

【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16年11月18日(2004.11.18)

【公表番号】特表2000-506121(P2000-506121A)

【公表日】平成12年5月23日(2000.5.23)

【出願番号】特願平9-529011

【国際特許分類第7版】

C 0 7 F 9/10

A 6 1 K 9/127

【F I】

C 0 7 F 9/10 B

A 6 1 K 9/127

【手続補正書】

【提出日】平成16年2月13日(2004.2.13)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

【補正方法】変更

【補正の内容】

手 続 補 正 書

平成 16 年 2 月 13 日

特 許 庁 長 官 殿

1. 事件の表示

平成 9 年 特 許 願 第 529011 号

2. 補正をする者

事件との関係 特許出願人

名 称 マツクスープランクーゲゼルシャフト ツール フエルデル
ング デル ヴィツセンシャフテン エー フアウ

3. 代 理 人

住 所 東京都港区西新橋 2 丁目 7 番 4 号

ドクトル・ゾンデルホフ法律事務所

電話 03 (3503) 3303 (代表)

氏 名 (6181) 弁理士 矢 野 敏 雄



4. 補正により増加する請求項の数 0

5. 補正の対象書類名

請求の範囲

6. 補正対象項目名

請求の範囲

7. 補正の内容

別紙の通り

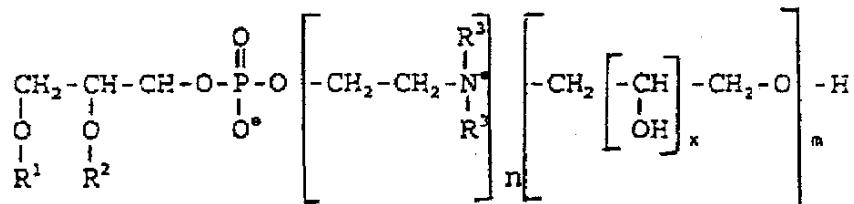


方 式 契

佐

請求の範囲

1. 一般式 (A) :



[式中、 R^1 及び R^2 は相互に無関係に水素、場合により分枝しているか、又は／かつ置換されていてよい飽和又は不飽和アルキル基又はアシル基であり、

R^3 は水素又はアルキル基であり、

$n = 0$ 又は 1 であり、

x は、1～4 の整数であり、かつ

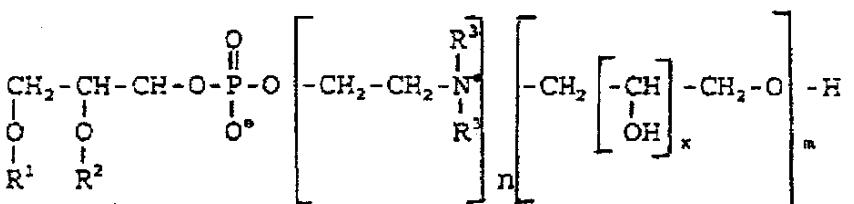
m は、 $n = 0$ の場合には 2～10 の整数、 $n = 1$ の場合には 1～10 の整数であり、並びに x が 1 よりも大きい場合には 1 であり、

その際、 $n = 0$ の場合には化合物は m の値に関して 90% を上回る均一性を有し、 $\text{R}^1 = \text{R}^2 =$ パルミトイル、 $n = 0$ 及び $x = 1$ の化合物は除く]の化合物

。

2. $x = 1$ であり、かつ m が 2～5 の整数である、請求項 1 記載の化合物。

3. リン脂質及び／又はアルキルリン脂質、場合によりコレステリン及び一般式 (A) :



[式中、 R^1 及び R^2 は相互に無関係に水素、場合により分枝しているか、又は／かつ置換されていてよい飽和又は不飽和アルキル基又はアシル基であり、

R^3 は水素又はアルキル基であり、

$n = 0$ 又は 1 であり、

x は、1～4 の整数であり、かつ

m は、 $n=0$ の場合には2～10の整数、 $n=1$ の場合には1～10の整数であり、並びに x が1よりも大きい場合には1であり、

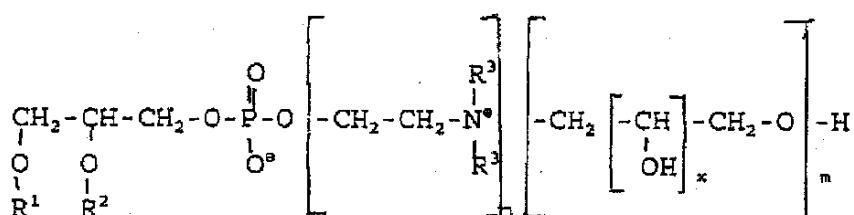
その際、 $n=0$ の場合には化合物(A)は m の値に関して90%を上回る均一性を有するが、但し、 $R^1=R^2=$ パルミトイル、 $n=0$ 及び $x=1$ の化合物は除く]の化合物又はその塩1～50モル%を含有し、その際コレステリン、リン脂質、アルキルリン脂質及び式(A)の化合物は全部で100モル%であるリポソーム。

