

【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】

3 7 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 5 0 % 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ダ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】

ポリマーにペンダ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、ポリジオキサノン、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（エチレンジイミン）、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 2 2】

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 1 6 または請求項 2 1 に記載の方法。