

【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】令和1年12月12日(2019.12.12)

【公表番号】特表2018-530606(P2018-530606A)

【公表日】平成30年10月18日(2018.10.18)

【年通号数】公開・登録公報2018-040

【出願番号】特願2018-536071(P2018-536071)

【国際特許分類】

A 6 1 K	47/61	(2017.01)
A 6 1 K	31/519	(2006.01)
A 6 1 K	31/575	(2006.01)
A 6 1 K	31/455	(2006.01)
A 6 1 K	31/4188	(2006.01)
A 6 1 K	31/60	(2006.01)
A 6 1 K	47/36	(2006.01)
A 6 1 K	47/38	(2006.01)
A 6 1 K	31/337	(2006.01)
A 6 1 K	31/4745	(2006.01)
A 6 1 K	9/14	(2006.01)
A 6 1 K	9/08	(2006.01)
A 6 1 K	9/20	(2006.01)
A 6 1 K	9/48	(2006.01)
A 6 1 K	9/107	(2006.01)
A 6 1 K	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 K	47/55	(2017.01)

【F I】

A 6 1 K	47/61
A 6 1 K	31/519
A 6 1 K	31/575
A 6 1 K	31/455
A 6 1 K	31/4188
A 6 1 K	31/60
A 6 1 K	47/36
A 6 1 K	47/38
A 6 1 K	31/337
A 6 1 K	31/4745
A 6 1 K	9/14
A 6 1 K	9/08
A 6 1 K	9/20
A 6 1 K	9/48
A 6 1 K	9/107
A 6 1 K	9/10
A 6 1 P	35/00
A 6 1 K	47/55

【手続補正書】

【提出日】令和1年10月31日(2019.10.31)

【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】

複数の多糖類 - ビタミン共役体と、

前記複数の多糖類 - ビタミン共役体に被包された活性薬剤と、
を含み、

前記複数の多糖類 - ビタミン共役体のそれぞれは、多糖類分子と、ビタミン又は前記ビタミンの活性及び生物学的機能を保持している類似体若しくは誘導体の1以上の分子と、を含み、

前記ビタミン又は前記ビタミンの活性及び生物学的機能を保持している類似体若しくは誘導体の1以上の分子は、少なくとも2つの原子を含む連結基を介して前記多糖類分子と共有結合により共役し、

前記連結基は前記多糖類分子に対して外来性であり、且つ前記多糖類分子の単量体環に結合し、

前記粒状物の表面が実質的に親水性であり、

前記ビタミン又は前記ビタミンの活性及び生物学的機能を保持している類似体若しくは誘導体は、前記非ミセル粒状物の内部に被包されており、

前記活性薬剤は、前記非ミセル粒状物の内部に被包され、複数の前記ビタミン又は前記ビタミンの活性及び生物学的機能を保持している類似体若しくは誘導体の少なくとも1つと非共有結合により結合し、前記非ミセル粒状物の内部に入っている、非ミセル粒状物。

【請求項2】

活性薬剤分子は、前記非ミセル粒状物の内部の全体に被包されている、請求項1に記載の非ミセル粒状物。

【請求項3】

活性薬剤分子は、前記非ミセル粒状物の内部の全体にランダムに被包されており、且つ前記粒状物の内部コアの内側に分離されていない、請求項1に記載の非ミセル粒状物。

【請求項4】

前記多糖類分子が、前記ビタミン又は前記ビタミンの活性及び生物学的機能を保持している類似体若しくは誘導体に連結体分子を介して共役されており、

前記連結体分子は、前記多糖類分子の1以上の官能基又は官能化多糖類分子に対して反応性の第1の化学基と、前記ビタミン又は前記ビタミンの活性及び生物学的機能を保持している類似体若しくは誘導体の1以上の官能基又はそれらの官能化分子に対して反応性の第2の化学基と、を含む、請求項1に記載の非ミセル粒状物。

【請求項5】

前記多糖類 - ビタミン共役体が、第1のビタミン又は前記第1のビタミンの活性及び生物学的機能を保持している類似体若しくは誘導体と、第2のビタミン又は前記第2のビタミンの活性及び生物学的機能を保持している類似体若しくは誘導体と、を含み、

前記第2のビタミン又は前記第2のビタミンの活性及び生物学的機能を保持している類似体若しくは誘導体は、前記第1のビタミン又は前記第1のビタミンの活性及び生物学的機能を保持している類似体若しくは誘導体とは異なり、