4. 式(A)の化合物5～15モル%を含有し、その際、コレステリン、リン脂質、アルキルリン脂質及び式(A)の化合物が全部で100モル%である、請求項3記載のリポソーム。
5. 式(A)中で $x=1$ であり、かつ m が2～5の整数である、請求項3又は4記載のリポソーム。
6. 式(A)中で $n=0$ である、請求項3から5のいずれか1項記載のリポソーム。
7. コレステリン25～43モル%、一般式(A)の化合物5～15モル%及びリン脂質及び／又はアルキルリン脂質を含有する、請求項3から6のいずれか1項記載のリポソーム。
8. 基： $-CH_2(CH_2OH)_x-CH_2-OH$ が、 $x=2$ で4つのヒドロキシル基、 $x=3$ で5つのヒドロキシル基及び $x=4$ で6つのヒドロキシル基を有する糖アルコールに由来する、請求項3から7のいずれか1項記載のリポソーム。
9. 血液中での半減期が最低10時間である、請求項3から8のいずれか1項記載のリポソーム。
10. 付加的に、1種以上の薬剤作用物質を含有する、請求項3から9のいずれか1項記載のリポソーム。
11. 請求項3から10のいずれか1項記載のリポソーム及びリポソーム中に含まれる1種以上の薬剤作用物質を、場合により薬剤で慣用の希釈剤、助剤、担体及び填料と一緒に含有する、薬剤組成物。
12. 請求項3から10のいずれか1項記載のリポソームの製法において、一般式(A)の化合物1～50モル%を、式(A)の化合物と合わせて100モル%

となる量のリポソームの他の成分と一緒に、脂質懸濁液に変え、次いで、該脂質懸濁液を自体公知の方法での好適な処理により、リポソームに変えることを特徴とする、請求項3から10のいずれか1項記載のリポソームの製法。

13. 請求項12に記載の方法で処理し、かつ水不溶性作用物質の封入のためには、作用物質を脂質成分と一緒に溶かし、かつ水溶性作用物質の封入のためには脂質膜に、水溶性作用物質を含有する水溶液を添加する、請求項11に記載の薬剤調合物の製法。

14. 一般式：



[式中、R¹及びR²は相互に無関係に水素、場合により分枝しているか、又は/かつ置換されていてよい飽和又は不飽和アルキル基又はアシル基であり、R³は水素又はアルキル基であり、

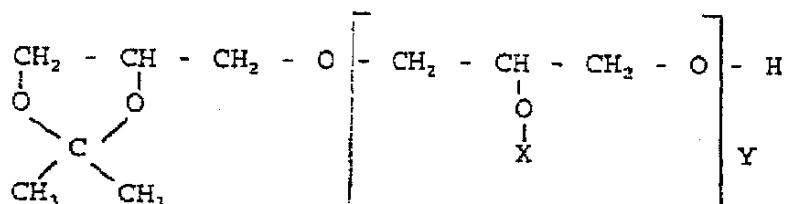
n=0又は1であり、

x=1~4の整数であり、かつ

mは、n=0の場合には2~10の整数であるか、又はn=1の場合には1~10の整数であり、並びにxが1より大きい場合には1であり、

その際、n=0の場合に、化合物はmの値に関して90%を上回る均一性を有する]の化合物の製法において、一定のオリゴグリセリン又はC₄~C₆-糖アルコールを、ホスホリル化剤の使用下に、式：CH₂OR¹-CHOR²-CHOHのアルコールに付加させることを特徴とする、上記式の化合物の製法。

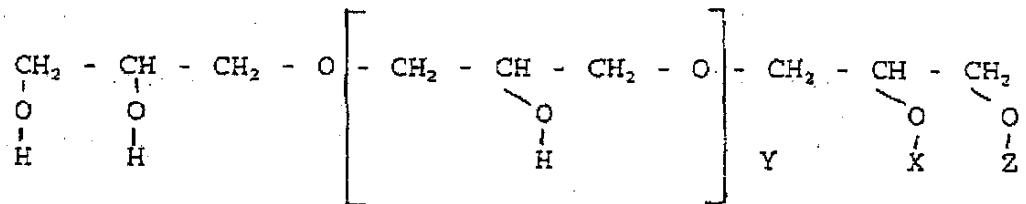
15. 式(B)：



[式中、Yは1~9の整数であり、かつXはベンジル基、アルキル基又はテト

ラヒドロプロパニル基であるが、但し、Y=1の場合、X=メチルを除く]の保護されたオリゴグリセリン。

16. 式 (C) :



[式中、Yは0～8の整数であり、かつ基X又はZの一方は、飽和又は不飽和アルキル基であり、他方の基は、水素である]のアルキルオリゴグリセリン。

17. リン脂質及び／又はアルキルリン脂質、場合によりグリセリン及び請求項14により得られる化合物1～50モル%を含有する、リポソーム。