

【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 2 年 4 月 2 日 (2020.4.2)

【公表番号】特表 2019-515873 (P2019-515873A)

【公表日】令和 1 年 6 月 13 日 (2019.6.13)

【年通号数】公開・登録公報 2019-022

【出願番号】特願 2018-545306 (P2018-545306)

【国際特許分類】

A 0 1 N	25/00	(2006.01)
A 6 1 K	6/80	(2020.01)
A 6 1 Q	1/00	(2006.01)
A 6 1 Q	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/02	(2006.01)
A 6 1 P	31/04	(2006.01)
A 6 1 K	8/41	(2006.01)
A 6 1 K	8/84	(2006.01)
A 6 1 K	8/58	(2006.01)
A 6 1 K	47/52	(2017.01)
A 6 1 K	47/55	(2017.01)
A 6 1 K	9/06	(2006.01)
A 6 1 K	9/70	(2006.01)
A 6 1 L	15/20	(2006.01)
A 6 1 L	15/22	(2006.01)
A 6 1 L	15/44	(2006.01)
A 6 1 L	31/08	(2006.01)
A 6 1 L	31/10	(2006.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)

【F I】

A 0 1 N	25/00	1 0 1
A 6 1 K	6/02	
A 6 1 Q	1/00	
A 6 1 Q	11/00	
A 6 1 P	1/02	
A 6 1 P	31/04	
A 6 1 K	8/41	
A 6 1 K	8/84	
A 6 1 K	8/58	
A 6 1 K	47/52	
A 6 1 K	47/55	
A 6 1 K	9/06	
A 6 1 K	9/70	
A 6 1 L	15/20	1 0 0
A 6 1 L	15/22	1 0 0
A 6 1 L	15/44	1 0 0
A 6 1 L	31/08	
A 6 1 L	31/10	
A 6 1 K	45/00	

【手続補正書】

【提出日】令和2年2月19日(2020.2.19)

【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

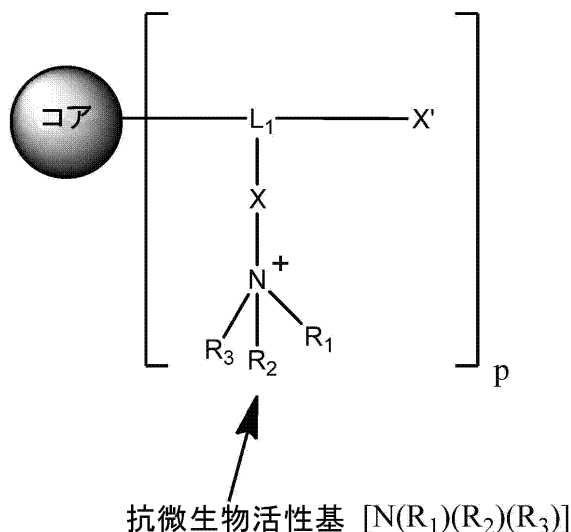
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記の構造式(1)で表される正荷電粒子。

【化1】



式中、

前記コアは、無機材料、金属、または金属酸化物であり、

L_1 は、リンカーまたは結合であり、

R_1 は、アルキル、テルペノイド、シクロアルキル、アリール、複素環、共役アルキル、アルケニル、アルキニル、またはそれらの任意の組み合わせであり、

R_2 は、アルキル、テルペノイド、シクロアルキル、アリール、複素環、共役アルキル、アルケニル、アルキニル、またはそれらの任意の組み合わせであり、

R_3 は、存在しないか、あるいは、水素、アルキル、テルペノイド部分、シクロアルキル、アリール、複素環、共役アルキル、アルケニル、アルキニル、またはそれらの任意の組み合わせであり、

