

【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27年6月25日(2015.6.25)

【公表番号】特表2014-513135(P2014-513135A)

【公表日】平成26年5月29日(2014.5.29)

【年通号数】公開・登録公報2014-028

【出願番号】特願2014-509488(P2014-509488)

【国際特許分類】

A 6 1 K 47/24 (2006.01)
A 6 1 K 47/02 (2006.01)
A 6 1 K 47/28 (2006.01)
A 6 1 K 45/00 (2006.01)
A 6 1 K 38/00 (2006.01)
A 6 1 K 31/7088 (2006.01)
A 6 1 K 31/198 (2006.01)
A 6 1 K 31/20 (2006.01)
A 6 1 K 31/70 (2006.01)
A 6 1 K 33/14 (2006.01)
A 6 1 K 33/06 (2006.01)
A 6 1 K 9/00 (2006.01)
A 6 1 P 31/10 (2006.01)
A 6 1 P 29/00 (2006.01)
A 6 1 P 31/12 (2006.01)
A 6 1 P 35/00 (2006.01)
A 6 1 P 31/04 (2006.01)
A 6 1 P 37/06 (2006.01)
A 6 1 P 25/20 (2006.01)
A 6 1 P 25/22 (2006.01)
A 6 1 P 9/08 (2006.01)
A 6 1 K 31/7048 (2006.01)
A 6 1 K 31/7036 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 47/24
A 6 1 K 47/02
A 6 1 K 47/28
A 6 1 K 45/00
A 6 1 K 37/02
A 6 1 K 31/7088
A 6 1 K 31/198
A 6 1 K 31/20
A 6 1 K 31/70
A 6 1 K 33/14
A 6 1 K 33/06
A 6 1 K 9/00
A 6 1 P 31/10
A 6 1 P 29/00
A 6 1 P 31/12
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 37/06
A 6 1 P 25/20
A 6 1 P 25/22
A 6 1 P 9/08
A 6 1 K 31/7048
A 6 1 K 31/7036

【手続補正書】

【提出日】平成27年5月1日(2015.5.1)

【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】

コクリエートの集団を含むコクリエート組成物であって、コクリエートが、

- a) 負に荷電した第1の脂質；
- b) 2価カチオンまたはより高い価数のカチオンである、カチオン；
- c) カチオンと相互作用するアニオン性官能基を持たない第2の脂質；および
- d) さらなる生体関連分子

を含む、前記コクリエート組成物。

【請求項2】

コクリエートの集団を含むコクリエート組成物であって、コクリエートが、

- a) 負に荷電した第1の脂質；
- b) 2価カチオンまたはより高い価数のカチオンである、カチオン；
- c) カチオンとイオン的に相互作用するカチオン性官能基を有する両親媒性の第2の脂質；および
- d) さらなる生体関連分子

を含む、前記コクリエート組成物。

【請求項3】

第2の脂質が中性またはカチオン性脂質またはステロールである、請求項1または2に記載のコクリエート組成物。

【請求項4】

第2の脂質がホスファチジルコリンおよびスフィンゴミエリンからなる群より選択される、請求項3に記載のコクリエート組成物。

【請求項5】

第2の脂質が、生体関連分子と水素結合を形成することが可能な脂質を含む、請求項1または2に記載のコクリエート組成物。

【請求項6】

第2の脂質が負に荷電した第1の脂質の中に埋め込まれている、請求項1または2に記載のコクリエート組成物。

【請求項7】

第2の脂質が、コクリエートの総脂質含有量の50%までを構成する、請求項1または2に記載のコクリエート組成物。

【請求項8】

コクリエートの平均粒径が1ミクロン未満である、請求項1または2に記載のコクリエート組成物。

【請求項9】

コクリエートの平均粒径が300ミクロン未満である、請求項1または2に記載のコクリエ

ート組成物。

【請求項 1 0】

負に荷電した脂質が、ホスファチジルセリン、ジオレオイルPS(DOPS)、およびダイズ由来ホスファチジルセリン(ダイズPS)を含む、請求項1または2に記載のコクリエート組成物。

【請求項 1 1】

コクリエートが少量の第3の脂質をさらに含む、請求項1または2に記載のコクリエート組成物。

【請求項 1 2】

第3の脂質が、双性イオン性脂質、PEG化脂質、カチオン性脂質、またはポリカチオン性脂質からなる群より選択される、請求項11に記載のコクリエート組成物。

【請求項 1 3】

2価またはより高い価数のカチオンが金属イオンである、請求項1または2に記載のコクリエート組成物。

【請求項 1 4】

2価またはより高い価数の金属カチオンが、カルシウム、亜鉛、バリウム、およびマグネシウムカチオンからなる群より選択される、請求項13に記載のコクリエート組成物。

【請求項 1 5】

生体関連分子が親水性である、請求項1または2に記載のコクリエート組成物。

【請求項 1 6】

生体関連分子が正または負に荷電している、請求項1または2に記載のコクリエート組成物。

【請求項 1 7】

生体関連分子が両親媒性である、請求項1または2に記載のコクリエート組成物。

【請求項 1 8】

生体関連分子が疎水性である、請求項1または2に記載のコクリエート組成物。

【請求項 1 9】

生体関連分子が、薬物、ビタミン、ミネラル、脂肪酸、アミノ酸、糖類、ポリヌクレオチド、ポリペプチド、抗原、栄養素および香味物質からなる群より選択される少なくとも1つのメンバーである、請求項1または2に記載のコクリエート組成物。

【請求項 2 0】

薬物が、抗真菌剤；非ステロイド抗炎症剤；抗癌剤；抗ウイルス剤、麻酔剤、または抗感染剤、免疫抑制剤、ステロイド抗炎症剤、精神安定剤、または血管拡張剤である、請求項19に記載のコクリエート組成物。

