

【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29年12月14日(2017.12.14)

【公表番号】特表2016-536318(P2016-536318A)

【公表日】平成28年11月24日(2016.11.24)

【年通号数】公開・登録公報2016-065

【出願番号】特願2016-528894(P2016-528894)

【国際特許分類】

A 6 1 K	9/14	(2006.01)
A 6 1 K	47/24	(2006.01)
A 6 1 K	47/28	(2006.01)
A 6 1 K	47/02	(2006.01)
A 6 1 K	31/7068	(2006.01)
A 6 1 K	31/519	(2006.01)
A 6 1 K	31/704	(2006.01)
A 6 1 K	31/475	(2006.01)
A 6 1 K	31/52	(2006.01)
A 6 1 K	31/506	(2006.01)
A 6 1 K	31/4196	(2006.01)
A 6 1 K	31/282	(2006.01)
A 6 1 K	31/337	(2006.01)
A 6 1 K	31/70	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 K	48/00	(2006.01)
A 6 1 K	47/42	(2017.01)
A 6 1 K	33/24	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	9/14
A 6 1 K	47/24
A 6 1 K	47/28
A 6 1 K	47/02
A 6 1 K	31/7068
A 6 1 K	31/519
A 6 1 K	31/704
A 6 1 K	31/475
A 6 1 K	31/52
A 6 1 K	31/506
A 6 1 K	31/4196
A 6 1 K	31/282
A 6 1 K	31/337
A 6 1 K	31/70
A 6 1 P	35/00
A 6 1 K	45/00
A 6 1 K	48/00
A 6 1 K	47/42
A 6 1 K	33/24

【手続補正書】

【提出日】平成29年11月2日(2017.11.2)

【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】

複数の治療用薬剤を共送達するためのナノスケール粒子であって、

(a) 金属-有機マトリックス材料を含むコア；並びに

(b) 複数の治療用薬剤であって、

(i) 少なくとも二つの非核酸化学療法用薬剤；

(ii) 少なくとも二つの核酸治療用薬剤；

(iii) 少なくとも一つの非核酸化学療法用薬剤及び少なくとも一つの核酸治療用薬剤；又は

(iv) 少なくとも一つの化学療法用薬剤及び少なくとも一つの光増感剤、

から成る複数の治療用薬剤、を含むナノスケール粒子。

【請求項2】

前記複数の治療用薬剤が、前記金属-有機マトリックス材料のコアに組み込まれた少なくとも一つの非核酸化学療法用薬剤を含み、任意に、該少なくとも一つの非核酸化学療法用薬剤が、共有結合又は配位結合を介して該金属-有機マトリックス材料のコアに組み込まれる、請求項1に記載のナノスケール粒子。

【請求項3】

前記複数の治療用薬剤が、少なくとも一つの核酸を含み、該少なくとも一つの核酸が、s i R N A、m i R N A、又はA S O D Nである請求項1に記載のナノスケール粒子。

【請求項4】

前記少なくとも一つの核酸が、該核酸上のリン酸基と前記コアの外表面上の金属イオンとの間の配位結合を介して、前記金属-有機マトリックス材料のコアに連結する、請求項3に記載のナノスケール粒子。

【請求項5】

前記少なくとも一つの核酸が、サバイビンs i R N A、E R C C - 1 s i R N A、P糖タンパク質s i R N A(P-g p s i R N A)、B c l - 2 s i R N A、又はこれらの混合物、からなる群から選択される、請求項3に記載のナノスケール粒子。

【請求項6】

前記ナノスケール粒子が、さらに前記金属-有機マトリックス材料のコアの外側表面の少なくとも一部を覆う-又はそれ以上のコーティング剤又はコーティング層を含み、該-又はそれ以上のコーティング剤又はコーティング層が、金属酸化物、ポリマー、脂質単層、脂質二重層、及びそれらの組み合わせから選択され、前記少なくとも一つの核酸が、共有結合又は非共有結合でコーティング剤又はコーティング層に連結する、請求項1に記載のナノスケール粒子。

【請求項7】

前記金属-有機マトリックス材料のコアが、カチオン性脂質及び/又は官能化脂質を含む脂質二重層で被覆され、該官能化脂質が核酸に結合することができる置換基で官能化された脂質であり、かつ少なくとも一つの核酸が、共有結合で該官能化脂質に結合する及び/又は静電相互作用を介してカチオン性脂質に連結する、請求項6に記載のナノスケール粒子。

【請求項8】

前記-又はそれ以上のコーティング剤又はコーティング層が、さらに、不動態化剤、標的剤、及び/又はイメージング剤を含む請求項6に記載のナノスケール粒子。

【請求項9】

前記金属 - 有機マトリックス材料のコアが、多価金属イオンとビスホスホネートを含む金属ビスホスホネート配位高分子を含む、請求項1に記載のナノスケール粒子。

【請求項 1 0】

前記多価金属イオンが、 Ca^{2+} 、 Mg^{2+} 、 Mn^{2+} 、 Zn^{2+} 、及びこれらの組み合わせからなる群から選択される、請求項9に記載のナノスケール粒子。

【請求項 1 1】

前記ビスホスホネートが、化学療法用プロドラッグである請求項9に記載のナノスケール粒子。

【請求項 1 2】

前記ビスホスホネートが、シスプラチン又はオキサリプラチンのプロドラッグである、請求項1 1に記載のナノスケールの粒子。

【請求項 1 3】

請求項1 ~ 1 2のいずれか一項に記載のナノスケール粒子を製造する方法であって、

(a) 金属イオンを含有するマイクロエマルジョンを、ビスホスホネートを含有するマイクロエマルジョンと接触させ、それによって金属ビスホスホネート配位高分子ナノ粒子を形成する段階、

(b) (a)段階で形成したナノ粒子を、カチオン性脂質及び/又は官能化脂質を含有する溶液中に分散させ、カチオン性脂質でコーティングされた及び/又は官能化脂質コーティングされたナノ粒子を形成する段階、及び

(c) 該脂質でコーティングされたナノスケール粒子を、少なくとも一つの核酸を含む溶液と接触させる段階、

から成る方法。

【請求項 1 4】

請求項1 ~ 1 2のいずれか一項に記載のナノスケール粒子を含む癌を治療するための医薬製剤。

【請求項 1 5】

前記ナノスケール粒子が、少なくとも一つの非核酸化学療法用薬剤及び少なくとも一つの核酸を含む請求項1 4に記載の医薬製剤。

【請求項 1 6】

前記癌が、肺癌、膵臓癌、卵巣癌、乳癌及び結腸癌から選択される請求項1 4に記載の医薬製剤。

【請求項 1 7】

前記癌が、卵巣癌である請求項1 4に記載の医薬製剤。