

【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、ニコチンアミド、N, N - ジエチルニコチンアミド、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 20 nm ~ 約 1000 nm 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 : 40 ~ 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 10 % ~ 30 % の担持容量を有する、請求項 1 に記載の非ミセル粒状物。