【請求項 2 1】

薬物が、アンホテリシンBおよびゲンタマイシンからなる群より選択される、請求項19に記載のコクリエート組成物。

【請求項 2 2】

薬物がアミノグリコシドである、請求項19に記載のコクリエート組成物。

【請求項 2 3】

アミノグリコシドがアミカシンである、請求項22に記載のコクリエート組成物。

【請求項 2 4】

ポリヌクレオチドがデオキシリボ核酸(DNA)分子またはリボ核酸(RNA)分子である、請求項19に記載のコクリエート組成物。

【請求項 2 5】

さらに凝集阻害剤を含む、請求項1または2に記載のコクリエート組成物。

【請求項 2 6】

凝集阻害剤が塩化ナトリウムである、請求項25に記載のコクリエート組成物。

【請求項 2 7】

有効量の請求項1または2に記載のコクリエート組成物および製薬上許容される担体を含

む医薬組成物。

【請求項 28】

a) 生体関連分子を第1および第2の脂質を含むリポソームと混合すること；および
b) 2価カチオンまたはより高い価数のカチオンであるカチオンを加えて、コクリエート組成物を製造すること
を含む、請求項1または2に記載のコクリエート組成物を製造する方法。

【請求項 29】

総脂質の生体関連分子に対する比が少なくとも4:1である、請求項28に記載の方法。

【請求項 30】

第2の脂質が、コクリエートの総脂質成分の50%までを構成する、請求項28に記載の方法。

【請求項 31】

第1の脂質の第2の脂質に対する比が、総脂質の1~60%の間である、請求項28に記載の方法。

【請求項 32】

2価またはより高い価数のカチオンが金属イオンである、請求項28に記載の方法。

【請求項 33】

2価またはより高い価数の金属カチオンが、カルシウム、亜鉛、バリウム、およびマグネシウムカチオンからなる群より選択される、請求項32に記載の方法。

【請求項 34】

カルシウムカチオンが塩化カルシウムから供給される、請求項33に記載の方法。

【請求項 35】

混合物の塩化カルシウム濃度が2 mM~10 mMである、請求項34に記載の方法。

【請求項 36】

さらに、リポソームと混合する前に生体関連分子を濾過または精製することを含む、請求項28に記載の方法。

【請求項 37】

さらに、凝集阻害剤をコクリエート組成物と混合する工程c)を含む、請求項28に記載の方法。

【請求項 38】

凝集阻害剤が塩化ナトリウムである、請求項37に記載の方法。

【請求項 39】

混合物の塩化ナトリウム濃度が1 mM~1 Mである、請求項38に記載の方法。

【請求項 40】

さらに、コクリエート組成物を凍結乾燥により乾燥する工程c)を含む、請求項28に記載の方法。

【請求項 41】

さらに、コクリエート組成物を凍結乾燥により乾燥する工程d)を含む、請求項37に記載の方法。

【請求項 42】

疾患または障害を治療するための、請求項1または2に記載の組成物の使用。

【請求項 43】

疾患または障害が、真菌感染、細菌感染またはウイルス感染である、請求項42に記載の使用。

【請求項 44】

コクリエートの集団を含むアミノグリコシド-コクリエート組成物であって、コクリエートが、

- a) 負に荷電した脂質；
- b) 2価カチオンまたはより高い価数のカチオンである、カチオン；および
- c) アミノグリコシド

を含む、前記アミノグリコシド-コクリエート組成物。

【請求項 4 5】

アミノグリコシド-コクリエート組成物を製造するために使用されるアミノグリコシドの少なくとも5%が、アミノグリコシド-コクリエート組成物の中に組み込まれる、請求項4_4に記載のコクリエート組成物。

【請求項 4 6】

コクリエートがさらに少量の第2の脂質を含む、請求項44に記載のコクリエート組成物。

【請求項 4 7】

第2の脂質が、双性イオン性脂質、PEG化脂質、カチオン性脂質、またはポリカチオン性脂質からなる群より選択される、請求項46に記載のコクリエート組成物。

【請求項 4 8】

アミノグリコシドがアミカシンまたはゲンタマイシンである、請求項44に記載のコクリエート組成物。

【請求項 4 9】

コクリエートの平均粒径が1ミクロン未満である、請求項44に記載のコクリエート組成物。

【請求項 5 0】

負に荷電した脂質が、ホスファチジルセリン、ジオレオイルPS(DOPS)、およびダイズ由来ホスファチジルセリン(ダイズPS)を含む、請求項44に記載のコクリエート組成物。

【請求項 5 1】

2価またはより高い価数のカチオンが金属イオンである、請求項44に記載のコクリエート組成物。

【請求項 5 2】

さらに凝集阻害剤を含む、請求項44に記載のコクリエート組成物。

【請求項 5 3】

有効量の請求項44に記載のコクリエート組成物および製薬上許容される担体を含む医薬組成物。

【請求項 5 4】

a) アミノグリコシドを脂質を含むリポソームと混合すること；および
b) 2価カチオンまたはより高い価数のカチオンであるカチオンを加えて、コクリエート組成物を製造すること

を含む、請求項44に記載のコクリエート組成物を製造する方法。

【請求項 5 5】

総脂質のアミノグリコシドに対する比が少なくとも10:1である、請求項54に記載の方法。

【請求項 5 6】

負に荷電した脂質が、コクリエートの総脂質成分の50%までを構成する、請求項54に記載の方法。

【請求項 5 7】

2価またはより高い価数のカチオンが金属イオンである、請求項54に記載の方法。