【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5月31日(2012.5.31)

【公表番号】特表2011-525180(P2011-525180A)
【公表日】平成23年9月15日(2011.9.15)
【年通号数】公開・登録公報2011-037
【出願番号】特願2011-514761(P2011-514761)
【国際特許分類】
Ａ６１Ｋ　47/34　　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　47/48　　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　 9/51　　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　45/00　　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　35/00　　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　31/12　　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　31/04　　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　29/00　　(2006.01)
【ＦＩ】
Ａ６１Ｋ　47/34
Ａ６１Ｋ　47/48
Ａ６１Ｋ　 9/51
Ａ６１Ｋ　45/00
Ａ６１Ｐ　35/00
Ａ６１Ｐ　31/12
Ａ６１Ｐ　31/04
Ａ６１Ｐ　29/00

【手続補正書】
【提出日】平成24年3月27日(2012.3.27)
【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】
１．標的薬を提供し；
官能化ポリ(エチレングリコール)(PEG)ポリマーを提供し；
標的薬リガンドを提供し；
官能化ポリ(エチレングリコール)ポリマーを標的薬と反応させて、標的薬-PEGポリマー複合体を形成し；次いで
標的薬-PEGポリマー複合体を第２のポリマーおよび治療薬と混合して、ナノ粒子を形成すること；
を含むナノ粒子の製造方法。
【請求項２】
ポリ(エチレングリコール)が、ヘテロ二官能性であり、該標的薬が、該ポリ(エチレングリコール)のα末端に共有的に結合し、少なくとも１つの重合開始官能基が、該ポリ(エチレングリコール)のω末端に存在する、請求項１に記載の方法。
【請求項３】
該少なくとも１つの重合開始官能基が、第２のコポリマーと反応する遊離ω末端にある

ヒドロキシル(-OH)基またはアミン(-NH_2)基である、請求項２に記載の方法。
【請求項４】
第２のポリマーが、２つ以上のポリマーの混合物を含み、そして、該ポリ(エチレングリコール)の遊離ω末端に存在する官能基を反応させる少なくとも１つの官能基を含み、該２つ以上のポリマーの混合物の該少なくとも１つの官能基が、ヒドロキシル基、NHS基またはアミン基である、請求項３に記載の方法。
【請求項５】
第２のポリマーまたはコポリマーが、ヒドロキシル基、NHS基またはアミン基から選ばれる少なくとも１つの官能基を含むポリエステルコポリマーであり、該ポリ(エチレングリコール)の遊離ω末端に存在する官能基を反応させるポリエステルコポリマーである、請求項１に記載の方法。
【請求項６】
第２のポリマーまたはコポリマーが、ヒドロキシル基、NHS基またはアミン基から選ばれる少なくとも１つの官能基を含むポリエステルコポリマーであり、該ポリ(エチレングリコール)の遊離ω末端に存在する官能基を反応させるポリエステルコポリマーである、請求項４に記載の方法。
【請求項７】
該ポリエステルコポリマーが、ヘテロポリマーまたはホモポリマーを含む、請求項６に記載の方法。
【請求項８】
該ヘテロポリマーが、乳酸およびグリコール酸ユニットまたはポリ(乳酸－グリコール酸)コポリマーおよびポリ(ラクチド－グリコリド)コポリマーユニット(PLGA)を含み；ならびに該ホモポリマーが、グリコール酸ユニット(PGA)、乳酸ユニット(PLA)、ポリ-L-乳酸ユニット、ポリ-D-乳酸ユニット、ポリ-D,L-乳酸ユニット、ポリ-L-ラクチドユニット、ポリ-D-ラクチドユニットまたはポリ-D,L-ラクチドユニットを含む、請求項６に記載の方法。
【請求項９】
該ポリエステルコポリマーが、ポリヒドロキシ酸；PEG化ポリマーおよびラクチドユニットとグリコリドユニットのコポリマー、PEG化PLA、PEG化PGA、PEG化PLGA、ポリ無水物、ポリ(オルトエステル)、PEG化ポリ(オルトエステル)、ポリ(カプロラクトン)、PEG化ポリ(カプロラクトン)、ポリリシン、PEG化ポリリシン、ポリ(エチレンイミン)、PEG化ポリ(エチレンイミン)、ポリ(L-ラクチド－L-リシン)コポリマー、ポリ(セリンエステル)、ポリ(4-ヒドロキシ-L-プロリンエステル)、ポリ[a-(4-アミノブチル)-L-グリコール酸]またはその誘導体から選ばれる、請求項６に記載の方法。
【請求項１０】
該標的薬上の遊離カルボン酸基または遊離ヒドロキシル基が、官能化ポリ(エチレングリコール)ポリマーを標的薬と反応させて標的薬-PEGポリマー複合体を形成する前に保護される、請求項１に記載の方法。
【請求項１１】
該第２のポリマーの該官能基が、
ａ）該標的薬-PEG複合体上のヒドロキシル基またはカルボン酸基と反応するアミン基；または
ｂ）該標的薬-PEG複合体上のアミン基と反応するヒドロキシル基またはNHS基；
である、請求項４に記載の方法。
【請求項１２】
該第２のポリマーまたは該コポリマーの該官能基が、
ａ）該標的薬-PEG複合体上のヒドロキシル基またはカルボン酸基と反応するアミン基；または
ｂ）該標的薬-PEG複合体上のアミン基と反応するNHSまたはヒドロキシル基；
である、請求項６に記載の方法。

