

【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7月1日(2010.7.1)

【公表番号】特表2009-537541(P2009-537541A)

【公表日】平成21年10月29日(2009.10.29)

【年通号数】公開・登録公報2009-043

【出願番号】特願2009-511056(P2009-511056)

【国際特許分類】

A 6 1 K 9/14 (2006.01)

C 0 8 G 81/00 (2006.01)

C 0 8 L 101/00 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/42 (2006.01)

A 6 1 K 39/395 (2006.01)

A 6 1 K 31/7088 (2006.01)

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/337 (2006.01)

A 6 1 K 38/43 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 9/14

C 0 8 G 81/00

C 0 8 L 101/00

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/42

A 6 1 K 39/395 C

A 6 1 K 39/395 L

A 6 1 K 31/7088

A 6 1 K 37/02

A 6 1 K 31/337

A 6 1 K 37/48

A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成22年5月12日(2010.5.12)

【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】

ナノ粒子組成物であって：

約 1 マイクロメートルより小さい平均特徴寸法を有する粒子を含み、該粒子が、生体適合性ポリマーを含む第 1 の部分、および標的化成分、造影成分、キレート成分、複数荷電基を有する成分、および治療成分からなる群から選択される成分を含む第 2 の部分を含む両親媒性マクロ分子を含み、該成分が、該粒子の内部で本質的にゼロでない濃度を有する、ナノ粒子組成物。

【請求項 2】

前記ポリマーが、ブロックコポリマーである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 3】

前記ポリマーが、両親媒性である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 4】

前記マクロ分子の少なくとも一部分が、生分解性である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 5】

前記生体適合性ポリマーが、ポリ（ラクチド-コグリコリド）、ポリ（ラクチド）、ポリ（グリコリド）、ポリ（オルトエステル）、ポリ（カプロラクトン）、ポリリジン、ポリ（エチレンイミド）、ポリ（アクリル酸）、ポリ（ウレタン）、ポリ（酸無水物）、ポリ（エステル）、ポリ（トリメチレンカーボネート）、ポリ（エチレンイミン）、ポリ（ β アミノエステル）、およびこれらのコポリマーからなる群より選択されるポリマーを含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 6】

ポリペプチド、核酸、脂肪酸、炭水化物、ペプチドグリカン、および糖ペプチドからなる群より選択される分子を含む標的化成分を含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 7】

前記標的化成分が、前立腺特異的膜抗原に特異的に結合する、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 8】

前記標的化成分が、抗体もしくは抗原、または抗体フラグメントもしくは抗原フラグメントを含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 9】

前記標的化成分が、細胞表面の分子に特異的に結合し得る、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 10】

前記粒子が、前記成分を含まない生体適合性ポリマーを含む第 2 のマクロ分子をさらに含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 11】

前記粒子が、薬物をさらに含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 12】

前記薬物が、疎水性であり、そして前記粒子中の前記ポリマーの疎水性部分と会合している、請求項 11 に記載の組成物。

【請求項 13】

前記粒子が、ドセタキセルを含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 14】

前記粒子が、約 150 nm より小さい平均特徴寸法を有する、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 15】

前記ブロックコポリマーが、ポリ（アルキレングリコール）を含む第 3 のブロックをさらに含む、請求項 2 に記載の組成物。

【請求項 16】

前記粒子が：

前記マクロ分子を含む溶液を提供する工程；および

該溶液をポリマー非溶媒と接触する工程であって、該ポリマー費用倍中で該マクロ分子が自己アセンブリして、前記第 2 の部分の実質的に全てを外側に有し、そして前記第 1 のポリマー部分の実質的に全てを内側に有する該粒子を生成する、工程を包含するプロセスによって作製される、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 17】

前記マクロ分子を含む溶液が有機溶媒であり、そして前記ポリマー非溶媒が水溶液である、請求項 16 に記載の組成物。

【請求項 18】

組成物であって：

約 1 マイクロメートルより小さい平均特徴寸法を有する粒子であって、第 1 のマクロ分

子および第2のマクロ分子を含む粒子を含み；

ここで、該第1のマクロ分子が、第1の生体適合性ポリマー、ポリ（アルキレングリコール）、および標的化成分、造影成分、キレート成分、複数荷電基を有する成分、および治療成分からなる群から選択される成分を含むブロックコポリマーであり；