X は、結合、アルキル、アルケニル、またはアルキニルであり、

X' は、存在しないか、あるいは、水素であり、

p は、前記コアの表面の1平方nm(nm^2)当たりの鎖の数であり、

前記抗微生物活性基は、前記コアの表面の1平方nm(nm^2)当たり0.001ないし20個の表面密度で存在し、

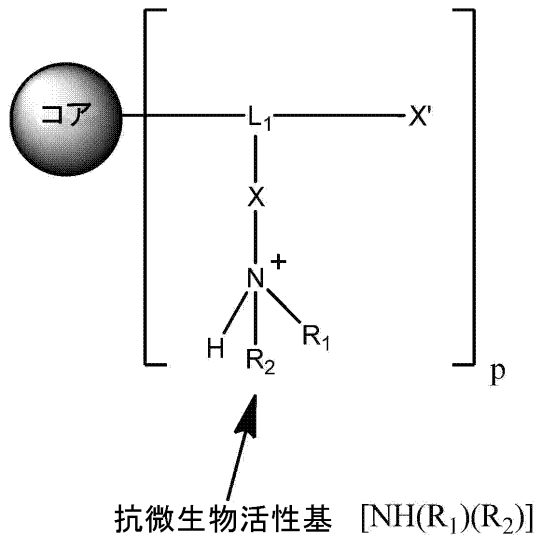
L_1 及び X が結合である場合には、窒素が前記コアの必須部分であり、

R_1 、 R_2 、及び R_3 のうちの少なくとも1つは、少なくとも4個の炭素有するアルキル、共役アルキル、アルケニル、もしくはアルキニル、または、少なくとも6個の炭素有するテルペノイド部分、シクロアルキル、アリール、もしくは複素環である。

【請求項2】

当該粒子が、下記の構造式(3)で表されるか、またはその塩である、請求項1に記載の粒子。

【化 3】



【請求項 3】

前記 R_1 がテルペノイド部分であるか、または前記 R_2 が $\text{C}_1 - \text{C}_4$ アルキルである、
請求項 1 または 2 に記載の粒子。

【請求項 4】

前記コアが無機材料であり、

前記 R_3 が、水素、アルキル、テルペノイド部分、シクロアルキル、アリール、複素環、
共役アルキル、アルケニル、アルキニル、またはそれらの任意の組合せであり、

前記 R_1 がテルペノイド部分である、請求項 1 ないし 3 のいずれかに記載の粒子。

【請求項 5】

前記無機材料が、シリカ、ケイ酸塩 (SiO_4^{4-})、表面活性化金属、または金属酸
化物から選択される、請求項 1 ないし 4 のいずれかに記載の粒子。

【請求項 6】

前記コアが、低多孔性を有する中実均質形態、または 1 ないし 100 nm の孔径を有す
る多孔質形態を有する、請求項 1 ないし 5 のいずれかに記載の粒子。

【請求項 7】

前記 L_1 が、

少なくとも 1 つのシラン部分で置換された $\text{C}_1 - \text{C}_{18}$ アルキレン、

少なくとも 1 つのリン酸部分で置換された $\text{C}_1 - \text{C}_{18}$ アルキレン、

少なくとも 1 つの無水物部分で置換された $\text{C}_1 - \text{C}_{18}$ アルキレン、

少なくとも 1 つのカルボン酸部分で置換された $\text{C}_1 - \text{C}_{18}$ アルキレン、及び

少なくとも 1 つのグリシジル部分で置換された $\text{C}_1 - \text{C}_{18}$ アルキレンからなる群より

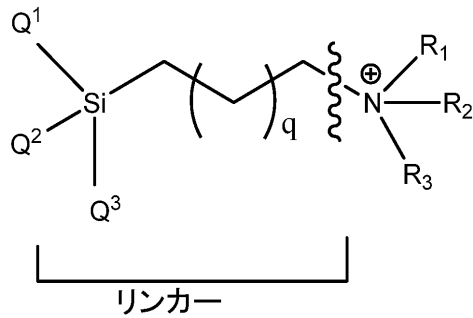
選択されるリンカーである、

請求項 1 ないし 6 のいずれかに記載の粒子。

【請求項 8】

前記リンカーが、下記の構造式 (IA) で表され、前記無機コアを前記抗微生物活性基
に対して結合させるために使用され、かつ、シリコン部分を介して前記コアの表面に対
して化学的に結合されている、請求項 7 に記載の粒子。

【化 5】



(IA)

式中、

Q^1 、 Q^2 、及び Q^3 は、互いに独立して、アルコキシ、メチル、エチル、水素、スルホン酸塩、及びハロゲン化物からなる群より選択され、かつ、 Q^1 、 Q^2 、及び Q^3 のうちの少なくとも1つは、エトキシ、メトキシ、スルホン酸塩（例えば、メシル、トシル）、及びハロゲン化物から選択され、