前記第1のビタミン又は前記第1のビタミンの活性及び生物学的機能を保持している類似体若しくは誘導体は、前記多糖類の第1の位置で前記多糖類と共有結合により連結されており；

前記第2のビタミン又は前記第2のビタミンの活性及び生物学的機能を保持している類似体若しくは誘導体は、前記多糖類の第2の位置で前記多糖類と共有結合により連結されており、ここで前記第2の位置は前記第1の位置と異なり；及び

前記活性薬剤は、前記第1のビタミン又は前記第1のビタミンの活性及び生物学的機能

を保持している類似体若しくは誘導体、あるいは前記第2のビタミン又は前記第2のビタミンの活性及び生物学的機能を保持している類似体若しくは誘導体、あるいはその両方と非共有的に結合している、請求項1に記載の非ミセル粒状物。

【請求項6】

前記ビタミン又は前記ビタミンの活性及び生物学的機能を保持している類似体若しくは誘導体が、葉酸塩、ニコチニアミド、N,N-ジエチルニコチニアミド、又はビオチンである、請求項1に記載の非ミセル粒状物。

【請求項7】

前記多糖類が、水及び有機溶媒に可溶な多糖類である、請求項1に記載の非ミセル粒状物。

【請求項8】

前記多糖類が、デキストラン若しくはその誘導体、セルロース若しくはその誘導体、カルボキシメチルセルロース、又はヒアルロン酸若しくはその誘導体である、請求項5に記載の非ミセル粒状物。

【請求項9】

前記多糖類が、スクシニル化、カルボキシメチル化、及び/又は環式無水物による修飾がなされている、請求項1に記載の非ミセル粒状物。

【請求項10】

前記ビタミン又は前記ビタミンの活性及び生物学的機能を保持している類似体若しくは誘導体の1以上の分子が疎水性である、請求項1に記載の非ミセル粒状物。

【請求項11】

前記活性薬剤が疎水性である、請求項1に記載の非ミセル粒状物。

【請求項12】

前記活性薬剤が抗腫瘍薬である、請求項1に記載の非ミセル粒状物。

【請求項13】

前記活性薬剤が、タキサン化合物又はカンプトテシン化合物である、請求項1に記載の非ミセル粒状物。

【請求項14】

前記非ミセル粒状物の平均直径が約20nm～約1000nmである、請求項1に記載の非ミセル粒状物。

【請求項15】

請求項1に記載の非ミセル粒状物と、薬学的に許容される担体又は添加剤と、を含む、医薬組成物。

【請求項16】

有効量の請求項15に記載の組成物を患者に投与することを含む、患者を治療する方法。

【請求項17】

有効量の請求項15に記載の組成物を細胞に送達することを含む、細胞の増殖を阻害する方法。

【請求項18】

有効量の放射線で、それを必要とする対象を治療することと、有効量の請求項15に記載の組成物で、前記対象を治療することと、を含む、対象における腫瘍増殖を減少させる方法。

【請求項19】

有効量の化学療法薬で、それを必要とする対象を治療することと、有効量の請求項15に記載の組成物で、前記対象を治療することと、を含む、対象における腫瘍増殖を減少させる方法。

【請求項20】

有効量の生物学的に活性な治療薬で、それを必要とする対象を治療することと、有効量の請求項15に記載の組成物で、前記対象を治療することと、を含む、対象における腫瘍

増殖を減少させる方法。

【請求項 2 1】

前記ビタミン又は前記ビタミンの活性及び生物学的機能を保持している類似体若しくは誘導体の 1 以上の分子は、明確な層に分かれておらず、

前記非ミセル粒状物中で二層構造が実質的に欠いている、請求項 1 に記載の非ミセル粒状物。

【請求項 2 2】

前記非ミセル粒状物の内部は、実質的に均質な構造を有する、請求項 1 に記載の非ミセル粒状物。

【請求項 2 3】

前記ビタミン又は前記ビタミンの活性及び生物学的機能を保持している類似体若しくは誘導体の 1 以上の分子と前記多糖類分子とのモル比が 1 : 4 0 ~ 2 : 1 の範囲である、請求項 1 に記載の非ミセル粒状物。

【請求項 2 4】

前記非ミセル粒状物が 1 0 % ~ 3 0 % の担持容量を有する、請求項 1 に記載の非ミセル粒状物。