

【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14日(2013.2.14)

【公開番号】特開2011-256203(P2011-256203A)

【公開日】平成23年12月22日(2011.12.22)

【年通号数】公開・登録公報2011-051

【出願番号】特願2011-199455(P2011-199455)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/7088	(2006.01)
A 6 1 K	31/7105	(2006.01)
A 6 1 K	9/16	(2006.01)
A 6 1 K	47/32	(2006.01)
A 6 1 K	47/42	(2006.01)
A 6 1 K	48/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/02	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	1/16	(2006.01)
A 6 1 P	3/00	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	5/14	(2006.01)
A 6 1 P	7/04	(2006.01)
A 6 1 P	7/06	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)
A 6 1 P	17/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/06	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	21/00	(2006.01)
A 6 1 P	21/04	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	37/02	(2006.01)
C 1 2 N	15/09	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/7088	Z N A
A 6 1 K	31/7105	
A 6 1 K	9/16	
A 6 1 K	47/32	
A 6 1 K	47/42	
A 6 1 K	48/00	
A 6 1 P	1/02	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	1/16	
A 6 1 P	3/00	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	5/14	
A 6 1 P	7/04	
A 6 1 P	7/06	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	17/00	

A 6 1 P 17/06  
A 6 1 P 19/02  
A 6 1 P 21/00  
A 6 1 P 21/04  
A 6 1 P 25/00  
A 6 1 P 29/00  
A 6 1 P 29/00 1 0 1  
A 6 1 P 37/02  
C 1 2 N 15/00 A

**【手続補正書】**

**【提出日】**平成24年12月20日(2012.12.20)

**【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】**

一種以上の核酸を含有し、平均粒子サイズが50マイクロメートル以下である、マイクロスフェアであって、ここで、マイクロスフェアの形成において使用される水溶性ポリマーが該マイクロスフェアの実質的な部分を形成しない、マイクロスフェア。

**【請求項2】**

一種以上の核酸を含有し、平均粒子サイズが50マイクロメートル以下である、マイクロスフェアであって、ここで、該マイクロスフェアの形成において使用される水溶性ポリマーが、該マイクロスフェアの支持構造を形成しない、マイクロスフェア。

**【請求項3】**

前記核酸が、前記マイクロスフェアの少なくとも20重量%を構成する、請求項1または請求項2に記載のマイクロスフェア。

**【請求項4】**

前記核酸が、前記マイクロスフェアの少なくとも30重量%を構成する、請求項1または請求項2に記載のマイクロスフェア。

**【請求項5】**

前記核酸が、前記マイクロスフェアの少なくとも50重量%を構成する、請求項1または請求項2に記載のマイクロスフェア。

**【請求項6】**

前記核酸が、前記マイクロスフェアの少なくとも70重量%を構成する、請求項1または請求項2に記載のマイクロスフェア。

**【請求項7】**

前記核酸が、前記マイクロスフェアの少なくとも90重量%を構成する、請求項1または請求項2に記載のマイクロスフェア。

**【請求項8】**

前記核酸が、前記マイクロスフェアの少なくとも95重量%を構成する、請求項1または請求項2に記載のマイクロスフェア。

**【請求項9】**

前記マイクロスフェアが、少なくとも2種の異なる核酸を含有する、請求項1または請求項2に記載のマイクロスフェア。

**【請求項10】**

前記核酸の少なくとも1つがオリゴヌクレオチドである、請求項1または請求項2に記載のマイクロスフェア。

**【請求項 1 1】**

前記マイクロスフェアが、少なくとも 2 種の異なるオリゴヌクレオチドを含有する、請求項 1 0 に記載のマイクロスフェア。

**【請求項 1 2】**

前記マイクロスフェアが、2 マイクロメートル以下の平均粒子サイズおよび 0 . 0 4 マイクロメートル～8 マイクロメートルの粒子サイズ分布を有する、請求項 1 または請求項 2 に記載のマイクロスフェア。

**【請求項 1 3】**

前記マイクロスフェアが、2 マイクロメートル以下の平均粒子サイズおよび 0 . 0 4 マイクロメートル～8 マイクロメートルの粒子サイズ分布を有する、請求項 9 に記載のマイクロスフェア。

**【請求項 1 4】**

前記マイクロスフェアが、2 マイクロメートル以下の平均粒子サイズおよび 0 . 0 4 マイクロメートル～8 マイクロメートルの粒子サイズ分布を有する、請求項 1 0 に記載のマイクロスフェア。

