

【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28年3月17日(2016.3.17)

【公表番号】特表2015-523969(P2015-523969A)

【公表日】平成27年8月20日(2015.8.20)

【年通号数】公開・登録公報2015-052

【出願番号】特願2015-514193(P2015-514193)

【国際特許分類】

A 6 1 K	47/42	(2006.01)
A 6 1 K	9/51	(2006.01)
A 6 1 K	31/711	(2006.01)
A 6 1 K	31/7105	(2006.01)
A 6 1 K	48/00	(2006.01)
A 6 1 K	9/19	(2006.01)
A 6 1 K	9/08	(2006.01)
A 6 1 K	9/10	(2006.01)
A 6 1 K	9/72	(2006.01)
A 6 1 K	31/7125	(2006.01)
B 8 2 Y	5/00	(2011.01)
B 8 2 Y	30/00	(2011.01)
A 6 1 K	47/24	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	47/42
A 6 1 K	9/51
A 6 1 K	31/711
A 6 1 K	31/7105
A 6 1 K	48/00
A 6 1 K	9/19
A 6 1 K	9/08
A 6 1 K	9/10
A 6 1 K	9/72
A 6 1 K	31/7125
B 8 2 Y	5/00
B 8 2 Y	30/00
A 6 1 K	47/24

【手続補正書】

【提出日】平成28年1月29日(2016.1.29)

【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】

少なくとも1つの脂質と少なくとも1つのアルブミン・ポリマー・コンジュゲート( A P C )を含んでなる脂質ナノ粒子であって、ここで該ポリマーは、少なくとも1つの陽荷電ポリマーを含み；ここで当該A P Cは少なくとも1つのオリゴヌクレオチドへ結合することが可能である超力チオ化アルブミン・ポリカチオンコンジュゲートを含み；そしてこ

ここで当該少なくとも1つの陽荷電ポリマーは少なくともポリエチレンイミン含む、前記脂質ナノ粒子。

【請求項2】

ポリエチレンイミンが50kDa以下の分子量を有するか又は約200～約2000Daの分子量を有する、請求項1の脂質ナノ粒子。

【請求項3】

陽荷電ポリマーが2以上の低分子量ポリマーの混合物を含む、請求項1の脂質ナノ粒子。

【請求項4】

ヒト血清アルブミン(HSA)ヘコンジュゲートしたペンタエチレンヘキサミン(PEHA)を含む、請求項1の脂質ナノ粒子。

【請求項5】

それぞれのHSA分子へ平均して約11個のPEHA分子が連結している、請求項4の脂質ナノ粒子。

【請求項6】

少なくとも1つの脂質が、1,2-ジオレオイル-3-トリメチルアンモニウム-プロパン(DOTAP)、L--ホスファチジルコリン(SPC)、及びd--トコフェリルポリエチレングリコール1000スクシネート(TPGS)を含む、請求項1の脂質ナノ粒子。

【請求項7】

脂質が25:70:5のモル比のDOTAP:SPC:TPGSである、請求項6の脂質ナノ粒子。

【請求項8】

脂質ナノ粒子が、以下：抗新生物剤、抗感染症薬、局所麻酔薬、抗アレルギー薬、抗貧血薬、血管新生阻害剤、-アドレナリン作動性遮断薬、カルシウムチャネル拮抗薬、降圧剤、抗うつ薬、抗痙攣薬、抗細菌薬、抗真菌薬、抗ウイルス薬、抗リウマチ薬、駆虫薬、抗寄生虫薬、コルチコステロイド、ホルモン、ホルモン拮抗薬、免疫調節剤、神経伝達物質拮抗薬、抗糖尿病剤、抗てんかん薬、止血薬、抗過緊張薬、抗線内障剤、免疫調節性サイトカイン、鎮静剤、ケモカイン、ビタミン、毒素、麻薬、造影剤、及びこれらの組合せより選択される治療薬剤を含む、少なくとも1つの分子を被包する、請求項1の脂質ナノ粒子。

【請求項9】

ポリエチレングリコール-コンジュゲート(conjugated)脂質がさらに含まれる、請求項1の脂質ナノ粒子。

【請求項10】

ポリエチレングリコール-コンジュゲート脂質が、ポリソルベート80、TPGS、及びmPEG-DSPEの1以上を含む、請求項9の脂質ナノ粒子。

【請求項11】

ポリエチレングリコール-コンジュゲート脂質が約15.0モルパーセント未満の濃度で存在する、請求項9の脂質ナノ粒子。

【請求項12】

標的細胞又は細胞表面上の標的分子へ結合することが可能なリガンドをさらに含んでなり；ここで当該リガンドは、cRGD、ガラトース含有部分、トランスフェリン、葉酸塩、低密度リボタンパク質、又は表皮増殖因子より選択される、請求項1の脂質ナノ粒子。

【請求項13】

リガンドが抗体又は抗体断片である、請求項12の脂質ナノ粒子。

【請求項14】

請求項1の脂質ナノ粒子を作製する方法であって：

少なくとも1つの脂質をヒト血清アルブミン-ペンタエチレンヘキサミン(HSA-PEHA)コンジュゲートへ加えて、混合物を生成する工程；

該混合物へ少なくとも 1 つの治療分子を加える工程；及び  
該混合物を透析又は透析濾過工程へ処して、脂質ナノ粒子を作製する工程を含んでなる  
、前記方法。

【請求項 1 5】

少なくとも 1 つの脂質が D O T A P 、 S P C 、及び T P G S を 2 5 : 7 0 : 5 の比で含  
む、請求項 1 4 の方法。