

【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3区分  
 【発行日】令和4年6月23日(2022.6.23)

【国際公開番号】WO2021/024906  
 【出願番号】特願2021-537269(P2021-537269)  
 【国際特許分類】

C 0 8 F 2 9 3 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 C 0 8 G 8 1 / 0 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 P 3 5 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 P 3 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 P 1 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 P 1 / 1 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 P 3 / 0 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 P 3 / 1 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 P 3 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 K 3 1 / 1 9 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 K 4 7 / 6 0 ( 2 0 1 7 . 0 1 )  
 A 6 1 K 9 / 1 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

10

【 F I 】

20

C 0 8 F 2 9 3 / 0 0  
 C 0 8 G 8 1 / 0 2  
 A 6 1 P 3 5 / 0 0  
 A 6 1 P 3 / 0 4  
 A 6 1 P 1 / 0 4  
 A 6 1 P 1 / 1 6  
 A 6 1 P 3 / 0 6  
 A 6 1 P 3 / 1 0  
 A 6 1 P 3 / 0 0  
 A 6 1 K 3 1 / 1 9  
 A 6 1 K 4 7 / 6 0  
 A 6 1 K 9 / 1 4

30

【手続補正書】

【提出日】令和2年12月3日(2020.12.3)

【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】

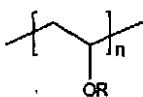
40

【特許請求の範囲】

【請求項1】

親水-疎水性共重合体であって、

(1)式I:



(I)

50

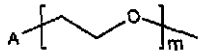
式中、

R は、 $-(C=O)R^1$  又は水素原子であり、 $R^1$  は、非置換又は置換された炭素原子数 1 ~ 7 個の直鎖又は分岐のアルキル（置換された場合の置換基は非置換若しくは置換されたフェニルであり、置換されたフェニルの置換基は、1 以上のハロゲン、ヒドロキシル、メチルオキシである。）であり、ここで、水素原子は存在するとしても n の 30% 以下であり、

n は 5 ~ 1000 の整数である、

で表される、反復単位に由来する疎水性セグメント、と

(2) 式 I I a :



(I I a)

10

式中、A は、非置換または置換  $C_1 - C_{12}$  アルキルオキシであり、置換されている場合の置換基は、ホルミル基、式  $R'R''CH-$  基、又はフェニルアミノ基若しくはフェネチルアミノ基であり、ここで、 $R'$  及び  $R''$  は独立して  $C - C_4$  アルキルオキシ又は  $R'$  と  $R''$  は一緒になって  $-OCH_2CH_2O-$ 、 $-O(CH_2)_3O-$  もしくは  $-O(CH_2)_4O-$  であり、

20

m は 10 ~ 500 の整数である、で表される、ポリ（エチレングリコール）鎖を含む親水性セグメントを含み、前記（1）の疎水性セグメントと、（2）の親水性セグメントは、それぞれブロックとして存在する、

親水 - 疎水性共重合体。

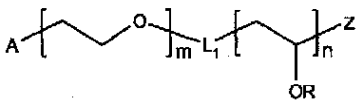
【請求項 2】

水中で会合して自己組織化することによりナノ粒子又はナノサイズの高分子ミセルを形成する、請求項 1 に記載の親水 - 疎水性共重合体。

【請求項 3】

請求項 1 又は 2 に記載の親水 - 疎水性共重合体であって、前記（1）の式 I で表される反復単位に由来する疎水性セグメントと前記（2）の式 I I a の親水性セグメントを含む共重合体は、式 B C :

30



(B C)

式中、A、R、m、n はそれぞれ、上記定義のとおりであり、 $L_1$  は直接結合又は二価の連結基を表し、Z は、水素原子、SH、 $S(C=S)-Ph$ 、 $S(=S)OCH_2CH_3$ 、ヒドロキシル基、 $C_1 - C_6$  アルキルオキシ基又はアリール -  $C_1 - C_2$  アルキルオキシ基である、

40

で表されるブロック共重合体である、

親水 - 疎水性共重合体。

【請求項 4】

請求項 1 ~ 3 のいずれかに記載の親水 - 疎水性共重合体の水性媒体中で形成されるナノ粒子。

【請求項 5】

請求項 1 ~ 3 のいずれかに記載の親水 - 疎水性共重合体又は請求項 4 に記載のナノ粒子を有効成分として含んでなる、製薬学的製剤。

【請求項 6】

50

がんの予防若しくは治療、肥満抑制、潰瘍性大腸炎、非アルコール性脂肪肝の予防若しくは治療（若しくは肝線維化の抑制）、糖尿病の予防若しくは治療、放射線療法における放射線の増強、又は、高アンモニア血症の予防若しくは治療に使用するための請求項 5 の製薬学的製剤。

【請求項 7】

がんの予防若しくは治療、肥満抑制、潰瘍性大腸炎、非アルコール性脂肪肝の予防若しくは治療、糖尿病の予防若しくは治療、放射線療法における放射線の増強、又は、高アンモニア血症の予防若しくは治療に使用するための請求項 1 ~ 3 のいずれかの親水 - 疎水性共重合体。

【請求項 8】

がんの予防若しくは治療、肥満抑制、潰瘍性大腸炎、非アルコール性脂肪肝の予防若しくは治療（若しくは肝線維化の抑制）、糖尿病の予防若しくは治療、放射線療法における放射線の増強、又は、高アンモニア血症の予防若しくは治療に使用するための請求項 4 のナノ粒子。

【請求項 9】

請求項 1 ~ 3 のいずれかの親水 - 疎水性共重合体を、それらを必要とする患者に投与してがんの予防若しくは治療、肥満抑制、潰瘍性大腸炎、非アルコール性脂肪肝の予防若しくは治療（若しくは肝線維化の抑制）、糖尿病の予防若しくは治療、放射線療法における放射線の増強、又は、高アンモニア血症の予防若しくは治療するための方法。

【請求項 10】

請求項 4 のナノ粒子を、それらを必要とする患者に投与してがんの予防若しくは治療、肥満抑制、潰瘍性大腸炎、非アルコール性脂肪肝の予防若しくは治療、糖尿病の予防若しくは治療（若しくは肝線維化の抑制）、放射線療法における放射線の増強、肝線維化の抑制、又は、高アンモニア血症の予防若しくは治療するための方法。

10

20

30

40

50