

【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27年9月24日(2015.9.24)

【公開番号】特開2015-7139(P2015-7139A)
 【公開日】平成27年1月15日(2015.1.15)
 【年通号数】公開・登録公報2015-003
 【出願番号】特願2014-210425(P2014-210425)
 【国際特許分類】

A 6 1 K 47/48 (2006.01)
 A 6 1 K 47/34 (2006.01)
 A 6 1 K 9/127 (2006.01)
 A 6 1 K 9/14 (2006.01)
 A 6 1 K 9/48 (2006.01)
 A 6 1 K 38/00 (2006.01)
 A 6 1 K 47/12 (2006.01)
 A 6 1 K 47/44 (2006.01)
 A 6 1 P 9/00 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4188 (2006.01)
 A 6 1 K 51/00 (2006.01)
 A 6 1 K 49/00 (2006.01)
 A 6 1 L 15/16 (2006.01)
 A 6 1 L 27/00 (2006.01)
 A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 47/48
 A 6 1 K 47/34
 A 6 1 K 9/127
 A 6 1 K 9/14
 A 6 1 K 9/48
 A 6 1 K 37/02
 A 6 1 K 47/12
 A 6 1 K 47/44
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 K 31/4188
 A 6 1 K 49/02 A
 A 6 1 K 49/00 A
 A 6 1 K 49/00 C
 A 6 1 L 15/01
 A 6 1 L 27/00 Y
 A 6 1 P 35/00

【手続補正書】
 【提出日】平成27年8月5日(2015.8.5)
 【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】

治療剤、栄養剤、診断剤または予防剤を送達するためのポリマー微粒子であって、該微粒子は、疎水性で、生体適合性でそして生分解性のポリマー、および親油性の表面活性剤を含み、該親油性の表面活性剤は、該微粒子の表面に挿入された第 1 の末端および該微粒子の表面から外向きに面する第 2 の末端を有する、微粒子。

【請求項 2】

前記疎水性で、生体適合性でそして生分解性のポリマーはポリ(乳酸-co-グリコール酸)(PLGA)、ポリグリコリド(PGA)およびポリ乳酸(PLA)からなる群より選択される、請求項 1 に記載の微粒子。

【請求項 3】

前記親油性の表面活性剤は、脂質、脂肪酸および界面活性剤からなる群より選択される、請求項 2 に記載の微粒子。

【請求項 4】

前記親油性の表面活性剤は脂肪酸を含む、請求項 3 に記載の微粒子。

【請求項 5】

前記親油性の表面活性剤は、結合分子、標的化分子、またはそれらの混合物に結合される、請求項 1 に記載の微粒子。

【請求項 6】

前記親油性の表面活性剤は、治療剤、栄養剤、診断剤および予防剤、ならびにそれらの混合物からなる群より選択される送達される薬剤に結合される、請求項 1 に記載の微粒子。