q は、1 ないし 16 の整数であり、

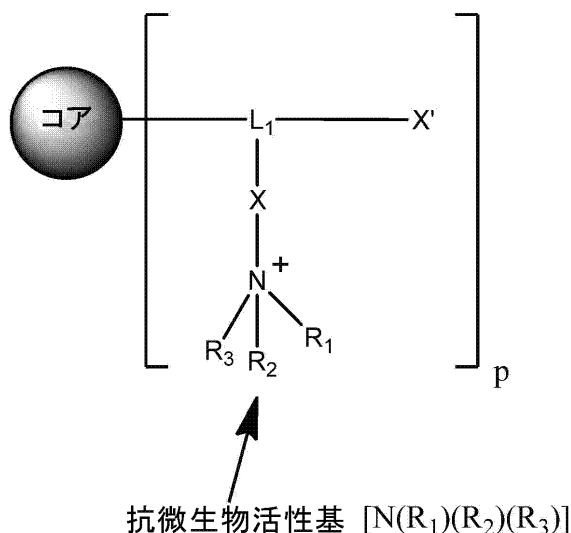
R_1 及び R_2 は、互いに独立して、直鎖または分枝鎖 $C_1 - C_{24}$ アルキル、テルペノイド、シクロアルキル、アリール、複素環、共役 $C_1 - C_{24}$ アルケニル、 $C_1 - C_{24}$ アルケニル、 $C_1 - C_{24}$ アルキニル、またはそれらの任意の組み合わせであり、

R_3 は、存在しないか、あるいは、直鎖または分枝鎖 $C_1 - C_{24}$ アルキル、テルペノイド、シクロアルキル、アリール、複素環、共役 $C_1 - C_{24}$ アルケニル、 $C_1 - C_{24}$ アルケニル、 $C_1 - C_{24}$ アルキニル、またはそれらの任意の組み合わせである。

【請求項 9】

下記の構造式 (1) で表される正荷電粒子。

【化 1】



(1)

式中、

前記コアは、有機ポリマー材料であり、

L_1 は、リンカーまたは結合であり、

R_1 は、アルキル、テルペノイド部分、シクロアルキル、アリール、複素環、共役アルキル、アルケニル、アルキニル、またはそれらの任意の組み合わせであり、

R_2 は、アルキル、テルペノイド部分、シクロアルキル、アリール、複素環、共役アルキル、アルケニル、アルキニル、またはそれらの任意の組み合わせであり、

R_3 は、存在しないか、あるいは、水素、アルキル、テルペノイド部分、シクロアルキル、アリール、複素環、共役アルキル、アルケニル、アルキニル、またはそれらの任意の組み合わせであり、

X は、結合、アルキル、アルケニル、またはアルキニルであり、

X' は、存在しないか、あるいは、水素であり、

p は、前記コアの表面の 1 nm^2 (nm^2) 当たりの鎖の数であり、

前記抗微生物活性基は、前記コアの表面の 1 nm^2 (nm^2) 当たり 0.001 ないし 20 個の表面密度で存在し、

L_1 及び X が結合である場合には、窒素が前記コアの必須部分であり、

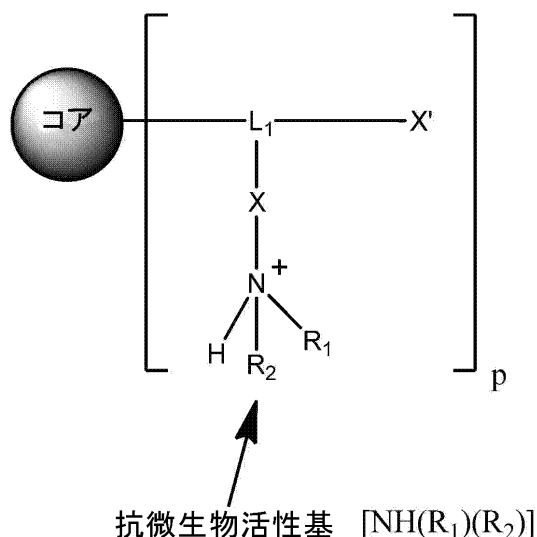
R_1 、 R_2 、及び R_3 のうちの少なくとも 1 つは、アルキル、共役アルキル、アルケニル、もしくは少なくとも 4 個の炭素を有するアルキニル、または、テルペノイド部分、シクロアルキル、アリール、もしくは少なくとも 6 個の炭素を有する複素環であり、

R_1 、 R_2 、及び R_3 のうちの少なくとも 1 つは、テルペノイド部分である。

【請求項 10】

当該粒子が、下記の構造式 (3) で表されるか、またはその塩である、請求項 9 に記載の粒子。

【化 3】



【請求項 11】

前記有機ポリマーコアが、

(a) ポリエチレンジアミン (PEI)、ポリビニルアミン (PVA)、ポリ (アリルアミン) (PAA)、ポリ (アミノエチルアクリレート)、アルキルアミノペンディング基を有するポリペプチド、及びキトサンからなる群より選択される少なくとも 1 つの脂肪族ポリマー、

