

【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24年1月5日 (2012.1.5)

【公表番号】特表2011-507840(P2011-507840A)

【公表日】平成23年3月10日 (2011.3.10)

【年通号数】公開・登録公報2011-010

【出願番号】特願2010-539387(P2010-539387)

【国際特許分類】

A 6 1 K 47/20 (2006.01)

A 6 1 K 9/14 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 K 9/06 (2006.01)

A 6 1 K 9/107 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 K 9/48 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/51 (2006.01)

A 6 1 K 31/704 (2006.01)

A 6 1 K 31/136 (2006.01)

A 6 1 K 31/4745 (2006.01)

A 6 1 K 31/475 (2006.01)

A 6 1 K 31/473 (2006.01)

A 6 1 K 31/166 (2006.01)

A 6 1 K 31/131 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 47/20

A 6 1 K 9/14

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 9/06

A 6 1 K 9/107

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 9/48

A 6 1 P 35/00

A 6 1 K 9/51

A 6 1 K 31/704

A 6 1 K 31/136

A 6 1 K 31/4745

A 6 1 K 31/475

A 6 1 K 31/473

A 6 1 K 31/166

A 6 1 K 31/131

【手続補正書】

【提出日】平成23年11月10日 (2011.11.10)

【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】**

単独でカチオン性両親媒性物質である少なくとも 1 種の薬学的に活性な物質を投与するためのドラッグ・デリバリー・システムであって、薬学的に活性な物質が、前記薬学的に活性な物質と N - オール - トランス - レチノイルシステイン酸のメチルエステルのナトリウム塩、N - 13 - シス - レチノイルシステイン酸のメチルエステルのナトリウム塩、またはそれらの組合せとの間の複合体の粒子でドラッグ・デリバリー・システム中に存在し、前記複合体の前記粒子は約 100 nm 未満の有効平均粒子サイズを有し、

- 前記複合体の粒子は本質的に非晶質であり；
- 前記複合体の粒子は N - オール - トランス - レチノイルシステイン酸のメチルエステルのナトリウム塩、N - 13 - シス - レチノイルシステイン酸のメチルエステルのナトリウム塩またはそれらの組合せから形成されたナノ粒子中に捕捉されており；
- 前記 N - オール - トランス - レチノイルシステイン酸のメチルエステルのナトリウム塩、N - 13 - シス - レチノイルシステイン酸のメチルエステルのナトリウム塩またはそれらの組合せ対前記複合体の重量の重量対重量比は約 0.5 : 1 ~ 約 20 : 1 の範囲であることを特徴とするドラッグ・デリバリー・システム。

【請求項 2】

前記薬学的に活性な物質は水へのそれ自体の溶解性が少なくとも 4 mg / ml であり、前記複合体は 0.1 mg / ml 未満の水への溶解性を有する非共有結合性の複合体であることを特徴とする請求項 1 に記載のドラッグ・デリバリー・システム。

【請求項 3】

前記複合体は約 50 nm 未満の有効平均粒子サイズを有することを特徴とする請求項 1 または 2 に記載のドラッグ・デリバリー・システム。

【請求項 4】

前記 N - オール - トランス - レチノイルシステイン酸のメチルエステルのナトリウム塩、N - 13 - シス - レチノイルシステイン酸のメチルエステルのナトリウム塩またはそれらの組合せ対前記複合体の重量の重量対重量比は約 1 : 1 ~ 約 10 : 1 の範囲であることを特徴とする、請求項 1 乃至 3 のいずれかに記載のドラッグ・デリバリー・システム。

