

【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28年12月1日(2016.12.1)

【公表番号】特表2015-534573(P2015-534573A)

【公表日】平成27年12月3日(2015.12.3)

【年通号数】公開・登録公報2015-075

【出願番号】特願2015-536136(P2015-536136)

【国際特許分類】

A 6 1 K 38/43 (2006.01)

A 6 1 K 47/22 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 P 7/04 (2006.01)

C 0 7 K 14/745 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 37/465

A 6 1 K 47/22

A 6 1 K 9/08

A 6 1 P 7/04

C 0 7 K 14/745 Z N A

【手続補正書】

【提出日】平成28年10月7日(2016.10.7)

【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】

第VIIa因子ポリペプチドと、

pHを5.5~8.5の範囲に保持するのに適した緩衝剤と、

(S)-2-[2-[5-(5-カルバムイミドイル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-6,2'-ジヒドロキシ-5'-スルファモイル-ビフェニル-3-イル]アセチルアミノ}-コハク酸(式I)または薬学的に許容されるその塩、

(R)-2-[2-[5-(5-カルバムイミドイル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-6,2'-ジヒドロキシ-5'-スルファモイル-ビフェニル-3-イル]アセチルアミノ}-コハク酸(式II)または薬学的に許容されるその塩、および

(S)-2-[2-[5-(5-カルバムイミドイル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-6,2'-ジヒドロキシ-5'-スルファモイル-ビフェニル-3-イル]アセチルアミノ}-コハク酸または薬学的に許容されるその塩と(R)-2-[2-[5-(5-カルバムイミドイル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-6,2'-ジヒドロキシ-5'-スルファモイル-ビフェニル-3-イル]アセチルアミノ}-コハク酸または薬学的に許容されるその塩の混合物の群から選択される活性部位安定化剤とを含む液体医薬組成物。

【請求項2】

前記活性部位安定化剤が、

(S)-2-[2-[5-(5-カルバムイミドイル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-6,2'-ジヒドロキシ-5'-スルファモイル-ビフェニル-3-イル]アセチルアミノ}-コハク酸または薬学的に許容されるその塩である、請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

前記活性部位安定化剤が、第VIIa因子の濃度に対して5.5～100 μM、5.5～50 μM、5.5～30 μM、5.5～10 μM、6～50 μM、6～30 μMまたは6～10 μM過剰に存在する、または前記活性部位安定化剤が、第VIIa因子の濃度に対して20 μM以上、30 μM以上、40 μM以上または50 μM以上過剰に存在する、請求項1または2に記載の組成物。

【請求項4】

前記活性部位安定化剤とFVIIaポリペプチドのモル比([活性部位安定化剤]:[FVIIa])が、1.25～1.75、1.5または1.75の範囲である、請求項1から3のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項5】

前記第VII因子ポリペプチドが、0.3～200mg/mL、0.3～120mg/mL、0.5～100mg/mL、0.5～20mg/mL、1～10mg/mL、1～5.5mg/mL、2～20mg/mL、2～15mg/mL、2～10mg/mLもしくは2～5.5mg/mLまたは2mg/mLもしくは5mg/mLの濃度で存在する、請求項1から4のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項6】

6.0～8.5、6.0～7.5、6.5～7.5、7.0～7.5、6.5～7.0または6.7～6.9のpH値を有する、請求項1から5のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項7】

製剤が、酸化防止剤、等張性調節剤、界面活性剤の1つまたは複数を含む、請求項1から6のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項8】

前記第VII因子ポリペプチドが、ヒト第VIIa因子、組み換え型ヒト第VIIa因子または無血清組み換え型ヒトFVIIaである、請求項1から7のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項9】

前記第VII因子ポリペプチドが、第VII因子配列変形体または第VII因子誘導体である、請求項1から7のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項10】

第VII因子応答性出血性障害の治療のための、請求項1から9に記載の液体医薬組成物。

【請求項11】

請求項1から9に記載の液体医薬組成物を調製する方法であって、pHを5.5～8.5の範囲に保持するのに適した緩衝剤および2-[5-(5-カルバムイミドイル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-6,2'-ジヒドロキシ-5'-スルファモイル-ビフェニル-3-イル]アセチルアミノ}-コハク酸または薬学的に許容されるその塩である活性部位安定化剤を含む溶液中に、第VIIa因子ポリペプチドを供給する工程を含む方法。

【請求項12】

液体水性組成物中の第VIIa因子を安定化させる方法であって、pHを5.5～8.5の範囲に保持するのに適した緩衝剤および2-[5-(5-カルバムイミドイル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)-6,2'-ジヒドロキシ-5'-スルファモイル-ビフェニル-3-イル]アセチルアミノ}-コハク酸または薬学的に許容されるその塩である活性部位安定化剤を含む溶液中に、第VIIa因子ポリペプチドを供給する工程を含む方法。

【請求項13】

請求項1から9に記載の液体水性医薬組成物および任意選択で不活性ガスを含む気密容器。