

【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26年8月14日 (2014.8.14)

【公表番号】特表2013-513610(P2013-513610A)

【公表日】平成25年4月22日 (2013.4.22)

【年通号数】公開・登録公報2013-019

【出願番号】特願2012-543222(P2012-543222)

【国際特許分類】

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/42 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/00 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/04 (2006.01)

A 6 1 K 9/14 (2006.01)

A 6 1 K 9/19 (2006.01)

A 6 1 K 31/409 (2006.01)

A 6 1 K 41/00 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/42

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/10

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 13/00

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 19/04

A 6 1 K 9/14

A 6 1 K 9/19

A 6 1 K 31/409

A 6 1 K 41/00

【手続補正書】

【提出日】平成26年6月26日 (2014.6.26)

【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

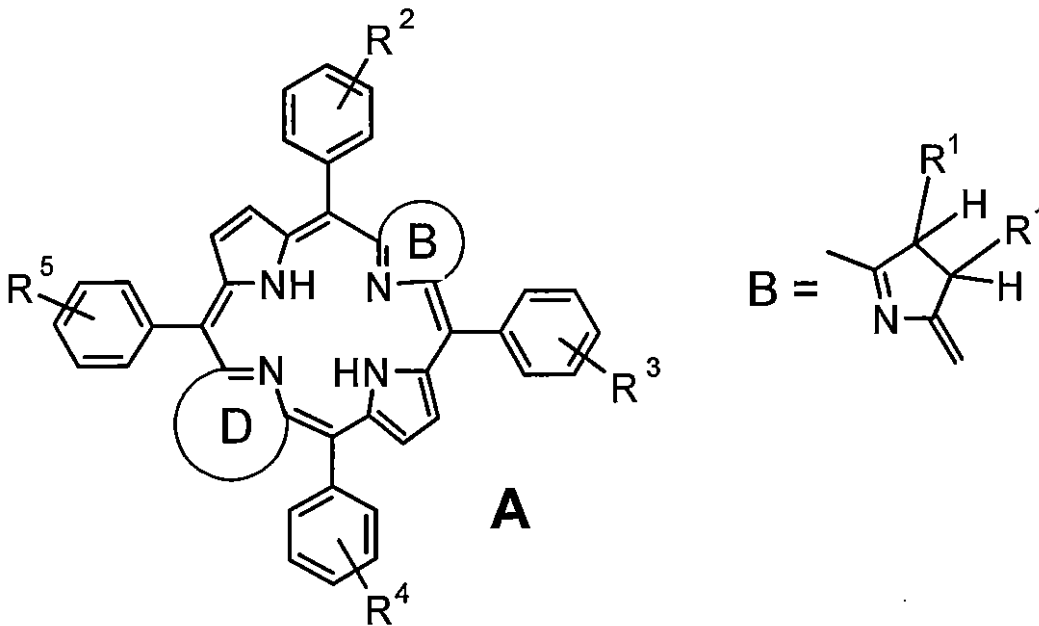
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

500nm未満の範囲の乳酸・グリコール酸共重合体(P L G A)粒子と、  
 治療上有効量のテトラピロール系の疎水性光増感剤と、  
 安定化剤と、  
 を含み、  
 前記光増感剤は、  
 式Aのクロリン又はバクテリオクロリン誘導体であって、  
 【化1】



ここで、

$R^1$  は、HまたはOHであって、

$R^2$  から  $R^5$  は、OH、COOH、 $NH_2$ 、COOX、NHX、OX、 $NH-Y$ 、COOHまたはCO-Y- $NH_2$  からなる置換基の群から互いに独立して選択され、フェニル環のメタ、パラ位のいずれかにおける置換基であって、

