

【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 10 月 30 日 (2014.10.30)

【公表番号】特表 2014-523854 (P2014-523854A)

【公表日】平成 26 年 9 月 18 日 (2014.9.18)

【年通号数】公開・登録公報 2014-050

【出願番号】特願 2014-504057 (P2014-504057)

【国際特許分類】

A 6 1 K 49/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/127 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 49/00 C

A 6 1 K 9/127

【手続補正書】

【提出日】平成 25 年 12 月 4 日 (2013.12.4)

【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】

リポソーム組成物であって：

第一のリン脂質；

コレステロール；

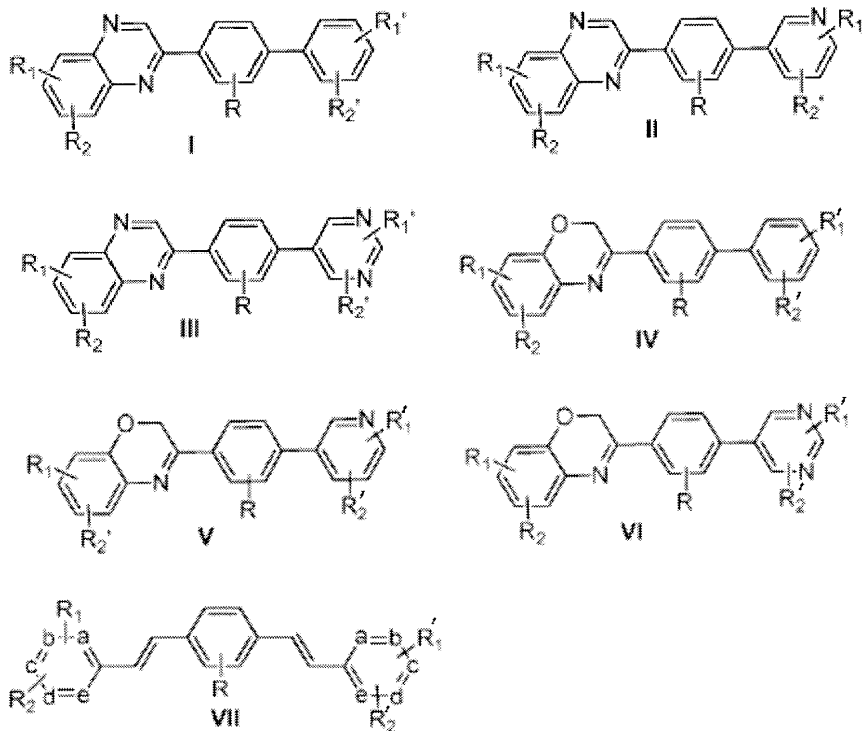
ポリマーを用いて誘導体化された第二のリン脂質；及び

第三のリン脂質であって、前記第三のリン脂質は：

リン脂質 - ポリマー - 芳香族化合物結合体であり、前記リン脂質 - ポリマー - 芳香族化合物複合体中の前記芳香族化合物は、式 I、II、III、IV、V、VI 又は VII

：

【化 1】



(式中、 R 、 R_1 、 R_2 、 R_1' 及び R_2' は、独立して、 H 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、アルキル、アリール、 OH 、 O -アルキル、 O -アリール、 NH_2 、 NH -アルキル、 N -ジアルキル、カルボキシ、スルホニル、カルバモイル、又はグリコシルであり；

a 、 b 、 c 、 d 、 e は、独立して、 C 、 N 、 O 又は S である)

の内の一つにより表される、第三のリン脂質を含む膜：及び、

前記膜をカプセル化するか又は前記膜へ結合すること内の少なくとも一つによる、非放射性コントラスト強調剤を含む、リポソーム組成物。

【請求項 2】

前記リン脂質 - ポリマー - 前記芳香族化合物結合体中の前記芳香族化合物が、式 I、I I、I I I、I V、V、V I又はV I Iの内の一によって表され；

R は H 又はメトキシである、

請求項 1 に記載のリポソーム組成物。

【請求項 3】

前記リン脂質 - ポリマー - 前記芳香族化合物結合体中の前記芳香族化合物が、式 I、I I、I I I、I V、V、V I又はV I Iの内の一によって表され；