【請求項 7】

請求項 5 または 6 に記載の微粒子であって、該微粒子は、該微粒子に結合される標的化分子を有する、微粒子。

【請求項 8】

前記標的化分子は、前記親油性の表面活性剤に、物理学的に結合されるか、または化学的に結合される、請求項 7 に記載の微粒子。

【請求項 9】

前記微粒子内にカプセル化される薬剤をさらに含む、請求項 5 に記載の微粒子。

【請求項 10】

2 段階送達もしくはパルス送達の形態で、異なる薬剤を送達するための、請求項 9 に記載の微粒子。

【請求項 11】

標的化分子は、前記微粒子の表面または前記親油性の表面活性剤に結合される、請求項 5 に記載の微粒子。

【請求項 12】

前記標的化分子は、特異的な標的化分子である、請求項 11 に記載の微粒子。

【請求項 13】

前記標的化分子は、抗体およびそのフラグメント、糖類、ペプチド、ならびに細胞表面レセプターに対するリガンドからなる群より選択される、請求項 11 に記載の微粒子。

【請求項 14】

前記親油性の表面活性剤は、結合分子に結合される、請求項 5 に記載の微粒子。

【請求項 15】

前記親油性の表面活性剤は、ストレプトアビジンおよびビオチンからなる群より選択される結合分子に結合される、請求項 14 に記載の微粒子。

【請求項 16】

前記親油性の表面活性剤は、リンカーに結合される、請求項 1 に記載の微粒子。

【請求項 17】

前記リンカーは、分枝状であり、そして多数の送達される薬剤または多数の結合分子は、該リンカーを介して前記親油性の表面活性剤の各々に結合される、請求項 16 に記載の微粒子。

【請求項 18】

前記リンカーは、ポリエチレングリコール星型ポリマーである、請求項 16 に記載の微粒子。

【請求項 19】

前記送達される薬剤は、薬物、タンパク質、ペプチド、糖類、多糖類、ヌクレオチド分子、および核酸分子からなる群より選択される治療剤または栄養剤である、請求項 6 に記載の微粒子。

【請求項 20】

前記送達される薬剤は、常磁性分子、蛍光化合物、磁性分子、および放射性核種からなる群より選択される診断剤である、請求項 6 に記載の微粒子。

【請求項 21】

前記送達される薬剤は、カルシウム沈着を阻害する、請求項 6 に記載の微粒子。

【請求項 22】

前記送達される薬剤は、細胞傷害性薬剤または抗増殖剤である、請求項 6 に記載の微粒子。

【請求項 23】

前記リンカーは、ポリエチレングリコールであり、そして前記結合分子は、ストレプトアビジン、アビジンまたはピオチンである、請求項 16 に記載の微粒子。

【請求項 24】

0.5 ミクロンと 20 ミクロンとの間である直径を有する、請求項 1 に記載の微粒子。

【請求項 25】

50 ナノメートルと 500 ナノメートルとの間の直径を有するナノ粒子の形態である、請求項 1 に記載の微粒子。

【請求項 26】

前記ナノ粒子は、100 nm 未満の直径を有する、請求項 25 に記載の微粒子。

【請求項 27】

リポソーム中にカプセル化される、請求項 1 に記載の微粒子。

【請求項 28】

治療剤、栄養剤、診断剤または予防剤の送達のための微粒子を作製するための方法であって、以下：

疎水性で、生体適合性でそして生分解性のポリマーの溶液または液体形態の該ポリマーを提供する工程、

該治療剤、栄養剤、診断剤または予防剤を該ポリマーに添加する工程；および親油性の表面活性剤を、該ポリマーに添加する工程であって、該親油性の表面活性剤が該微粒子のポリマー性表面中に挿入されかつ他の末端が該微粒子のポリマー性表面から外向きに延びる条件下で、該ポリマーが凝固され、該微粒子を形成する、工程、を包含する、方法。

【請求項 29】

前記疎水性で、生体適合性でそして生分解性のポリマーは、PLGA、PGA および PLA からなる群より選択される、請求項 28 に記載の方法。

【請求項 30】

前記微粒子は、水中油型エマルションにおいて水中で形成される、請求項 28 に記載の方法。

【請求項 31】

前記親油性の表面活性剤は、標的化分子もしくは結合分子または治療剤、予防剤もしくは診断剤と最初に結合体化される、請求項 28 に記載の方法。

【請求項 32】

前記親油性の表面活性剤は、脂肪酸、脂質または界面活性剤である、請求項 28 に記載の方法。

【請求項 33】

親油性の表面活性剤と共に疎水性、生体適合性でそして生分解性のポリマーから形成される微粒子であって、該親油性の表面活性剤は、該微粒子の表面に挿入される第1の末端、および該微粒子の表面から外向きに面する第2の末端を有する、微粒子。