**【請求項 1 5】**

前記マイクロスフェアが、1 マイクロメートル以下の平均粒子サイズおよび 0 . 2 マイクロメートル～4 マイクロメートルの粒子サイズ分布を有する、請求項 1 または請求項 2 に記載のマイクロスフェア。

**【請求項 1 6】**

前記マイクロスフェアが、1 マイクロメートル以下の平均粒子サイズおよび 0 . 2 マイクロメートル～4 マイクロメートルの粒子サイズ分布を有する、請求項 9 に記載のマイクロスフェア。

**【請求項 1 7】**

前記マイクロスフェアが、1 マイクロメートル以下の平均粒子サイズおよび 0 . 2 マイクロメートル～4 マイクロメートルの粒子サイズ分布を有する、請求項 1 0 に記載のマイクロスフェア。

**【請求項 1 8】**

前記核酸が、DNA、DNA オリゴヌクレオチド、RNA オリゴリボヌクレオチド、DNA / RNA ハイブリッドオリゴヌクレオチド、mRNA、siRNA、または tRNA、およびこれらの組合せからなる群より選択される、請求項 1 または請求項 2 に記載のマイクロスフェア。

**【請求項 1 9】**

前記マイクロスフェアが懸濁液中に存在する、請求項 1 または請求項 2 に記載のマイクロスフェア。

**【請求項 2 0】**

前記マイクロスフェアが乾燥粉末処方物中に存在する、請求項 1 または請求項 2 に記載のマイクロスフェア。

**【請求項 2 1】**

被験体を処置するための組成物であって、該組成物は、該被験体への投与に適した請求項 1 または請求項 2 に記載のマイクロスフェアを含む、組成物。

**【請求項 2 2】**

請求項 2 1 に記載の組成物であって、前記マイクロスフェアの投与経路が、静脈内経路、筋肉内経路、皮下経路、局所経路、皮内経路、腹腔内経路、経口経路、肺経路、眼経路、鼻経路、口腔内経路、膣内経路、直腸経路、およびこれらの組合せからなる群より選択される、組成物。

**【請求項 2 3】**

核酸を溶媒で溶解して組成物を形成する工程であって、少なくとも一つの水溶性ポリマーが該溶媒に加えられる、工程、そして該組成物からマイクロスフェアを形成する工程であって、該マイクロスフェアは、冷却の間に形成される、工程によって、該核酸を含む生物

学的に活性なマイクロスフェアを生成するためのプロセスであって、該マイクロスフェアは、50マイクロメートル以下の平均粒子サイズを有し、そして、該水溶性ポリマーが該マイクロスフェアの実質的な部分を形成しない、プロセス。

**【請求項24】**

少なくとも1種のポリカチオンが前記溶媒に添加される、請求項23に記載のプロセス。

**【請求項25】**

前記ポリカチオンが、ポリ-リジン、ポリ-オルニチン、ポリ-エチレン-イミン、プロラミン、プロタミン、ポリビニルピロリドン、ポリ-アルギニン、ビニルアミン、およびこれらの組合せからなる群より選択される、請求項24に記載のプロセス。

**【請求項26】**

前記ポリカチオンはポリ-リジンである、請求項25に記載のプロセス。

**【請求項27】**

前記ポリカチオンはポリ-オルニチンである、請求項25に記載のプロセス。

**【請求項28】**

少なくとも1種のポリアニオンが前記溶媒に添加される、請求項23に記載のプロセス。

**【請求項29】**

少なくとも1種のポリマーが前記溶媒に添加される、請求項23に記載のプロセス。

**【請求項30】**

前記ポリマーが、多糖類、ポリエチレングリコール、ポリビニルピロリドン、およびこれらの組合せからなる群より選択される、請求項29に記載のプロセス。

**【請求項31】**

前記形成工程が、前記組成物への架橋剤の添加と共に行われる、請求項23に記載のプロセス。

**【請求項32】**

前記形成工程が、前記組成物へのエネルギーの添加と共に行われる、請求項23に記載のプロセス。

**【請求項33】**

前記形成工程が、前記組成物中のポリカチオン成分の非存在下において行われる、請求項23に記載のプロセス。

**【請求項34】**

前記形成工程が、前記組成物中の架橋成分の非存在下において行われる、請求項23に記載のプロセス。

**【請求項35】**

前記形成工程が、前記組成物中のポリアニオン成分の非存在下において行われる、請求項23に記載のプロセス。

**【請求項36】**

前記形成工程が、前記組成物から前記マイクロスフェアを形成するためのエネルギー源を適用せずに行われる、請求項23に記載のプロセス。