R_1 は H 又はメトキシである、

請求項 1 に記載のリポソーム組成物。

【請求項 4】

前記リン脂質 - ポリマー - 前記芳香族化合物結合体中の前記芳香族化合物が、式 I、I I、I I I、I V、V、V I又はV I Iの内の一によって表され；

R_2 は H 、 O -アルキル又は OH である、

請求項 1 に記載のリポソーム組成物。

【請求項 5】

前記リン脂質 - ポリマー - 前記芳香族化合物結合体中の前記芳香族化合物が、式 I、I I、I I I、I V、V、V I又はV I Iの内の一によって表され；

R 及び R_2 はそれぞれ H である、

請求項 1 に記載のリポソーム組成物。

【請求項 6】

前記リン脂質 - ポリマー - 前記芳香族化合物結合体中の前記芳香族化合物が、式 I、I

I、III、IV、V、VI又はVIIの内の一つによって表され；

R、R₁及びR₂はそれぞれHである、

請求項1に記載のリボソーム組成物。

【請求項7】

前記リン脂質 - ポリマー - 前記芳香族化合物結合体中の前記芳香族化合物が、式I、II、III、IV、V、VI又はVIIの内の一つによって表され；

a、b、c、d及びeはそれぞれCである、

請求項1に記載のリボソーム組成物。

【請求項8】

前記リン脂質 - ポリマー - 前記芳香族化合物結合体中の前記芳香族化合物が、式I、II、III、IV、V、VI又はVIIの内の一つによって表され；R₁'はH、OH又はメトキシであり、R₂'はH、ジメチルアミノ又はメトキシであるか、又は、

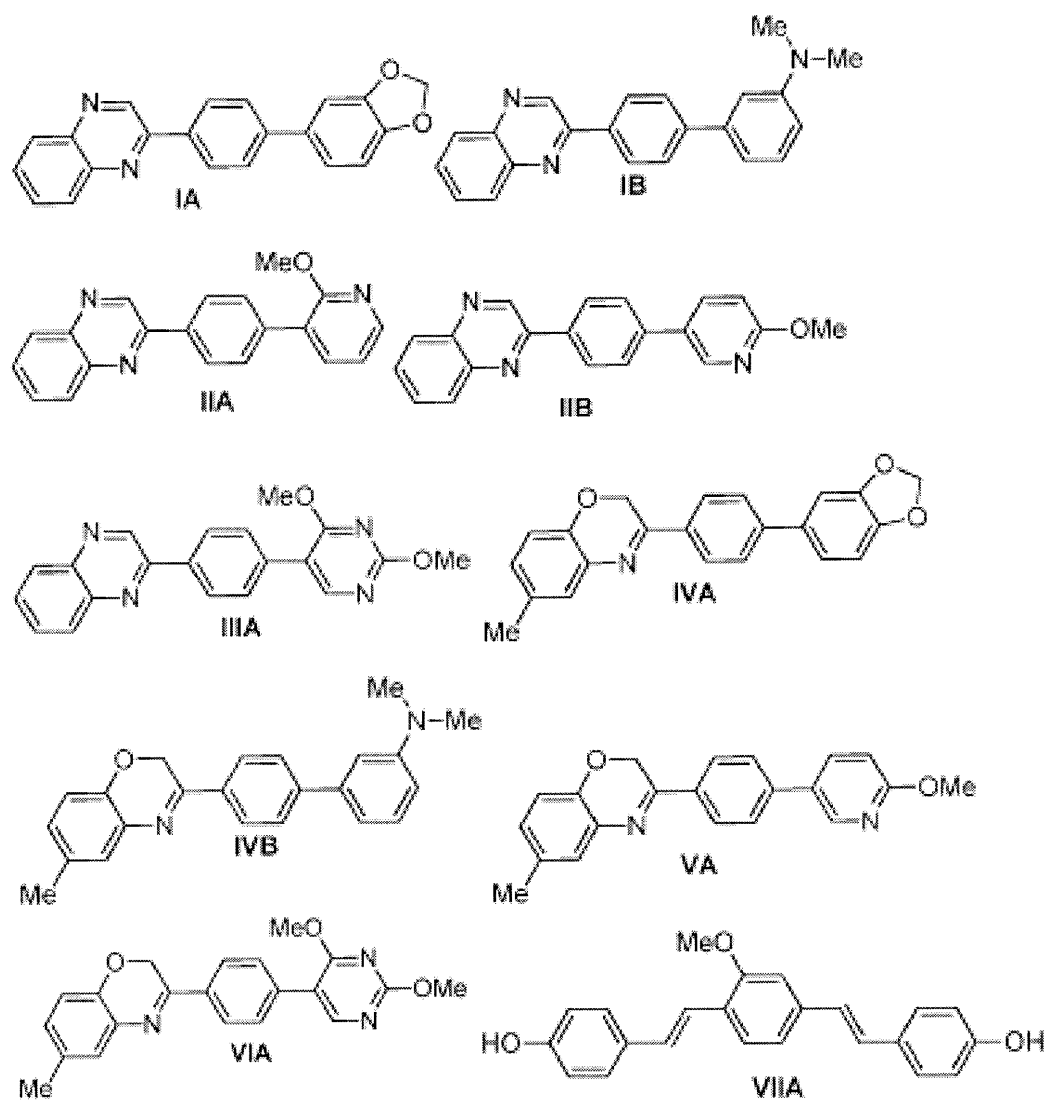
前記リン脂質 - ポリマー - 前記芳香族化合物結合体中の前記芳香族化合物が、式I又はIVの内の一つによって表され；R₁'と一緒に、リンカー - OCH₂O - である、

