

【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22年11月11日(2010.11.11)

【公表番号】特表2008-526837(P2008-526837A)

【公表日】平成20年7月24日(2008.7.24)

【年通号数】公開・登録公報2008-029

【出願番号】特願2007-550316(P2007-550316)

【国際特許分類】

A 6 1 K 38/21 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/16 (2006.01)

A 6 1 K 9/113 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 K 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/20 (2006.01)

A 6 1 P 31/14 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 31/18 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 37/66 H

A 6 1 K 47/34

A 6 1 P 43/00 1 1 7

A 6 1 K 9/16

A 6 1 K 9/113

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 9/00

A 6 1 P 31/20

A 6 1 P 31/14

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 31/18

【手続補正書】

【提出日】平成22年9月17日(2010.9.17)

【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】

生分解性ポリマーと、インターフェロンの群より選択される1つまたは複数の活性化化合物とを含み、生分解性ポリマーがポリ(エチレングリコール)テレフタレート(PEGT)およびポリ(ブチレンテレフタレート)(PBT)から構築されるブロックコポリマーである、制御放出のための薬学的組成物。

## 【請求項2】

インターフェロンが、 $\alpha$ -インターフェロンの群、好ましくはIFN- $\alpha$ 、IFN- $\alpha$ -2a、IFN- $\alpha$ -2b、IFN- $\alpha$ -con-1、ペグ化IFN- $\alpha$ -2a、ペグ化IFN- $\alpha$ -2b、短縮型(truncated)IFN- $\alpha$ -2a、短縮型IFN- $\alpha$ -2b、IFN- $\alpha$ とアルブミンとの融合タンパク質、およびそれらの機能的誘導体からなる群より選択される、請求項1記載の組成物。

## 【請求項3】

インターフェロンが、遺伝的に操作された細胞または生物体から産生される組換えインターフェロンであり、細胞または生物体为好ましくは哺乳動物、昆虫、細菌、酵母、真菌、および高等植物の細胞または生物体より選択される、請求項1または2記載の組成物。

## 【請求項4】

活性化化合物を少なくとも7日、好ましくは少なくとも10日の期間にわたって放出するように適合化されている、前記請求項のいずれか一項記載の組成物。

## 【請求項5】

生分解性ポリマーと、インターフェロンの群より選択される1つまたは複数の活性化化合物とを含み、活性化化合物の少なくとも約80%がモノマー性の非凝集形態として放出される、制御放出のための薬学的組成物。

## 【請求項6】

組成物の単位用量が少なくとも約5MIU(百万国際単位)の活性化化合物を14日の期間にわたって放出するように適合化されており、該期間が単位用量の投与時点に始まる、前記請求項のいずれか一項記載の組成物。

## 【請求項7】

無菌であり、かつ非経口投与、特に皮下または筋肉内への注射または植込みに適するように製剤化されている、前記請求項のいずれか一項記載の組成物。

## 【請求項8】

活性化化合物およびブロックコポリマーを含む微粒子を含む、前記請求項のいずれか一項記載の組成物。

## 【請求項9】

微粒子の大半が、約5 $\mu$ mを上回る直径を有する孔を実質的に有しない、請求項8記載の組成物。

## 【請求項10】

ブロックコポリマーが約50~約95重量%のPEGT、好ましくは約70~約85重量%のPEGTを含む、請求項8または9記載の組成物。

## 【請求項11】

PEGTブロックのPEG区域の平均分子量が約600~約3,000、好ましくは約1,000~約2,000である、請求項8~10のいずれか一項記載の組成物。

## 【請求項12】

ポリエチレングリコールテレフタレート(PEGT)およびポリブチレンテレフタレート(PBT)から構築される少なくとも2種のブロックコポリマーを含み、この少なくとも2種のブロックコポリマーがPEGTおよびPBTの相対含有量ならびに/またはPEGTブロックのPEG区域の平均分子量の点で互いに異なる、請求項8~11のいずれか一項記載の組成物。