(b) アミノメチル化スチレンポリマー、及び芳香族ポリエステルからなる群より選択される少なくとも 1 つの芳香族ポリマー、または

それらの任意の組み合わせであり、

前記抗微生物活性基が、前記有機ポリマーコアに対して、直接的にまたはリンカーを介して結合されている、請求項 9 または 10 に記載の粒子。

【請求項 12】

前記 L_1 が、

(a) 少なくとも 1 つのカルボキシル部分で置換され、カルボキシル末端が前記コアに結合されている C_{1-8} アルキレン、

(b) ジハロアルキレンから誘導された C_{1-8} アルキレン、及び

(c) 4、4 - ビフェノール、ジ安息香酸、ジ安息香酸ハロゲン化物、ジ安息香酸スルホン酸、テレフタル酸、テトラフタル酸ハロゲン化物、またはテレフタル酸スルホン酸から誘導された芳香族分子、

からなる群より選択されるリンカーである、請求項 9 ないし 11 のいずれかに記載の粒子。

【請求項 13】

前記有機ポリマーコアが架橋剤により架橋された、請求項 9 ないし 12 のいずれかに記載の粒子。

【請求項 14】

前記有機ポリマーコア中のアミン基の少なくとも 10 % が、抗微生物活性を有する第三級アミン基または第四級アンモニウム基、あるいはそれらの塩である、請求項 9 ないし 13 のいずれかに記載の粒子。

【請求項 15】

前記抗微生物活性基が、前記コアの表面の 1 平方 nm 当たり 0.001 ないし 4 個の表面密度で存在する、請求項 1 ないし 14 のいずれかに記載の粒子。

【請求項 16】

当該球状粒子が、5 ないし 100、000 nm の直径、及び 10 ないし 50、000 nm の直径を有する、請求項 1 ないし 15 のいずれかに記載の粒子。

【請求項 17】

前記テルペノイド部分が、
シンナムアルデヒド、ケイ皮酸、またはシンナミルアルコールから誘導されたシンナモイル基、

ショウノウ、ボルニルハロゲン化物、またはボルニルアルコールから誘導されたボルニル基、または

ペリルアルデヒドから誘導されたテルペノイド基である、
請求項 1 ないし 16 のいずれかに記載の粒子。

【請求項 18】

細菌を阻害するか、またはバイオフィルム形成を阻害または防止するために使用される、請求項 1 ないし 17 のいずれかに記載の粒子または該粒子を含む医薬組成物。

【請求項 19】

前記粒子または組成物が口腔内に適用することを目的としており、
前記組成物が、歯磨き剤、口内洗浄液、つまようじ、デンタルフロス、衛生処置後ドレッシングまたはゲル、粘膜接着性歯磨き剤として製剤化される、及び / または口腔の硬質または軟質の組織、または人工の表面に適用される、請求項 18 に記載の粒子または医薬組成物。

【請求項 20】

前記粒子または組成物が、口腔内または医療機器に適用することを目的としており、
歯科用接着剤、虫歯の窩洞に充填される歯科用修復複合材料、根管治療に使用され根管内に充填される歯内充填材料、暫定的及び最終的な歯の修復または歯の置換に使用される歯科用修復材料、歯科用インレー、歯科用アンレー、クラウン、部分義歯、総義歯、歯科用インプラント、歯科インプラントアバットメント、クラウンブリッジ、アンレー、部分義歯、及び、歯列矯正器具を歯のエナメル質及び象牙質に対して恒久的に固定するために使用されるセメントからなる群より選択される材料として製剤化されるか、または該材料に適用される、請求項 18 に記載の粒子または医薬組成物。

【請求項 21】

組成物であって、
請求項 1 ないし 20 のいずれかに記載の粒子が複数埋封された液体または固体マトリックスを含み、

前記粒子は、共有結合相互作用または非共有結合相互作用によって前記マトリックス中に埋封されている、組成物。

【請求項 2 2】

前記粒子が、前記マトリックスの外面上に、該外面の 1 平方 μm 当たり 0 . 1 ないし 1 0 0 個の表面密度で均一に分布している、請求項 2 1 に記載の組成物。

【請求項 2 3】

当該組成物が医薬組成物であり、
クリーム、軟膏、ペースト、包帯、及びゲルからなる群より選択される形態を有するか
、または
局所適用若しくは投与用に製剤化されている、
請求項 2 1 または 2 2 に記載の組成物。

【請求項 2 4】

当該組成物が局所適用若しくは投与用に製剤化された医薬組成物である、
請求項 2 3 に記載の組成物。