

【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カチオン化アルブミン - 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ジアミンを含む、前記脂質ナノ粒子。

【請求項２】

ポリエチレンジアミンが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）へコンジュゲートしたペンタエチレンジアミン（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－α－ホスファチジルコリン（ＳＰＣ）、及びｄ－α－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、α－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、抗緑内障剤、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り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、低密度リポタンパク質、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－ペンタエチレンジアミン（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。