## 【請求項13】

微粒子の重量平均直径が約25~約200 $\mu$ m、好ましくは約50~約150 $\mu$ mである、請求項8~12のいずれか一項記載の組成物。

## 【請求項14】

微粒子中のインターフェロンの含有量が約0.1~約20重量%、より好ましくは約0.2~約10重量%である、請求項8~13のいずれか一項記載の組成物。

## 【請求項15】

増量剤、充填剤、界面活性剤、保存料、酸、塩基、塩、糖、糖アルコール、アミノ酸、安定化剤、抗酸化剤、ポリマー、緩衝液、ポリオール、ヒト血清アルブミンなどのタンパク質、および可塑剤からなる群より選択される1つまたは複数の賦形剤をさらに含む、請

求項8～14のいずれか一項記載の組成物。

【請求項16】

第1および第2の密閉された区画または複数のそれを含む薬学的キットであって、第1の区画が、前記請求項のいずれか一項記載の組成物を実質的に乾燥した形態で含み、第2の区画が、組成物を注射可能な微粒子懸濁液へと再構成するための水性液体担体を含む、キット。

【請求項17】

第1の区画における活性化化合物の含有量が約10～約150百万国際単位(MIU)である、請求項16記載のキット。

【請求項18】

水性液体担体の容量が約0.5～約3mL、好ましくは約1～約2mLである、請求項16または17記載のキット。

【請求項19】

水性液体担体が、界面活性剤、保存料、酸、塩基、塩、糖、糖アルコール、アミノ酸、安定化剤、浸透圧剤、抗酸化剤、およびポリマーからなる群より選択される1つまたは複数の賦形剤を含む、請求項16～18のいずれか一項記載のキット。

【請求項20】

第1および第2の密閉された区画が、2つの一次パッケージング容器の形態で提供される、請求項16～19のいずれか一項記載のキット。

【請求項21】

第1の区画が瓶またはバイアルの形態で提供され、第2の区画がシリンジの形態で提供される、請求項20記載のキット。

【請求項22】

第1および第2の密閉された区画が、二腔シリンジの2つの腔の形態で提供される、請求項16～19のいずれか一項記載のキット。

【請求項23】

活性化化合物およびブロックコポリマーが、注射可能な液体製剤の形態で液体担体中に溶解または分散されている、請求項1～7記載の組成物。

【請求項24】

注射可能な液体製剤の容量が約0.5～約3mL、好ましくは約1～約2mLである、請求項23記載の組成物。

【請求項25】

ブロックコポリマーが約75～約95重量%のPEGT、好ましくは約80～約90重量%のPEGTを含む、請求項23または24記載の組成物。

【請求項26】

PEGTブロックのPEG区域の平均分子量が約600～約2,000である、請求項23～25のいずれか一項記載の組成物。

【請求項27】

液体担体が非水性の生体適合性溶媒を含む、請求項23～26のいずれか一項記載の組成物。

【請求項28】

非水性の生体適合性溶媒が、ジメチルスルホキシド、N-メチルピロリドン、安息香酸ベンジル、テトラヒドロフラン、酢酸エチル、ベンジルアルコール、およびこれらの任意のもの混合物からなる群より選択される、請求項27記載の組成物。

【請求項29】

界面活性剤、保存料、酸、塩基、塩、糖、糖アルコール、アミノ酸、安定化剤、抗酸化剤、およびポリマーからなる群より選択される1つまたは複数の賦形剤をさらに含む、請求項23～28のいずれか一項記載の組成物。

【請求項30】

哺乳動物へ筋肉内注射または皮下注射された場合にゲル形成が可能であるように適合化

されている、請求項23～29のいずれか一項記載の組成物。

【請求項 3 1】

肉眼で見える固体インプラントとして成形される、請求項1～7のいずれか一項記載の組成物。

【請求項 3 2】

固体インプラントが棒状体として成形される、請求項31記載の組成物。

【請求項 3 3】

急性もしくは慢性のB型肝炎、急性もしくは慢性のC型肝炎、有毛状細胞性白血病、急性もしくは慢性の骨髄性白血病、多発性骨髄腫、濾胞性リンパ腫、カルチノイド腫瘍、悪性黒色腫、尖圭コンジローム、SARS、またはAIDS関連カポジ肉腫などのカポジ肉腫の治療のための薬学的製品の製造のための、請求項1～15および請求項23～32のいずれか一項記載の組成物の使用。