

【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12月13日 (2012.12.13)

【公表番号】特表2012-507562(P2012-507562A)

【公表日】平成24年3月29日 (2012.3.29)

【年通号数】公開・登録公報2012-013

【出願番号】特願2011-534806(P2011-534806)

【国際特許分類】

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

C 0 8 J 9/26 (2006.01)

C 0 8 J 9/28 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 9/14 (2006.01)

A 6 1 K 35/28 (2006.01)

A 6 1 K 35/39 (2006.01)

A 6 1 K 47/42 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 1/18 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 K 35/12 (2006.01)

C 0 8 L 101/16 (2006.01)

C 0 7 K 7/06 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 47/32 Z B P

C 0 8 J 9/26 C E R

C 0 8 J 9/26 C E Z

C 0 8 J 9/28 1 0 1

A 6 1 K 47/34 Z N A

A 6 1 K 9/14

A 6 1 K 35/28

A 6 1 K 35/39

A 6 1 K 47/42

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 1/18

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 K 35/12

C 0 8 L 101/16

C 0 7 K 7/06

【手続補正書】

【提出日】平成24年10月29日 (2012.10.29)

【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】

二相性多孔性ポリマー粒子を製造するための方法であって、

- (a) ベースポリマー、第1の溶媒及び第2の溶媒を含む均一溶液を提供すること；
- (b) 大孔スパーサ物質を該溶液に添加すること；
- (c) 該溶液の液滴をクエンチング装置に注入すること；
- (d) 該溶液の液滴をクエンチングして、該ベースポリマーを大孔及び細孔を有する粒子に固体化させること；
- (e) 実質的に球状の粒子を該クエンチング装置から抽出し、任意に該粒子を篩にかけること；及び、
- (f) 任意に該大孔スパーサ物質を該粒子から洗浄すること；を含む、前記方法。

【請求項 2】

第1及び第2の溶媒の総体積に対する第1の溶媒の体積比が、約1%～約50%v/v、約1%～約40%v/v、約2%～約30%v/v、約4%～約25%v/v、又は約5%～約15%v/vである、請求項1記載の方法。

【請求項 3】

前記溶液におけるベースポリマーの濃度が、約0.1重量%～約50重量%、約1重量%～約40重量%、約5重量%～約23重量%、又は約10重量%～約20重量%である、請求項1又は2記載の方法。

【請求項 4】

前記大孔スパーサ物質がシスプラチンである、請求項1～3のいずれか1項記載の方法。

【請求項 5】

前記大孔スパーサ物質が生体吸収性でない、請求項1～4のいずれか1項記載の方法。

【請求項 6】

前記大孔スパーサ物質が、血管などの管腔構造を塞栓する、請求項5記載の方法。

【請求項 7】

前記大孔スパーサ物質が、アルカリ金属及びアルカリ土類金属ハロゲン化物、リン酸塩、硫酸塩；糖、糖の結晶；水溶性ポリマー、微小球、ナノ粒子、水溶性ポリマーの微小球；タンパク質、アルブミン及び塩化ナトリウム；からなる群から選択される、請求項1～6のいずれか1項記載の方法。

【請求項 8】

添加剤を提供することを更に含む、請求項1～7のいずれか1項記載の方法。

【請求項 9】

前記添加剤が前記粒子に組み込まれているか又は被覆されている、請求項8記載の方法。

【請求項 10】

前記添加剤が前記粒子の表面に接着する、請求項8又は9記載の方法。

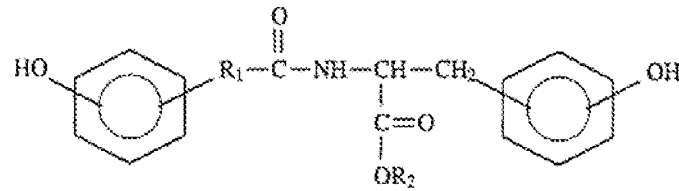
【請求項 11】

前記添加剤が、前記ベースポリマーとの架橋、イオン結合、酸塩基反応、受容体部位引力又は重力により微小球の表面に接着する、請求項10記載の方法。

【請求項 12】

前記ベースポリマーが、以下の化合物を含む、又は以下の化合物からなる、請求項1～11のいずれか1項記載の方法：

【化 1】



式中、 R_1 が $-\text{CH}=\text{CH}-$ 又は $(-\text{CH}_2-)_n$ (n は 0 又は 1 ~ 8 の整数である) であり ; 及び、 R_2 が最高 18 の炭素原子を含む直鎖及び分枝アルキル及びアルキルアリール基から選択される。

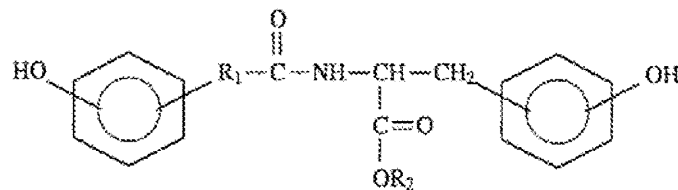
【請求項 13】

ベースポリマーを含む二相性多孔質粒子であって、該粒子が約 20 ~ 約 500 ミクロンの範囲の直径を有する大孔及び約 1 ~ 約 70 ミクロンの範囲の直径を有する細孔を含み、かつ該微小球が約 50 ~ 約 1100 ミクロンの範囲の直径を有する、前記二相性多孔質粒子。

【請求項 14】

前記ベースポリマーが、以下の化合物を含む、又は以下の化合物からなる、請求項 13 記載の粒子 :

【化 2】



式中、 R_1 が $-\text{CH}=\text{CH}-$ 又は $(-\text{CH}_2-)_n$ (n は 0 又は 1 ~ 8 の整数である) であり ; 及び、 R_2 が最高 18 の炭素原子を含む直鎖及び分枝アルキル及びアルキルアリール基から選択される。

【請求項 15】

請求項 1 ~ 12 のいずれか 1 項記載の方法により製造された二相性多孔質粒子。

【請求項 16】

細胞を更に含む、請求項 13 ~ 15 のいずれか 1 項記載の粒子。

【請求項 17】

請求項 13 ~ 16 のいずれか 1 項記載の粒子及び医薬として許容し得る担体を含む、注入可能組成物。

【請求項 18】

二相性多孔質ポリマー粒子を製造するための装置であって :

- (a) 貯槽 ;
 - (b) クエンチングタワー ;
 - (c) 直径約 5 ~ 約 1100 ミクロンの範囲の直径を有するノズルを含み、かつ該槽が注入器に連結されている、注入器 ; 及び、
 - (d) 1 以上の微細節 ;
- を含む、前記装置。