N-エチルアミノ-コレステロールヘキスクシネート又はヒスチジニル-PEである。

中性化合物の例は、コレステロール、セラミド、ホスファチジルコリン、ホスファチジルエタノールアミン、テトラエーテル脂質又はジアシルグリセロールである。

弱陰イオン化合物の例は、CHEMSコレステロールヘミスクシネート、炭素原子8～25個を有するアルキルカルボン酸又はヘミコハク酸ジアシルグリセロールである。追加の弱陰イオン化合物は、アスパラギン酸、又はグルタミン酸とPE又はPS又はそのアミドのグリシン、アラニン、グルタミン、アスパラギン、セリン、システイン、トレオニン、チロシン、グルタミン酸、アスパラギン酸又は他のアミノ酸又はアミノジカルボン酸によるアミドである。同じ原理に従って、ヒドロキシカルボン酸又はヒドロキシジカルボン酸とPSのエステルも弱陰イオン化合物である。