【請求項34】

前記疎水性、生体適合性でそして生分解性のポリマーは、PLGA、PGAおよびPLAからなる群より選択される、請求項33に記載の微粒子。

【請求項35】

前記親油性の表面活性剤は、脂肪酸、脂質および界面活性剤からなる群より選択される、請求項33に記載の微粒子。

【請求項36】

細胞の望ましくない増殖を処置するかまたは防止するための組成物であって、該組成物は

直径が50nm~1000ミクロンであり、疎水性、生体適合性でそして生分解性のポリマーと、親油性の表面活性剤と、補体インヒビター、細胞傷害性薬剤、細胞増殖抑制剤、抗増殖剤および抗脈管形成剤から選択される薬剤とを含むポリマー微粒子を含み、ここで、該親油性の表面活性剤は、該微粒子の表面に挿入される第1の末端および該微粒子の表面から外向きに面する第2の末端を有し、該微粒子は、細胞増殖を防止するかまたは減少させるのに有効な量で投与され、

該微粒子は、望ましくない増殖領域の部位、または望ましくない増殖の領域に隣接する部位に、投与されるのに適していることを特徴とする、組成物。

【請求項37】

前記疎水性、生体適合性でそして生分解性のポリマーは、PLGA、PGAおよびPLAからなる群より選択される、請求項36に記載の組成物。

【請求項38】

前記親油性の表面活性剤は、脂質、脂肪酸および界面活性剤からなる群より選択される、請求項36に記載の組成物。

【請求項39】

前記望ましくない増殖は、内皮の機能不全から生じる再狭窄である、請求項36に記載の組成物。

【請求項40】

前記微粒子が、血管形成術、血管移植術、組織移植もしくは器官移植、人工血管インプラント、人工関節インプラントまたは他の医療用インプラントと同時か、またはその直後に投与するのに適していることを特徴とする、請求項36に記載の組成物。

【請求項41】

前記細胞は、内皮細胞であり、前記組成物は、黄斑変性の処置または防止のための組成物であり、そして前記微粒子は、高密度の抗脈管形成剤、抗増殖剤または補体インヒビターを、該微粒子が眼内に投与される場合に網膜の血管新生を防止するかまたは減少させるのに有効な量で含む、請求項36に記載の組成物。

【請求項42】

前記微粒子は、癌の処置のために、局所的かまたは限局的に投与されるのに適していることを特徴とする、請求項36に記載の組成物。

【請求項43】

前記微粒子は、親油性の表面活性剤に結合される標的化分子または結合分子を有する該リガンドをさらに含む、請求項36に記載の組成物。

【請求項44】

前記標的化分子は、腫瘍細胞に対して特異的であり、そして前記微粒子が、該腫瘍細胞を有する個体に投与されるのに適していることを特徴とする、請求項43に記載の組成物。

【請求項45】

治療剤、栄養剤、診断剤または予防剤を送達するためのポリマー微粒子を備える、組織工学マトリックス、創傷包帯、または医療用インプラントであって、該微粒子は、疎水性、

生体適合性でそして生分解性のポリマーと、親油性の表面活性剤と、治療剤、栄養剤、診断剤または予防剤とを含み、該親油性の表面活性剤は、該微粒子の表面に挿入される第1の末端、および該微粒子の表面から外向きに面する第2の末端を有する、組織工学マトリックス、創傷包帯、または医療用インプラント。

【請求項46】

前記親油性の表面活性剤は、治療剤、栄養剤、診断剤もしくは予防剤、または標的化分子もしくは結合分子に結合される、請求項45に記載のマトリックス、包帯、またはインプラント。

【請求項47】

前記疎水性、生体適合性でそして生分解性のポリマーは、PLGA、PGAおよびPLAからなる群より選択される、請求項45に記載のマトリックス、包帯またはインプラント。

【請求項48】

前記親油性の表面活性剤は、脂肪酸、脂質および界面活性剤からなる群より選択される、請求項45に記載のマトリックス、包帯またはインプラント。