

【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19年11月15日(2007.11.15)

【公表番号】特表2007-509982(P2007-509982A)

【公表日】平成19年4月19日(2007.4.19)

【年通号数】公開・登録公報2007-015

【出願番号】特願2006-538382(P2006-538382)

【国際特許分類】

A 6 1 K 38/00 (2006.01)
 A 6 1 K 38/43 (2006.01)
 A 6 1 K 47/02 (2006.01)
 A 6 1 K 47/10 (2006.01)
 A 6 1 K 47/26 (2006.01)
 A 6 1 K 47/42 (2006.01)
 A 6 1 K 47/44 (2006.01)
 A 6 1 K 47/30 (2006.01)
 A 6 1 K 9/20 (2006.01)
 A 6 1 K 9/18 (2006.01)
 A 6 1 K 9/48 (2006.01)
 A 6 1 P 29/00 (2006.01)
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)
 A 6 1 P 1/18 (2006.01)
 A 6 1 P 1/00 (2006.01)
 A 6 1 P 1/04 (2006.01)
 A 6 1 P 1/16 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 37/02
 A 6 1 K 37/48
 A 6 1 K 47/02
 A 6 1 K 47/10
 A 6 1 K 47/26
 A 6 1 K 47/42
 A 6 1 K 47/44
 A 6 1 K 47/30
 A 6 1 K 9/20
 A 6 1 K 9/18
 A 6 1 K 9/48
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 A 6 1 P 1/18
 A 6 1 P 1/00
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 1/16 1 0 5

【手続補正書】

【提出日】平成19年9月20日(2007.9.20)

【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】

哺乳動物において腹痛を処置するための組成物であって、該組成物は、

治療上有効な量の非膵臓プロテアーゼ

を含む、組成物。

【請求項 2】

哺乳動物において食物の投与の後にコレシストキニン (C C K) の最大血漿濃度 (C_{max}) を低下させるための組成物であって、該組成物は、

治療上有効な量の非膵臓プロテアーゼ

を含み、該低下は、(a) 食物投与の後の該プロテアーゼの非存在下における該 C_{max} を (b) 食物投与の後の該プロテアーゼの存在下における該 C_{max} と比較することによって測定され、そして該低下は、

(i) 少なくとも約 10 % ~ 約 25 % の低下；

(i i) 少なくとも約 25 % ~ 約 50 % の低下；

(i i i) 少なくとも約 50 % ~ 約 75 % の低下；および

(i v) 少なくとも約 75 % ~ 約 100 % の低下

からなる群より選択される、組成物。

【請求項 3】

哺乳動物において C C K 関連疾患を処置するための組成物であって、該組成物は、

治療上有効な量の非膵臓プロテアーゼ

を含み、該プロテアーゼを投与した後の該哺乳動物における血漿コレシストキニン (C C K) レベルは、該プロテアーゼを投与する前の該哺乳動物における血漿コレシストキニン (C C K) レベルに満たないかまたは同じレベルであり、そして該プロテアーゼを投与した後の該哺乳動物における血漿コレシストキニン (C C K) レベルは、

(a) 該プロテアーゼの投与の 0 時間後と約 4 時間後との間；

(b) 該プロテアーゼの投与の 0 時間後と約 8 時間後との間；および

(c) 該プロテアーゼの投与の 0 時間後と約 12 時間後との間

からなる群より選択される期間の間、該プロテアーゼを投与する前の該哺乳動物における血漿コレシストキニン (C C K) レベルに満たないかまたは同じレベルであり続ける、組成物。

【請求項 4】

哺乳動物において腹痛を処置するための組成物であって、該組成物は、

治療上有効な量の非膵臓プロテアーゼ

を含み、該プロテアーゼを投与した後の該哺乳動物における血漿コレシストキニン (C C K) レベルは、該プロテアーゼを投与する前の該哺乳動物における血漿コレシストキニン (C C K) レベルに満たないか、または同じレベルであり、そして該プロテアーゼを投与した後の該哺乳動物における血漿コレシストキニン (C C K) レベルは、

(a) 該プロテアーゼの投与の 0 時間後と約 4 時間後との間；

(b) 該プロテアーゼの投与の 0 時間後と約 8 時間後との間；および

(c) 該プロテアーゼの投与の 0 時間後と約 12 時間後との間

からなる群より選択される期間の間、該プロテアーゼを投与する前の該哺乳動物における血漿コレシストキニン (C C K) レベルに満たないか、または同じレベルであり続ける、組成物。

【請求項 5】

哺乳動物において腹痛を処置するための組成物であって、該組成物は、

治療上有効な量の非膵臓プロテアーゼ

を含み、該プロテアーゼは、該哺乳動物においてコレシストキニン (C C K) の最大血漿濃度 (C_{max}) の低下を引き起こし、該低下は、(a) 食物投与の後の該プロテアーゼ

の非存在下における該 C_{max} を (b) 食物投与の後の該プロテアーゼの存在下における該 C_{max} と比較することによって測定され、そして該低下は、