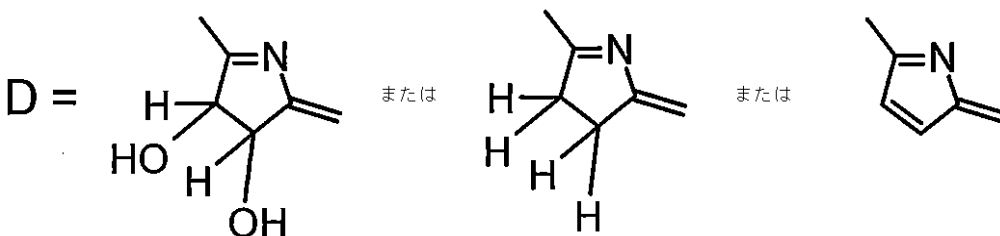
このとき、

Xは、 $n = 1 \sim 30$  の  $(CH_2CH_2O)_nCH_3$  を有するポリエチレングリコール残基あるいは炭水化物基であって、

Yは、 $n = 1 \sim 30$  のペプチドまたはオリゴペプチドであって、

環Dは、次の構造を有し、

【化2】



前記安定化剤は、

ポリ(ビニルアルコール)(PVA)、ポリソルベート、ポロキサマーおよびヒト血清アルブミンを含む標準的な安定剤の群から選択される、

光力学的療法における使用のためのナノ粒子医薬製剤。

【請求項2】

前記光増感剤の治療上有効な濃度は、

ナノ粒子mgあたり10から320μgで極めて可変である、

ことを特徴とする請求項1に記載の光力学的療法における使用のためのナノ粒子医薬製

剤。

【請求項 3】

前記光増感剤は、

テモポルフィン (mTHPC)、2,3 ジヒドロキシ 5,10,15,20 テトラキス (3 ヒドロキシフェニル) クロリン (mTHPD OH) および 5,10,15,20 テトラキス (3 ヒドロキシフェニル) ポルフィリン (mTHPP) からなる群から選択される、

ことを特徴とする請求項 1 または 2 に記載の光力学的療法における使用のためのナノ粒子医薬製剤。

【請求項 4】

前記薬剤含有ナノ粒子は、

グルコース、トレハロース、スクロース、ソルビトール、マンニトールおよびこれらの組み合わせの群から選択される抗凍結剤の存在下で凍結乾燥される、

ことを特徴とする請求項 1 ないし 3 のいずれか一項に記載の光力学的療法における使用のためのナノ粒子医薬製剤。

【請求項 5】

前記製剤が、標的の細胞および組織への光増感剤の高度な移行のために薬剤標的リガンドのナノ粒子表面への付着を可能とする、

ことを特徴とする請求項 1 ないし 4 のいずれか一項に記載の光力学的療法における使用のためのナノ粒子医薬製剤。

【請求項 6】

前記製剤が、好ましくは静脈注射を含む非経口手段によって投与される、

ことを特徴とする請求項 1 ないし 5 のいずれか一項に記載の光力学的療法における使用のためのナノ粒子医薬製剤。

【請求項 7】

a. 有機溶媒に PLGA を溶解するステップと、

b. ろ過器を通して前記 PLGA 溶液をろ過し、水溶液を安定化するステップと、

c. 粒子表面への吸着結合、封入結合およびこれらの組み合わせによって光増感剤を加えるステップと、

d. 安定化水溶液を加え、水中油型ナノエマルションを形成するステップと、

e. 得られたナノ粒子を精製するステップと、

を含む、

請求項 1 ないし 6 のいずれか一項に記載のナノ粒子医薬製剤の調製方法。

【請求項 8】

前記有機溶媒は、

酢酸エチルである、

ことを特徴とする請求項 7 に記載の調製方法。

【請求項 9】

前記安定化水溶液は、

PVA を含む、

ことを特徴とする請求項 7 または 8 に記載の調製方法。

【請求項 10】

光力学的療法における使用のための請求項 1 ないし 6 のいずれか一項に記載のナノ粒子医薬製剤。

【請求項 11】

腫瘍、その他の腫瘍性疾患および関連する疾患に対する光力学的療法における使用のための請求項 1 ないし 6 のいずれか一項に記載のナノ粒子医薬製剤。

【請求項 12】

皮膚疾患、眼科疾患および泌尿器疾患および関連する疾患に対する光力学的療法における使用のための請求項 1 ないし 6 のいずれか一項に記載のナノ粒子医薬製剤。

## 【請求項 1 3】

関節炎、類似する炎症疾患および関連する疾患に対する光力学的療法における使用のための請求項 1 ないし 6 のいずれか一項に記載のナノ粒子医薬製剤。