請求項1に記載のリボソーム組成物。

【請求項9】

前記リン脂質 - ポリマー - 前記芳香族化合物結合体中の前記芳香族化合物が、式IA、IB、IIA、IIB、IIIA、IVA、IVB、VA、VIA又はVIIAの内の一つによって表される；

【化 2】



請求項 1 に記載のリボソーム組成物。

【請求項 10】

前記リン脂質 - ポリマー - 芳香族化合物結合体が、以下：

[illegible]

n は約 10 ~ 約 100 である、

請求項 1 に記載のリポソーム組成物。

【請求項 1 1】

前記 n が約 30 ~ 60 である、請求項 10 に記載のリポソーム組成物。

【請求項 1 2】

前記非放射性コントラスト強調剤がヨウ素化コントラスト強調剤を含む、請求項 1 に記載のリポソーム組成物。

【請求項 1 3】

前記非放射性コントラスト強調剤がイオジキサノールを含む、請求項 1 に記載のリポソーム組成物。

【請求項 1 4】

前記非放射性コントラスト強調剤がガドニウムキレートを含む、請求項 1 に記載のリポソーム組成物。

【請求項 1 5】

患者におけるアミロイド沈着をイメージング方法であって、前記方法は：

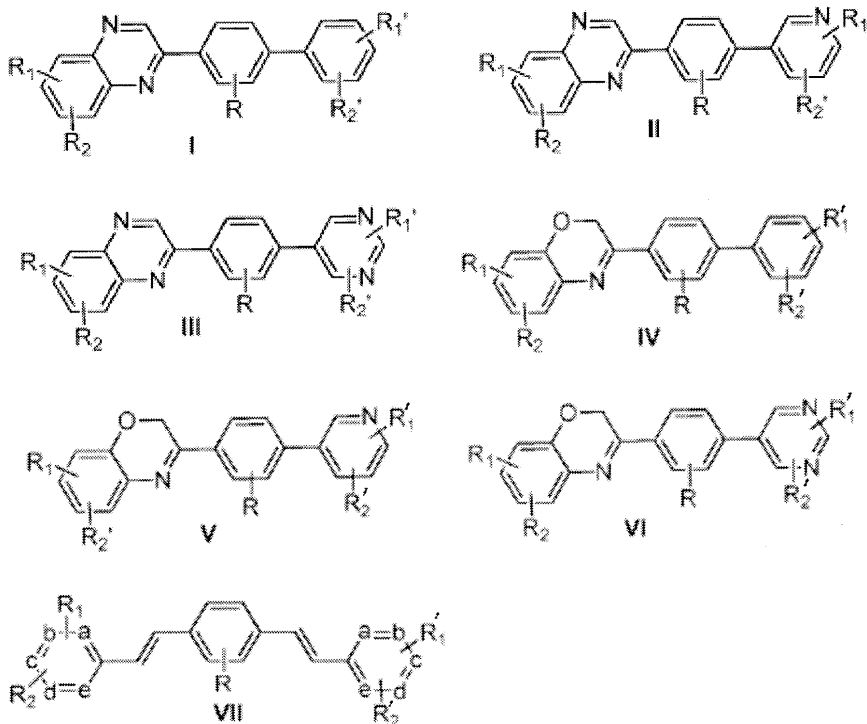
第一のリン脂質；

コレステロール；

ポリマーで誘導体化された第二のリン脂質；及び

第三のリン脂質であって、前記第三のリン脂質は、リン脂質 - ポリマー - 芳香族化合物結合体であり；前記リン脂質 - ポリマー - 芳香族化合物複合体中の前記芳香族化合物は、式 I、II、III、IV、V、VI 又は VII：

【化 4】



(式中、R、R₁、R₂、R₁' 及び R₂' は、独立して、H、F、Cl、Br、I、アルキル、アリール、OH、O - アルキル、O - アリール、NH₂、NH - アルキル、N - ジアルキル、カルボキシ、スルホニル、カルバモイル、又はグリコシルであり；