- (i) 少なくとも約 10% ~ 約 25% の低下；
- (ii) 少なくとも約 25% ~ 約 50% の低下；
- (iii) 少なくとも約 50% ~ 約 75% の低下；および
- (iv) 少なくとも約 75% ~ 約 100% の低下

からなる群より選択される、組成物。

【請求項 6】

哺乳動物において腹痛を処置するための組成物であって、該組成物は、

治療上有効な量の非膵臓プロテアーゼ

を含み、該プロテアーゼは、該哺乳動物において血漿コレシストキニン (CCK) レベルの低下を引き起こす、組成物。

【請求項 7】

哺乳動物において腹痛を処置するための組成物であって、該組成物は、

治療上有効な量の非膵臓プロテアーゼ

を含み、該プロテアーゼは、食物の投与の間に該プロテアーゼが存在しない場合の該哺乳動物における CCK の最大血漿濃度 (C_{max}) と比較して、該哺乳動物における CCK の C_{max} を低下させる、組成物。

【請求項 8】

哺乳動物における食欲不振を処置するための組成物であって、該組成物は、

治療上有効な量の非膵臓プロテアーゼ

を含む、組成物。

【請求項 9】

前記非膵臓プロテアーゼが、アスパラギン酸ペプチダーゼ、チオールペプチダーゼ、メタロペプチダーゼ、セリンペプチダーゼ、スレオニンペプチダーゼ、アルカリペプチダーゼ、セミアルカリペプチダーゼ、中性プロテアーゼ、およびそれらの混合物からなる群より選択される、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 10】

前記非膵臓プロテアーゼが、セアプローゼ、セラペプターゼ、プロナーゼ、プロナーゼ成分またはそれらの混合物である、請求項 9 に記載の組成物。

【請求項 11】

前記非膵臓プロテアーゼが、結晶性形態、半結晶性形態または非晶質形態である、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 12】

前記組成物が、賦形剤またはキャリアをさらに含有する、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 13】

前記賦形剤が、塩、アルコール、炭水化物、タンパク質、脂質、界面活性剤、ポリマーおよびポリアミノ酸からなる群より選択される、請求項 12 に記載の組成物。

【請求項 14】

前記組成物が、リパーゼおよびアミラーゼからなる群より選択される 1 種以上の酵素をさらに含有する、請求項 9 に記載の組成物。

【請求項 15】

前記哺乳動物が、ヒトである、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 16】

前記治療上有効な量の前記非膵臓プロテアーゼが、1 用量あたり約 5,000 USP 単位 ~ 約 1,000,000 USP 単位である、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 17】

前記治療上有効な量の前記非膵臓プロテアーゼが、1 用量あたり約 5,000 USP 単位

～約750,000 USP単位である、請求項16に記載の組成物。

【請求項18】

前記治療上有効な量の前記非膵臓プロテアーゼが、1用量あたり約5,000 USP単位～約500,000 USP単位である、請求項17に記載の組成物。

【請求項19】

前記治療上有効な量の前記非膵臓プロテアーゼが、1用量あたり約5,000 USP単位～約250,000 USP単位である、請求項18に記載の組成物。

【請求項20】

前記非膵臓プロテアーゼが、多官能性架橋剤、ホモ二官能性架橋剤、ヘテロ二官能性架橋剤、0次架橋剤、ジアルデヒド架橋剤、ハロトリアジン架橋剤、ハロピリミジン架橋剤、無水物架橋剤、ハロゲン化物架橋剤、N-メチロール化合物、ジイソシアネート架橋剤、ジイソチオシアネート架橋剤およびアジリジン架橋剤からなる群より選択される架橋剤で架橋されている、請求項1～8のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項21】

前記組成物が、液体、固体、懸濁物または分散物として、前記哺乳動物に投与するためのものである、請求項1～8のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項22】

前記組成物が、経口経路、経腸経路または非経口経路によって前記哺乳動物に投与するためのものである、請求項1～8のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項23】

前記組成物が、酸抑制剤の同時投与を伴わずに、経口経路によって前記哺乳動物に投与するためのものである、請求項22に記載の組成物。

【請求項24】

前記組成物が、スラリー、錠剤、カプレット、カプセル剤または糖剤として前記哺乳動物に投与するためのものである、請求項1～8のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項25】

前記組成物が、非腸溶コーティングされた錠剤として前記哺乳動物に投与するためのものである、請求項1～8のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項26】

前記組成物が、1回の食事あたり錠剤1個と錠剤6個との間の用量で哺乳動物に投与するためのものであり、該錠剤は、

- (a) 約20mg～約500mgの間；
- (b) 約50mg～約500mgの間；および
- (c) 約50mg～約250mgの間

からなる群より選択される活性プロテアーゼレベルを含む、請求項24に記載の組成物。

【請求項27】

前記組成物が、1回の食事あたり1個以上の錠剤として哺乳動物に投与するためのものであり、該錠剤は、

- (a) 哺乳動物1kgあたり約1mgと哺乳動物1kgあたり約10mgとの間；
- (b) 哺乳動物1kgあたり約1mgと哺乳動物1kgあたり約3mgとの間；および
- (c) 哺乳動物1kgあたり約1mgと哺乳動物1kgあたり約2mgとの間