そしてここで、該第2のマクロ分子が、ポリ（アルキレングリコール）および該第1の生体適合性ポリマーから区別可能な第2の生体適合性ポリマーを含むブロックコポリマーである、組成物。

【請求項19】

ナノ粒子組成物であって：

約1マイクロメートルより小さい平均特徴寸法を有する粒子であって、第1のマクロ分子および第2のマクロ分子を含む表面を有する粒子を含み、該第1のマクロ分子が、第1の長さを有する第1のポリ（アルキレングリコール）鎖、および標的化成分、造影成分、キレート成分、複数荷電基を有する成分、および治療成分からなる群から選択される成分を含み、そして該第2のマクロ分子が、該第1の長さとは異なる第2長さを有するポリ（アルキレングリコール）鎖を含む、ナノ粒子組成物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0007

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0007】

本発明は、例えば、以下を提供する：

（項目1）

組成物であって：

約1マイクロメートルより小さい平均特徴寸法を有する粒子を含み、該粒子が、生体適合性ポリマーを含む第1の部分、および標的化成分、造影成分、キレート成分、複数荷電基を有する成分、および治療成分からなる群から選択される成分を含む第2の部分を含むマクロ分子を含み、該成分が、該粒子の内部で本質的にゼロでない濃度を有する、組成物。

（項目2）

上記成分が、少なくとも約1000Daの分子量を有する、項目1に記載の組成物。

（項目3）

上記成分が、約1000Daを超えない分子量を有する、項目1に記載の組成物。

（項目4）

上記マクロ分子が、ブロックコポリマーである、項目1に記載の組成物。

（項目5）

上記マクロ分子が、両親媒性である、項目1に記載の組成物。

（項目6）

上記マクロ分子の少なくとも一部分が、生分解性である、項目1に記載の組成物。

（項目7）

上記マクロ分子の少なくとも一部分が、加水分解可能である、項目1に記載の組成物。

（項目8）

上記生体適合性ポリマーが、ポリ（ラクチド-コ-グリコリド）を含む、項目1に記載の組成物。

（項目9）

上記標的化成分が、ポリペプチドを含む、項目1に記載の組成物。

（項目10）

上記標的化成分が、アプタマーを含む、項目1に記載の組成物。

（項目11）

上記標的化成分が、前立腺特異的膜抗原に特異的に結合する、項目1に記載の組成物。

(項目 1 2)

上記標的化成分が、抗体または抗体フラグメントを含む、項目 1 に記載の組成物。

(項目 1 3)

上記標的化成分が、細胞表面レセプターに特異的に結合する、項目 1 に記載の組成物。

(項目 1 4)

上記標的化成分が、生物学的実体に特異的に結合する、項目 1 に記載の組成物。

(項目 1 5)

上記粒子が、上記生体適合性ポリマーを含み、そして上記成分を含まない第 2 のマクロ分子をさらに含む、項目 1 に記載の組成物。

(項目 1 6)

上記粒子が、薬物をさらに含む、項目 1 に記載の組成物。

(項目 1 7)

上記薬物が、疎水性である、項目 1 6 に記載の組成物。

(項目 1 8)

上記粒子が、核酸を含む、項目 1 に記載の組成物。

(項目 1 9)

上記粒子が、ペプチドまたはタンパク質を含む、項目 1 に記載の組成物。

(項目 2 0)

上記粒子が、ドセタキセルを含む、項目 1 に記載の組成物。

(項目 2 1)

上記粒子が、酵素を含む、項目 1 に記載の組成物。

(項目 2 2)

上記粒子が、約 150 nm より小さい平均特徴寸法を有する、項目 1 に記載の組成物。

(項目 2 3)

上記ブロックコポリマーが、ポリ（アルキレングリコール）を含む第 3 のブロックをさらに含む、項目 1 に記載の組成物。

(項目 2 4)

上記ポリ（アルキレングリコール）が、ポリ（エチレングリコール）を含む、項目 2 3 に記載の組成物。

(項目 2 5)

上記粒子が：

上記マクロ分子を含む溶液を提供する工程；および

該粒子を生成するために該溶液をポリマー非溶媒と接触する工程、を包含するプロセスによって作製される、項目 1 に記載の組成物。

(項目 2 6)

上記マクロ分子を含む溶液が有機溶媒であり、そして上記ポリマー非溶媒が水溶液である、項目 2 5 に記載の組成物。

(項目 2 7)

