

【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22年9月24日(2010.9.24)

【公表番号】特表2010-500375(P2010-500375A)

【公表日】平成22年1月7日(2010.1.7)

【年通号数】公開・登録公報2010-001

【出願番号】特願2009-523983(P2009-523983)

【国際特許分類】

A 6 1 K 9/16 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/02 (2006.01)

A 6 1 K 9/127 (2006.01)

A 6 1 K 9/107 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 9/16

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/02

A 6 1 K 9/127

A 6 1 K 9/107

【手続補正書】

【提出日】平成22年8月6日(2010.8.6)

【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】

マイクロ粒子またはナノ粒子であり、(i) 本体、(i i) 少なくとも 1 つの表面、および (i i i) 前記本体内部に少なくとも 1 つの貯蔵部を有する少なくとも 1 種の第 1 段階粒子であって、前記貯蔵部が、少なくとも 1 種の活性剤を含む少なくとも 1 種の第 2 段階粒子を含有する第 1 段階粒子を含む組成物。

【請求項 2】

前記第 1 段階粒子の前記本体が生体適合性材料、生分解性材料またはその組合せを含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 3】

前記第 1 段階粒子の前記本体が、多孔質またはナノ多孔質材料を含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 4】

前記多孔質またはナノ多孔質材料が、ナノ多孔質シリコンまたはナノ多孔質酸化物材料であって、例えばナノ多孔質二酸化ケイ素、ナノ多孔質酸化アルミニウム、ナノ多孔質酸化チタン、ナノ多孔質酸化鉄またはその組合せである、請求項 3 に記載の組成物。

【請求項 5】

前記第 1 段階粒子の前記本体が、第 1 多孔質領域と、孔密度、孔形状、孔電荷、孔表面の化学的性質、孔配向およびその組合せからなる性質の群から選択される少なくとも 1 つの性質において前記第 1 多孔質領域と異なる第 2 多孔質領域とを含む、請求項 3 に記載の組成物。

【請求項 6】

前記第 1 段階粒子の前記本体が、第 1 集団の第 2 段階粒子を含有する第 1 領域と、第 2 集団の第 2 段階粒子を含有する第 2 領域とを含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 7】

前記第 1 段階粒子が、化学的標的化部分、物理的標的化部分、幾何学的標的化部分およびその組合せから選択される少なくとも 1 つの標的化部分を含み、前記化学的標的化部分がデンドリマー、アプタマー、抗体、生体分子およびその組合せから選択される少なくとも 1 つの部分を含み、前記物理的標的化部分および前記幾何学的標的化部分が前記第 1 段階粒子の前記本体のサイズ、前記第 1 段階粒子の前記本体の形状および前記第 1 段階粒子の前記表面上の電荷から選択される、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 8】

前記少なくとも 1 つの貯蔵部が、少なくとも 1 種の透過エンハンサー、少なくとも 1 種の追加の活性剤、少なくとも 1 つの標的化部分またはそれらの組合せを含む少なくとも 1 種の追加の作用剤を含有し、前記少なくとも 1 種の透過エンハンサーが有利には基底膜透過エンハンサー、タイトジャンクションタンパク質透過エンハンサーおよびその任意の組合せからなる群から選択される、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 9】

前記少なくとも 1 種の第 2 段階粒子が、リボソーム、ミセル、エソソーム、カーボンナノチューブ、フラーレンナノ粒子、金属ナノ粒子、半導体ナノ粒子、ポリマーナノ粒子、酸化物ナノ粒子、ウイルス粒子、ポリイオン粒子、セラミック粒子およびその組合せのうちの少なくとも 1 つを含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 10】

前記第 2 段階粒子が、前記活性剤を含む少なくとも 1 種の第 3 段階粒子を含有する、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 11】

前記活性剤が、治療剤、造影剤またはその組合せを含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 12】

対象に投与するための医薬として使用するための、請求項 1 ～ 11 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 13】

前記第 1 段階粒子が、前記対象の身体中の第 1 標的部位に局在化するように構成されており、前記第 1 標的部位が有利には血管新生の脈管構造、再正常化された脈管構造または組み込まれた脈管構造である、請求項 12 に記載の組成物。

【請求項 14】

前記第 2 段階粒子が前記対象の身体中の第 2 標的部位に前記活性剤を送達するように構成されており、前記第 2 標的部位が有利には細胞であって、例えば癌細胞、特に幹細胞もしくはクローン化可能細胞であるか、または有利には細胞の核である、請求項 13 に記載の組成物。

【請求項 15】

前記組成物が血管内注射により投与される、請求項 12 に記載の組成物。

【請求項 16】

多段階送達組成物を作製する方法であって、

(a) マイクロ粒子またはナノ粒子であり、(i) 本体、(i i) 少なくとも 1 つの表面、および (i i i) 前記本体内部に少なくとも 1 つの貯蔵部を有する、少なくとも 1 種の第 1 段階粒子を提供するステップと、

(b) 少なくとも 1 種の第 2 段階粒子を提供するステップと、

(c) 前記第 2 段階粒子を、前記第 1 段階粒子の前記貯蔵部内部に装填するステップとを含む方法。

【請求項 17】

前記第 1 段階粒子の前記本体がナノ多孔質材料、例えばナノ多孔質シリコンまたはナノ

多孔質酸化物材料を含む、請求項 1 6 に記載の方法。

【請求項 1 8】

前記少なくとも 1 種の第 1 段階粒子を提供するステップおよび前記少なくとも 1 種の第 2 段階粒子を提供するステップが、前記少なくとも 1 種の第 1 段階粒子、前記少なくとも 1 種の第 2 段階粒子、および担体を含む溶液を提供するステップを含む、請求項 1 6 に記載の方法。

【請求項 1 9】

前記装填するステップが、受動拡散または毛管対流、またはこれらの組合せによって装填するステップを含む、請求項 1 6 に記載の方法。

【請求項 2 0】

(i) 前記第 1 段階粒子の前記本体の孔表面、または前記第 2 段階粒子の表面のうち少なくとも 1 つを化学的に修飾するステップ、 (i i) 前記第 1 段階粒子の前記本体の孔表面、または前記第 2 段階粒子の前記表面のうち少なくとも 1 つの表面上の表面電荷を改変するステップ、あるいは (i i i) これらステップの組合せをさらに含む、請求項 1 6 に記載の方法。