からなる群より選択される活性プロテアーゼ用量を提供する、請求項24に記載の組成物。

【請求項28】

前記非膵臓プロテアーゼが、結晶の形態である、請求項1～8のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項29】

前記非膵臓プロテアーゼが、セアプローゼである、請求項27に記載の組成物。

【請求項30】

前記腹痛が、膵臓機能不全、急性膵炎、慢性膵炎、嚢胞性線維症または術後胃腸手術に関

連する、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 3 1】

哺乳動物において腹痛を処置するための医薬の製造における非膵臓プロテアーゼの使用。

【請求項 3 2】

哺乳動物において食物の投与の後にコレシストキニン (CCK) の最大血漿濃度 (C_{max}) を低下させるための医薬の製造における非膵臓プロテアーゼの使用であって、該低下は、(a) 食物投与の後の該プロテアーゼの非存在下における該 C_{max} を (b) 食物投与の後の該プロテアーゼの存在下における該 C_{max} と比較することによって測定され、そして該低下は、

(i) 少なくとも約 10% ~ 約 25% の低下；

(ii) 少なくとも約 25% ~ 約 50% の低下；

(iii) 少なくとも約 50% ~ 約 75% の低下；および

(iv) 少なくとも約 75% ~ 約 100% の低下

からなる群より選択される、使用。

【請求項 3 3】

哺乳動物において CCK 関連疾患を処置するための医薬の製造における非膵臓プロテアーゼの使用であって、該プロテアーゼを投与した後の該哺乳動物における血漿コレシストキニン (CCK) レベルは、該プロテアーゼを投与する前の該哺乳動物における血漿コレシストキニン (CCK) レベルに満たないかまたは同じレベルであり、そして該プロテアーゼを投与した後の該哺乳動物における血漿コレシストキニン (CCK) レベルは、

(a) 該プロテアーゼの投与の 0 時間後と約 4 時間後との間；

(b) 該プロテアーゼの投与の 0 時間後と約 8 時間後との間；および

(c) 該プロテアーゼの投与の 0 時間後と約 12 時間後との間

からなる群より選択される期間の間、該プロテアーゼを投与する前の該哺乳動物における血漿コレシストキニン (CCK) レベルに満たないかまたは同じレベルであり続ける、使用。

【請求項 3 4】

哺乳動物において腹痛を処置するための医薬の製造における非膵臓プロテアーゼの使用であって、該プロテアーゼを投与した後の該哺乳動物における血漿コレシストキニン (CCK) レベルは、該プロテアーゼを投与する前の該哺乳動物における血漿コレシストキニン (CCK) レベルに満たないか、または同じレベルであり、そして該プロテアーゼを投与した後の該哺乳動物における血漿コレシストキニン (CCK) レベルは、

(a) 該プロテアーゼの投与の 0 時間後と約 4 時間後との間；

(b) 該プロテアーゼの投与の 0 時間後と約 8 時間後との間；および

(c) 該プロテアーゼの投与の 0 時間後と約 12 時間後との間

からなる群より選択される期間の間、該プロテアーゼを投与する前の該哺乳動物における血漿コレシストキニン (CCK) レベルに満たないか、または同じレベルであり続ける、使用。

【請求項 3 5】

哺乳動物において腹痛を処置するための医薬の製造における非膵臓プロテアーゼの使用であって、該プロテアーゼは、該哺乳動物においてコレシストキニン (CCK) の最大血漿濃度 (C_{max}) の低下を引き起こし、該低下は、(a) 食物投与の後の該プロテアーゼの非存在下における該 C_{max} を (b) 食物投与の後の該プロテアーゼの存在下における該 C_{max} と比較することによって測定され、そして該低下は、

(i) 少なくとも約 10% ~ 約 25% の低下；

(ii) 少なくとも約 25% ~ 約 50% の低下；

(iii) 少なくとも約 50% ~ 約 75% の低下；および

(iv) 少なくとも約 75% ~ 約 100% の低下

からなる群より選択される、使用。

【請求項 3 6】

哺乳動物において腹痛を処置するための医薬の製造における非膵臓プロテアーゼの使用であって、該プロテアーゼは、該哺乳動物において血漿コレシストキニン（ＣＣＫ）レベルの低下を引き起こす、使用。

【請求項 37】

哺乳動物において腹痛を処置するための医薬の製造における非膵臓プロテアーゼの使用であって、該プロテアーゼは、食物の投与の間に該プロテアーゼが存在しない場合の該哺乳動物におけるＣＣＫの最大血漿濃度（ $C_{m a x}$ ）と比較して、該哺乳動物におけるＣＣＫの $C_{m a x}$ を低下させる、使用。

【請求項 38】

哺乳動物における食欲不振を処置するための医薬の製造における非膵臓プロテアーゼの使用。