

【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26年2月6日(2014.2.6)

【公表番号】特表2013-514977(P2013-514977A)

【公表日】平成25年5月2日(2013.5.2)

【年通号数】公開・登録公報2013-021

【出願番号】特願2012-544838(P2012-544838)

【国際特許分類】

A 6 1 K	9/14	(2006.01)
A 6 1 K	45/06	(2006.01)
A 6 1 K	47/48	(2006.01)
A 6 1 K	47/34	(2006.01)
A 6 1 K	33/24	(2006.01)
A 6 1 K	31/282	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	13/08	(2006.01)
A 6 1 K	31/337	(2006.01)
A 6 1 K	31/4745	(2006.01)
A 6 1 K	31/416	(2006.01)
A 6 1 K	31/5377	(2006.01)
A 6 1 K	31/355	(2006.01)
A 6 1 K	31/19	(2006.01)
A 6 1 K	31/422	(2006.01)
A 6 1 K	31/05	(2006.01)
A 6 1 K	31/215	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	3/02	(2006.01)
B 8 2 Y	5/00	(2011.01)
B 8 2 Y	40/00	(2011.01)

【F I】

A 6 1 K	9/14	Z N M
A 6 1 K	45/06	
A 6 1 K	47/48	
A 6 1 K	47/34	
A 6 1 K	33/24	
A 6 1 K	31/282	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	13/08	
A 6 1 K	31/337	
A 6 1 K	31/4745	
A 6 1 K	31/416	
A 6 1 K	31/5377	
A 6 1 K	31/355	
A 6 1 K	31/19	
A 6 1 K	31/422	
A 6 1 K	31/05	
A 6 1 K	31/215	
A 6 1 P	43/00	1 2 3
A 6 1 P	3/02	1 0 9

B 8 2 Y 5/00  
B 8 2 Y 40/00

【手続補正書】

【提出日】平成25年12月13日(2013.12.13)

【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】

複数の第1の治療的、予防的または診断的な活性物質と結合したペンダント官能基を有する1種またはそれ以上のポリマーを含むポリマーマトリックスを含むナノ粒子であって、結合した第1の活性物質が定められた量および放出速度でナノ粒子から放出される、ナノ粒子。

【請求項2】

ポリマーマトリックスが2種またはそれ以上の活性物質を含む、請求項1に記載のナノ粒子。

【請求項3】

1種またはそれ以上の活性物質が少なくとも2時間の対象の循環中での半減期を有する、請求項1または請求項2に記載のナノ粒子。

【請求項4】

37で中性の水性溶液に粒子を懸濁してから最初の2時間の内に1種またはそれ以上の活性物質の各々の50%未満が放出される、請求項1ないし請求項3のいずれかに記載のナノ粒子。

【請求項5】

1種またはそれ以上のポリマーが生物分解性ポリマーである、請求項1ないし請求項4のいずれかに記載のナノ粒子。

【請求項6】

1種またはそれ以上の活性物質がペンドント官能基を有する疎水性生物分解性ポリマーに結合している、請求項1ないし請求項5のいずれかに記載のナノ粒子。

【請求項7】

1種またはそれ以上の活性物質が両親媒性生物分解性ポリマーに結合している、請求項1ないし請求項5のいずれかに記載のナノ粒子。

【請求項8】

結合していない生物分解性ポリマーを含む、請求項1ないし請求項7のいずれかに記載のナノ粒子。

【請求項9】

第1の活性物質および第2の活性物質を含む疎水性ポリマーコア、および、表面に露出した親水層をさらに含む、請求項1ないし請求項8のいずれかに記載のナノ粒子。

【請求項10】

ポリマーにペンドント官能基を介して結合している標的化物質を含む、請求項1ないし請求項9のいずれかに記載のナノ粒子。

【請求項11】

ポリマーが、比較的疎水性の第1末端および比較的親水性の第2末端を有するブロックコポリマーであり、疎水性コアが、第1の活性物質に結合したブロックコポリマーの第1末端を含み、親水層が、ブロックコポリマーの第2末端を含む、請求項1ないし請求項10のいずれかに記載のナノ粒子。

