

【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12月27日(2007.12.27)

【公表番号】特表2007-511539(P2007-511539A)
 【公表日】平成19年5月10日(2007.5.10)
 【年通号数】公開・登録公報2007-017
 【出願番号】特願2006-540034(P2006-540034)
 【国際特許分類】

A 6 1 K 38/55 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)
A 6 1 K 47/26 (2006.01)
A 6 1 K 47/46 (2006.01)
A 6 1 K 9/14 (2006.01)
A 6 1 K 9/08 (2006.01)
A 6 1 K 47/36 (2006.01)
A 6 1 K 47/10 (2006.01)
A 6 1 K 47/20 (2006.01)
A 6 1 K 47/22 (2006.01)
A 6 1 P 11/00 (2006.01)
A 6 1 P 11/06 (2006.01)
A 6 1 P 31/04 (2006.01)
C 0 7 K 14/81 (2006.01)
C 1 2 N 15/09 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 37/64 Z N A
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 A 6 1 K 47/26
 A 6 1 K 47/46
 A 6 1 K 9/14
 A 6 1 K 9/08
 A 6 1 K 47/36
 A 6 1 K 47/10
 A 6 1 K 47/20
 A 6 1 K 47/22
 A 6 1 P 11/00
 A 6 1 P 11/06
 A 6 1 P 31/04
 C 0 7 K 14/81
 C 1 2 N 15/00 A

【手続補正書】
 【提出日】平成19年11月8日(2007.11.8)
 【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】

1 - 抗トリプシン (AAT)、安定化炭水化物、表面活性剤および抗酸化剤を含有する薬学的組成物であって、該AATは、天然のAAT、組換えAAT、またはAAT改変体である、組成物。

【請求項2】

前記組成物が、吸入療法によって患者へ投与するのに適切な形態である、請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

前記組成物が、散剤として投与される、請求項2に記載の組成物。

【請求項4】

前記組成物が、噴霧化され得る液体として処方される、請求項2に記載の組成物。

【請求項5】

前記AATが、天然のAATである、請求項1に記載の組成物。

【請求項6】

前記AATが、組換えAATである、請求項1に記載の組成物。

【請求項7】

前記AATが、AAT改変体である、請求項1に記載の組成物。

【請求項8】

前記AATが、グリコシル化されている、請求項1に記載の組成物。

【請求項9】

前記AATがグリコシル化されていない、請求項1に記載の組成物。

【請求項10】

前記安定化炭水化物が、ラクトース、スクロース、トレハロース、ラフィノース、マルトデキストリンおよびマンニトールからなる群より選択される、請求項1に記載の組成物。

【請求項11】

前記安定化炭水化物が、トレハロースである、請求項10に記載の組成物。

【請求項12】

前記抗酸化剤が、メチオニン、グルタチオン、システイン、アルコールビン酸およびN - アセチルシステインからなる群より選択される、請求項1に記載の組成物。

【請求項13】

請求項3に記載の組成物であって、前記AAT、炭水化物、表面活性剤および抗酸化剤は、前記散剤が患者への投与のために水溶液中で可溶化される場合、該AATの濃度が1 mg/ml ~ 100 mg/mlであり、該炭水化物の濃度が1% (w/v) ~ 5% (w/v)であり、該表面活性剤の濃度が0.01% (w/v) ~ 0.5% (w/v)であり、そして該抗酸化剤の濃度が1 mM ~ 10 mMであるような量で存在する、組成物。

【請求項14】

前記AATの濃度が、10 mg/ml ~ 50 mg/mlである、請求項13に記載の組成物。

【請求項15】

前記AATの濃度が、1 mg/ml ~ 100 mg/mlであり、前記炭水化物の濃度が、1% (w/v) ~ 5% (w/v)であり、前記表面活性剤の濃度が、0.01% (w/v) ~ 0.5% (w/v)であり、そして前記抗酸化剤の濃度が、1 mM ~ 10 mMである、請求項4に記載の組成物。

【請求項16】

前記AATの濃度が、10 mg/ml ~ 50 mg/mlである、請求項15に記載の組成物。

【請求項17】

請求項3に記載の組成物であって、緩衝液をさらに含有し、ここで：

(a) 前記炭水化物がトレハロースであり、前記抗酸化剤がメチオニンであり；そして

(b) 前記AAT、トレハロース、表面活性剤およびメチオニンは、前記散剤が患者への投与のために水溶液中で可溶化される場合、(i) 該AATの濃度が10 mg/ml ~

50 mg / ml であり、(i i) 該トレハロースの濃度が 10 mg / ml ~ 50 mg / ml であり、(i i i) 該表面活性剤の濃度が 0.01 % (w / v) ~ 0.5 % (w / v) であり、そして(i v) 該メチオニンの濃度が 1 mM ~ 10 mM であるような量で存在する、

