

【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25年2月7日 (2013.2.7)

【公表番号】特表2012-512175(P2012-512175A)

【公表日】平成24年5月31日 (2012.5.31)

【年通号数】公開・登録公報2012-021

【出願番号】特願2011-540968(P2011-540968)

【国際特許分類】

A 6 1 K 9/16 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/46 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 31/337 (2006.01)

A 6 1 K 31/475 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 K 31/436 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 9/16

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/46

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 31/337

A 6 1 K 31/475

A 6 1 K 31/519

A 6 1 K 31/436

A 6 1 P 35/00

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 37/02

【手続補正書】

【提出日】平成24年12月10日 (2012.12.10)

【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】

それぞれが 80 ～ 90 重量 % の - ヒドロキシポリエステル - c o - ポリエーテルと治療薬とを含む、複数のナノ粒子を含む生体適合性ナノ粒子組成物であって、

- ヒドロキシポリエステル - c o - ポリエーテルは、数平均分子量 15 ～ 20 k D a を有するポリ乳酸及び数平均分子量 2 ～ 10 k D a を有するポリエチレングリコーを含み、

前記組成物を患者に投与すると、少なくとも 12 時間、治療薬の高血漿中濃度を提供し、患者に投与した場合の分布容積が、5 × 血漿容積以下である生体適合性ナノ粒子組成物。

【請求項 2】

前記治療薬の高血漿中濃度を少なくとも 2 4 時間提供する請求項 1 に記載の生体適合性ナノ粒子組成物。

【請求項 3】

前記ナノ粒子がそれぞれ、ターゲティング部位に結合する生体適合性ポリマーをさらに含む請求項 1 又は 2 に記載の生体適合性ナノ粒子組成物。

【請求項 4】

前記ターゲティング部位が、タンパク質、ペプチド、抗体、抗体断片、サッカリド、炭水化物、小分子、グリカン、サイトカイン、ケモカイン、ヌクレオチド、レクチン、脂質、受容体、ステロイド、神経伝達物質、細胞表面マーカー、癌抗原又は糖タンパク質抗原からなる群から選択される請求項 3 に記載の生体適合性ナノ粒子組成物。

【請求項 5】

前記ターゲティング部位が、前立腺特異的膜抗原 (P M S A) に結合する請求項 4 に記載の生体適合性ナノ粒子組成物。

【請求項 6】

前記生体適合性ポリマーが P L A - P E G である請求項 3 から 5 のいずれか一項に記載の生体適合性ナノ粒子。

【請求項 7】

前記ターゲティング部位に結合する前記生体適合性ポリマーが、P L A - P E G - ((S , S - 2 - { 3 - [1 - カルボキシ - 5 - アミノ - ペンチル] - ウレイド } - ペンタン二酸である請求項 3 から 6 のいずれか一項に記載の生体適合性ナノ粒子。

【請求項 8】

前記長時間循環性ナノ粒子が、前記ターゲティング部位に結合する前記生体適合性ポリマーを 1 ~ 4 重量 % 含む請求項 3 から 7 のいずれか一項に記載の生体適合性ナノ粒子組成物。

【請求項 9】

前記 - ヒドロキシポリエステル - c o - ポリエーテルが、ポリ乳酸 - c o - ポリエチレングリコールである請求項 1 から 8 のいずれか一項に記載の生体適合性ナノ粒子組成物。

【請求項 10】

前記 - ヒドロキシポリエステル - c o - ポリエーテルが、ポリ乳酸約 1 6 k D a 及びポリエチレングリコール約 5 k D a を含む請求項 1 から 9 のいずれか一項に記載の生体適合性ナノ粒子組成物。

【請求項 11】

前記長時間循環性ナノ粒子がさらに、生分解性ポリマーを含む請求項 1 から 10 に記載の生体適合性ナノ粒子組成物。

【請求項 12】

前記生分解性ポリマーがポリ乳酸である請求項 11 に記載の生体適合性ナノ粒子組成物。

【請求項 13】

前記治療薬が、化学療法薬、診断剤、予防薬、栄養補助剤、核酸、タンパク質、ペプチド、脂質、炭水化物、ホルモン、小分子、金属、セラミック、薬物、ワクチン、免疫剤及びその組み合わせからなる群から選択される請求項 1 から 12 のいずれか一項に記載の生体適合性ナノ粒子組成物。

【請求項 14】

前記治療薬が抗腫瘍薬である請求項 1 から 13 のいずれか一項に記載の生体適合性ナノ粒子組成物。

【請求項 15】

前記治療薬が、ドセタキセル、ビンクリスチン、メトトレキセート、パクリタキセル又はシロリムスから選択される請求項 1 から 14 のいずれか一項に記載の生体適合性ナノ粒

子組成物。

【請求項 16】

サッカリドの水溶液をさらに含む請求項 1 から 15 のいずれか一項に記載の生体適合性ナノ粒子組成物。

【請求項 17】

それぞれが生体適合性ポリマーと治療薬とを含む、複数のナノ粒子を含む生体適合性ナノ粒子組成物であって、

前記組成物を患者に投与すると、少なくとも 12 時間、治療薬の高血漿中濃度を提供し、患者に投与した場合の分布容積が、 $5 \times$ 血漿容積以下である生体適合性ナノ粒子組成物。

【請求項 18】

前記患者が哺乳動物である請求項 1 から 17 のいずれか一項に記載の生体適合性ナノ粒子組成物。

【請求項 19】

前記患者が霊長類である請求項 1 から 17 のいずれか一項に記載の生体適合性ナノ粒子組成物。

【請求項 20】

請求項 1 から 19 のいずれか一項に記載のナノ粒子組成物を含有する固形腫瘍癌治療剤。