【請求項12】

親水層が、疎水性ポリマーコアと相互作用する相対的に疎水性の末端および表面に露出した相対的に親水性の末端を各々含む複数の両親媒性ブロックコポリマーを含む、請求項9または請求項10に記載のナノ粒子。

【請求項13】

標的化物質をさらに含む、請求項1ないし請求項12のいずれかに記載のナノ粒子。

【請求項14】

1種またはそれ以上の活性物質が、低分子、薬物、プロドラッグおよび薬物誘導体からなる群から独立して選択される、請求項1ないし請求項13のいずれかに記載のナノ粒子。

【請求項15】

1種またはそれ以上の活性物質が、各々、パクリタキセルまたはドセタキセルおよびゲフィチニブ；ゲフィチニブおよびパクリタキセルまたはドセタキセル；オキサリプラチン（またはオキサリプラチンプロドラッグ）およびイリノテカン；イリノテカンおよびオキサリプラチン（またはオキサリプラチンプロドラッグ）；パクリタキセルおよびツバシン；ツバシンおよびパクリタキセル；ロニダミン、ジクロロ酢酸、アルファ-コハク酸トコフェロール、ベツリン酸またはレスベラトロールおよびPt(IV)ヘキサノエート；Pt(IV)ヘキサノエートおよびロニダミン、ジクロロ酢酸、アルファ-コハク酸トコフェロール、ベツリン酸またはレスベラトロール；アルファ-コハク酸トコフェロールまたはジャスモン酸メチルおよびドセタキセル；または、ドセタキセルおよびアルファ-コハク酸トコフェロールまたはジャスモン酸メチルである、請求項1ないし請求項14のいずれかに記載のナノ粒子。

【請求項16】

少なくとも2種の活性物質を含むナノ粒子の製造方法であって、  
少なくとも1種の活性物質を提供すること；  
少なくとも1種の活性物質またはそのプロドラッグもしくは誘導体を、ペンダント官能基を有するポリマーに結合させること；  
結合していない活性物質を除去すること；および、  
結合した第1の活性物質をナノ粒子内に含む粒子をナノ沈降すること、  
を含む方法。

【請求項17】

親水性である第1の活性物質および疎水性である第2の活性物質を含む、請求項1ないし請求項15のいずれかに記載のナノ粒子。

【請求項18】

ポリマーが両親媒性ポリマーである、請求項1ないし請求項15および請求項17のいずれかに記載のナノ粒子。

【請求項19】

ポリマーが、ポリジオキサン、ポリヒドロキシアルカノエート、ポリヒドロキシブチレート、ポリ(グリセロールセバシン酸)、ポリ(乳酸)、ポリ(グリコール酸)、ポリ(オルトエステル)、ポリ(カプロラクトン)、ポリリジン、ポリ(エチレンイミン)、ポリ(アクリル酸)、ポリ(ウレタン)、ポリ(酸無水物)、ポリ(エステル)、ポリ(ラクチド-コ-グリコリド)、ポリ(アルキレングリコール)およびこれらのコポリマーまたは誘導体からなる群から選択される、請求項1ないし請求項15、請求項17および請求項18のいずれかに記載のナノ粒子。

【請求項20】

結合していない活性物質がナノ粒子中に存在しない、請求項1ないし請求項15および請求項17ないし請求項19のいずれかに記載のナノ粒子。

【請求項21】

結合したポリマーと共に1種またはそれ以上の異なる活性物質を提供し、結合したポリマーと混合された結合していない活性物質を有するナノ粒子を形成することをさらに含む、請求項16に記載の方法。

**【請求項 22】**

ナノ粒子に結合しているか、または、ナノ粒子を形成するポリマーに結合している標的化物質を提供することをさらに含む、請求項 16 または請求項 21 に記載の方法。