組成物。

【請求項 18】

請求項 4 に記載の組成物であって、緩衝液をさらに含有し、ここで：

(a) 前記 A A T の濃度が 10 mg / ml ~ 50 mg / ml であり；

(b) 前記炭水化物がトレハロースであり、該トレハロースの濃度は 10 mg / ml ~ 50 mg / ml であり；

(c) 前記表面活性剤の濃度が 0.01 % (w / v) ~ 0.5 % (w / v) であり；そして

(d) 前記抗酸化剤がメチオニンであり、該メチオニンの濃度が、1 mM ~ 10 mM である、

組成物。

【請求項 19】

組換え 1 - 抗トリプシン (A A T)、安定化炭水化物、ならびに表面活性剤および抗酸化剤からなる群より選択される少なくとも 1 種のさらなる安定化剤を含有する薬学的組成物であって、ここで、該 A A T / 炭水化物の比 (重量 : 重量) は、1 : 1 ~ 5 : 1 であり、そしてさらに、該 A A T は、天然の A A T、組換え A A T または A A T 変体である、薬学的組成物。

【請求項 20】

前記比が、1 : 1 ~ 2 : 1 である、請求項 19 に記載の組成物。

【請求項 21】

前記安定化炭水化物が、トレハロースである、請求項 19 に記載の組成物。

【請求項 22】

前記組成物が、前記表面活性剤を含有する、請求項 19 に記載の組成物。

【請求項 23】

前記組成物が、前記抗酸化剤を含有する、請求項 19 に記載の組成物。

【請求項 24】

前記組成物が、前記表面活性剤および前記抗酸化剤の両方を含有する、請求項 19 に記載の組成物。

【請求項 25】

前記表面活性剤がポリソルベート 80 であり、前記抗酸化剤がメチオニンである、請求項 24 に記載の組成物。

【請求項 26】

前記組成物が固体として処方される、請求項 19 に記載の組成物。

【請求項 27】

前記組成物が液体として投与される、請求項 19 に記載の組成物。

【請求項 28】

前記 A A T が天然の A A T である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 29】

前記 A A T が組換え A A T である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 30】

前記 A A T が A A T 変体である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 31】

前記 A A T がグリコシル化されている、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 32】

前記 A A T がグリコシル化されていない、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 33】

1 - 抗トリプシン (AAT) 欠損に関連する肺疾患を処置するための薬学的組成物であって、該薬学的組成物は、有効量の AAT、安定化炭水化物、表面活性剤および抗酸化剤を含有し、ここで、該 AAT は、天然の AAT、組換え AAT または AAT 改変体である、薬学的組成物。

【請求項 34】

前記組成物は吸入により投与される、請求項 33 に記載の薬学的組成物。

【請求項 35】

前記組成物は固体であり、そして前記患者による吸入のために該固体をエアロゾルへ変換することにより投与される、請求項 34 に記載の薬学的組成物。

【請求項 36】

前記組成物は液体であり、そして前記患者による吸入のために該液体を噴霧化することにより投与される、請求項 34 に記載の薬学的組成物。

【請求項 37】

前記疾患が、エラスターゼ、カテプシン G および / またはプロテイナーゼ 3 の活性に関連する肺疾患である、請求項 33 に記載の薬学的組成物。

【請求項 38】

前記疾患が気腫である、請求項 37 に記載の薬学的組成物。

【請求項 39】

前記疾患は、好中球、肥満細胞または T 細胞の活性化に関連する肺炎症性疾患である、請求項 33 に記載の薬学的組成物。

【請求項 40】

前記疾患がぜん息である、請求項 39 に記載の薬学的組成物。

【請求項 41】

前記疾患が、成人呼吸促進症候群、新生児呼吸促進症候群または敗血症症候群である、請求項 39 に記載の薬学的組成物。

【請求項 42】

前記患者は、前記疾患に感受性であり、そして前記薬学的組成物は予防有効量で投与される、請求項 33 に記載の薬学的組成物。

【請求項 43】

前記患者は前記疾患を有し、そして前記薬学的組成物が、治療有効量で投与される、請求項 33 に記載の薬学的組成物。

【請求項 44】

前記 AAT が、天然に存在する AAT である、請求項 33 に記載の薬学的組成物。

【請求項 45】

前記 AAT が、組換え AAT である、請求項 33 に記載の薬学的組成物。

【請求項 46】

前記 AAT が、AAT 改変体である、請求項 33 に記載の薬学的組成物。

【請求項 47】

前記 AAT が、グリコシル化されている、請求項 33 に記載の薬学的組成物。

【請求項 48】

前記 AAT が、グリコシル化されていない、請求項 33 に記載の薬学的組成物。

【請求項 49】

前記安定化炭水化物が、トレハロースである、請求項 33 に記載の薬学的組成物。

【請求項 50】

前記抗酸化剤が、メチオニン、グルタチオン、システイン、アスコルビン酸および N - アセチルシステインからなる群より選択される、請求項 33 に記載の薬学的組成物。