【請求項１３】
該第２のポリマーが、少なくとも２つの同一または異なるポリマーでありうるポリマーの混合物であり、該少なくとも２つポリマーの１番目が、官能基として少なくとも１つのヒドロキシル基またはNHS基を含み、該少なくとも２つのポリマーの２番目が、官能基として少なくとも１つのアミン基を含む、請求項１に記載の方法。
【請求項１４】
該治療薬が、抗生物質、抗ガン剤、抗ウイルス薬、抗炎症薬、診断薬、ワクチン抗原または栄養補助食品である、請求項１に記載の方法。
【請求項１５】
該少なくとも１つの標的薬が、上皮増殖因子受容体(EGFR)、ソマトスタチン受容体(SSTR)、インスリン様成長因子受容体、葉酸受容体、HER2受容体、インターロイキン13受容体、ガストリン放出ペプチド受容体、CD30、血管作動性腸管ペプチド受容体、ガストリン受容体、前立腺特異的抗原および／またはエストロゲン受容体に結合する抗体、PMSAリガンドおよびポリペプチドから選ばれる、請求項１に記載の方法。
【請求項１６】
該方法が、水性媒体中または有機溶媒中で行われる、請求項１に記載の方法。
【請求項１７】
請求項１に記載の方法にしたがって製造されるナノ粒子。
【請求項１８】
請求項１７に記載のナノ粒子および医薬的に許容しうる担体を含む組成物。
【請求項１９】
患者の疾患を治療するための請求項１７に記載のナノ粒子の使用。
【請求項２０】
該疾患が、肺ガン、乳ガン、前立腺ガン、頭頸部ガン、卵巣ガン、皮膚ガン、精巣ガン、膵臓ガン、食道ガン、結腸直腸ガン、腎臓ガン、子宮頸ガン、消化管ガン、ウイルス感染、細菌感染または炎症から選ばれる、請求項１９に記載の使用。
【請求項２１】
ポリ(エチレングリコール)ポリマーのα末端に共有的に結合する標的薬および該ポリ(エチレングリコール)のω末端に存在する官能基を介して該ポリ(エチレングリコール)ポリマーに共有的に結合する少なくとも１つの第２のポリマーを含む、請求項１に記載の方法にしがって製造されるポリマー。