所望の性質を備えたナノ粒子を作り上げる方法であって：

第 1 の生体適合性ポリマー、および標的化成分、造影成分、キレート成分、複数荷電基を有する成分、および治療成分からなる群から選択される成分を含む第 1 のマクロ分子を提供する工程；

第 2 の生体適合性ポリマーを含む第 2 のマクロ分子を提供する工程；

該第 1 のマクロ分子および該第 2 のマクロ分子を異なる比で含む混合物からナノ粒子を形成することにより、該第 1 のマクロ分子および該第 2 のマクロ分子の異なる比を有するナノ粒子のライブラリーを生成する工程；および

1 つ以上の所望の性質を有するナノ粒子の該ライブラリーからナノ粒子を識別する工程、を包含する、方法。

(項目 2 8)

上記第 1 の生体適合性ポリマーが、上記第 2 の生体適合性ポリマーと実質的に同じである

、項目 27 に記載の方法。

(項目 29)

上記第 1 のポリマーが、ポリ（エチレングリコール）をさらに含む、項目 27 に記載の方法。

(項目 30)

上記第 2 のポリマーが、ポリ（エチレングリコール）をさらに含む、項目 27 に記載の方法。

(項目 31)

上記第 1 の生体適合性ポリマーが、ポリ（ラクチド-コ-グリコリド）を含む、項目 27 に記載の方法。

(項目 32)

上記ナノ粒子を形成することの前に、薬物を添加することをさらに包含する、項目 27 に記載の方法。

(項目 33)

上記薬物が、ドクリタキセルである、項目 32 に記載の方法。

(項目 34)

上記ナノ粒子を形成することの前に、干渉 RNA を添加することをさらに包含する、項目 27 に記載の方法。

(項目 35)

上記ナノ粒子を形成することの前に、ペプチドまたはタンパク質を添加することをさらに包含する、項目 27 に記載の方法。

(項目 36)

上記ナノ粒子を形成することの前に、酵素を添加することをさらに包含する、項目 27 に記載の方法。

(項目 37)

ライブラリーを生成する方法であって：

繰り返しユニットを有する第 1 のブロック、および標的化成分、造影成分、キレート成分、複数荷電基を有する成分、および治療成分からなる群から選択される成分を含む第 2 のブロックを含む第 1 のマクロ分子を提供する工程；

第 1 の繰り返し単位を含むが、該標的化成分を含まない第 2 のポリマーを提供する工程；および

該第 1 のマクロ分子および該第 2 のポリマーを異なる比で含む混合物からナノ粒子を形成することにより、該第 1 のマクロ分子と該第 2 のポリマーの異なる比を有するナノ粒子のライブラリーを生成する工程、を包含する、方法。

(項目 38)

組成物であって：

約 1 マイクロメートルより小さい平均特徴寸法を有する粒子であって、第 1 のマクロ分子および第 2 のマクロ分子を含む粒子を含み；

ここで、該第 1 のマクロ分子が、第 1 の生体適合性ポリマー、ポリ（アルキレングリコール）、および標的化成分、造影成分、キレート成分、複数荷電基を有する成分、および治療成分からなる群から選択される成分を含むブロックコポリマーであり；

そしてここで、該第 2 のマクロ分子が、ポリ（アルキレングリコール）および該第 1 の生体適合性ポリマーから区別可能な第 2 の生体適合性ポリマーを含むブロックコポリマーである、組成物。

(項目 39)

組成物であって：

約 1 マイクロメートルより小さい平均特徴寸法を有する粒子であって、第 1 のマクロ分子および第 2 のマクロ分子を含む表面を有する粒子を含み、該第 1 のマクロ分子が、第 1 の長さを有する第 1 のポリ（アルキレングリコール）鎖、および標的化成分、造影成分、キレート成分、複数荷電基を有する成分、および治療成分からなる群から選択される成分

を含み、そして該第 2 のマクロ分子が、該第 1 の長さとは異なる第 2 長さを有するポリ（アルキレングリコール）鎖を含む、組成物。

（発明の要旨）

本発明は、一般に、ポリマーおよびマクロ分子に関し、そして特に、ナノ粒子のような粒子において有用なブロックポリマーに関する。本発明の主題は、いくつかの場合、相互関連する産物、特定の問題に対する代替えの解決、および／または 1 つ以上のシステムおよび／または物品の複数の異なる使用を含む。