【請求項 51】

請求項 35 に記載の薬学的組成物であって、前記 AAT、炭水化物、表面活性剤および抗酸化剤は、前記散剤が患者への投与のために水溶液中で可溶化される場合、該 AAT の濃度が 1 mg / ml ~ 100 mg / ml であり、該炭水化物の濃度が 1 % (w / v) ~ 5 %

(w/v)であり、該表面活性剤の濃度が0.01%(w/v)~0.5%(w/v)であり、そして該抗酸化剤の濃度が1mM~10mMであるような量で存在する、薬学的組成物。

【請求項52】

前記AATの濃度が、10mg/ml~50mg/mlである、請求項51に記載の薬学的組成物。

【請求項53】

前記AATの濃度が1mg/ml~100mg/mlであり、前記炭水化物の濃度が1%(w/v)~5%(w/v)であり、前記表面活性剤の濃度が0.01%(w/v)~0.5%(w/v)であり、そして前記抗酸化剤の濃度が1mM~10mMである、請求項36に記載の薬学的組成物。

【請求項54】

前記AATの濃度が、10mg/ml~50mg/mlである、請求項53に記載の薬学的組成物。

【請求項55】

請求項35に記載の薬学的組成物であって、緩衝液をさらに含有し、ここで：

(a) 前記炭水化物がトレハロースであり、前記抗酸化剤がメチオニンであり；そして
(b) 前記AAT、トレハロース、表面活性剤およびメチオニンは、前記散剤が患者への投与のために水溶液中で可溶化される場合、(i) 該AATの濃度が10mg/ml~50mg/mlであり、(ii) 該トレハロースの濃度が10mg/ml~50mg/mlであり、(iii) 該表面活性剤の濃度が0.01%(w/v)~0.5%(w/v)であり、そして(iv) 該メチオニンの濃度が1mM~10mMであるような量で存在する、

薬学的組成物。

【請求項56】

請求項36に記載の薬学的組成物であって、緩衝液をさらに含有し、ここで：

(a) 前記AATの濃度が10mg/ml~50mg/mlであり；
(b) 前記炭水化物がトレハロースであり、該トレハロースの濃度は10mg/ml~50mg/mlであり；
(c) 前記表面活性剤の濃度が0.01%(w/v)~0.5%(w/v)であり；そして
(d) 前記抗酸化剤がメチオニンであり、該メチオニンの濃度が、1mM~10mMである、

薬学的組成物。

【請求項57】

1-抗トリプシン(AAT)欠損に関連する肺疾患を処置するための薬学的組成物であって、該薬学的組成物は、グリコシル化されていない組換えAAT、安定化炭水化物、ならびに表面活性剤および抗酸化剤からなる群より選択される少なくとも1つのさらなる安定化性薬剤を含有し、ここで該AAT/炭水化物の比は、1:1~5:1である、薬学的組成物。

【請求項58】

前記比が1:1~2:1である、請求項57に記載の薬学的組成物。

【請求項59】

前期組成物が吸入により投与される、請求項57に記載の薬学的組成物。

【請求項60】

前記組成物が固体であり、そして前記患者による吸入のために該固体をエアロゾルへ変換することにより投与される、請求項59に記載の薬学的組成物。

【請求項61】

前記組成物は液体であり、そして前記患者による吸入のために該液体を噴霧化することにより投与される、請求項59に記載の薬学的組成物。

【請求項 6 2】

前記疾患は、エラスターゼ、カテプシン G および / または プロテイナーゼ 3 の活性に関連する肺疾患である、請求項 5 9 に記載の薬学的組成物。

【請求項 6 3】

前記疾患が気腫である、請求項 6 2 に記載の薬学的組成物。

【請求項 6 4】

前記疾患は、好中球、肥満細胞または T 細胞の活性化に関連する肺炎症性疾患である、請求項 5 9 に記載の薬学的組成物。

【請求項 6 5】

前記疾患がぜん息である、請求項 6 4 に記載の薬学的組成物。

【請求項 6 6】

前記疾患は、成人呼吸促進症候群、新生児呼吸促進症候群または敗血症症候群である、請求項 6 5 に記載の薬学的組成物。

【請求項 6 7】

前記安定化炭水化物がトレハロースである、請求項 5 9 に記載の薬学的組成物。

【請求項 6 8】

前記組成物は、表面活性剤および抗酸化剤の両方を含有し、該表面活性剤がポリソルベート 8 0 であり、そして該抗酸化剤がメチオニンである、請求項 5 9 に記載の薬学的組成物

。