【請求項 5】

前記他の薬学的に活性な物質は約 100 nm 未満の有効平均粒子サイズを有する粒子形態にあり、

- 前記他の薬学的に活性な物質の粒子は本質的に非晶質であり；
- 前記他の薬学的に活性な物質の粒子は前記複合体の粒子と共に前記ナノ粒子中に捕捉されており；
- 前記 N - オール - トランス - レチノイルシステイン酸のメチルエステルのナトリウム塩、N - 13 - シス - レチノイルシステイン酸のメチルエステルのナトリウム塩またはそれらの組合せ対前記他の薬学的に活性な物質および前記複合体の総合重量の重量対重量比は、約 0.5 : 1 ~ 約 20 : 1 の範囲であることを特徴とする、水へのそれ自体の溶解性が約 100 µg / ml 未満である少なくとも 1 種の他の薬学的に活性な物質を含む請求項 1 または 2 に記載のドラッグ・デリバリー・システム。

【請求項 6】

前記複合体は、約 50 nm 未満の有効平均粒子サイズを有することを特徴とする請求項 5 に記載のドラッグ・デリバリー・システム。

【請求項 7】

前記 N - オール - トランス - レチノイルシステイン酸のメチルエステルのナトリウム塩、N - 13 - シス - レチノイルシステイン酸のメチルエステルのナトリウム塩またはそれらの組合せ対前記複合体の重量の重量対重量比は、約 1 : 1 ~ 約 10 : 1 の範囲であることを特徴とする請求項 5 または 6 に記載のドラッグ・デリバリー・システム。

【請求項 8】

前記他の薬学的に活性な物質は約 50 nm 未満の有効平均粒子サイズを有し、および /

または前記複合体は約 50 nm 未満の有効平均粒子サイズを有することを特徴とする請求項 5 乃至 7 のいずれかに記載のドラッグ・デリバリー・システム。

【請求項 9】

前記薬学的に活性な物質の少なくとも 1 種は細胞毒性化合物または細胞分裂阻害化合物であり、前記細胞毒性化合物または細胞分裂阻害化合物は、プロトン化型のドキソルビシン、ミトキサントロン、エピルビシン、ダウノルビシン、イダルビシン、トポテカン、イリノテカン、ビンブラスチン、ビンクリスチン、ビノレルビン、アムサクリン、プロカルバジン、メクロレタミンまたはそれらの組合せであることを特徴とする請求項 1 乃至 9 のいずれかに記載のドラッグ・デリバリー・システム。

【請求項 10】

前記他の薬学的に活性な物質は、細胞毒性化合物または細胞分裂阻害化合物であることを特徴とする請求項 5 乃至 9 のいずれかに記載のドラッグ・デリバリー・システム。

【請求項 11】

前記細胞毒性化合物または細胞分裂阻害化合物がタキサンである、もしくは前記タキサンはパクリタキセル、ドセタキセル、およびそれらの誘導体の中から選択されることを特徴とする、請求項 10 に記載のドラッグ・デリバリー・システム。

【請求項 12】

前記少なくとも 1 種の薬学的に活性な物質および前記他の薬学的に活性な物質は細胞毒性化合物または細胞分裂阻害化合物であり、前記少なくとも 1 種の薬学的に活性な物質は、プロトン化型のドキソルビシン、ミトキサントロン、エピルビシン、ダウノルビシン、イダルビシン、トポテカン、イリノテカン、ビンブラスチン、ビンクリスチン、ビノレルビン、アムサクリン、プロカルバジン、メクロレタミンまたはそれらの組合せであることを特徴とする請求項 5 に記載のドラッグ・デリバリー・システム。

【請求項 13】

前記他の薬学的に活性な物質はタキサンであり、前記タキサンはパクリタキセル、ドセタキセル、およびそれらの誘導体の中から選択されることを特徴とする請求項 12 に記載のドラッグ・デリバリー・システム。

【請求項 14】

癌治療に使用するためのものであることを特徴とする請求項 1 乃至 13 のいずれかに記載のドラッグ・デリバリー・システム。

【請求項 15】

薬学的に許容される担体と、請求項 1 乃至 14 のいずれかに記載のドラッグ・デリバリー・システムを有することを特徴とする医薬組成物。