a, b, c, d, e は、独立して、C、N、O 又は S である)

の内の一つにより表される、第三のリン脂質を含む膜；及び、

前記膜をカプセル化するか、又は前記膜へ結合するかの少なくとも一つによる、非放射性コントラスト強調剤を含む；検出可能な量のリポソーム組成物を前記患者へ導入すること；

前記リポソーム組成物が一つ以上のアミロイド沈着へ関連付けられるのに十分な時間を

与えることと；

前記一つ以上のアミロイド沈着へ関連付けられた前記リボソーム組成物を検出すること；

とを含む、患者におけるアミロイド沈着をイメージング方法。

【請求項 16】

前記非放射性コントラスト強調剤がヨウ素化されたコントラスト強調剤を含む、請求項 15 に記載の方法。

【請求項 17】

前記非放射性コントラスト強調剤がガドリニウムキレートを含む、請求項 15 に記載の方法。

【請求項 18】

前記検出が、コンピュータ断層撮影を用いて検出することを含む、請求項 15 に記載の方法。

【請求項 19】

前記検出が、磁気共鳴イメージングを用いて検出することを含む、請求項 15 に記載の方法。

【請求項 20】

前記リン脂質 - ポリマー - 芳香族化合物結合体は、リン脂質 - ポリマー - 芳香族化合物結合体を含む遊離芳香族化合物よりも炎症が少ない、請求項 15 に記載の方法。

【請求項 21】

前記リン脂質 - ポリマー - 芳香族化合物結合体は、リン脂質 - ポリマー - 芳香族化合物結合体を含む遊離芳香族化合物よりも細胞毒性が少ない、請求項 15 に記載の方法。

【請求項 22】

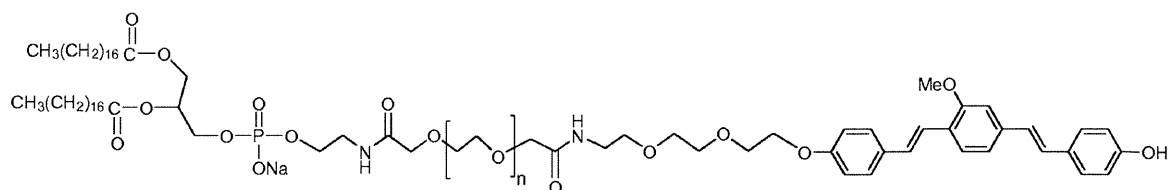
前記リボソーム組成物は

DPPC；

コレステロール；

DSPE-mPEG-2000；及び、

【化 5】



(式中、nは約10～約100)

を含む膜を含み；

前記膜は、イオジキサノールをカプセル化する、
患者の脳へのアミロイド沈着物の画像を撮影するためのリボソーム組成物。