

【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26年6月26日(2014.6.26)

【公表番号】特表2013-526545(P2013-526545A)

【公表日】平成25年6月24日(2013.6.24)

【年通号数】公開・登録公報2013-033

【出願番号】特願2013-510313(P2013-510313)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/519	(2006.01)
A 6 1 K	9/127	(2006.01)
A 6 1 K	47/28	(2006.01)
A 6 1 K	47/14	(2006.01)
A 6 1 K	47/24	(2006.01)
A 6 1 K	47/18	(2006.01)
A 6 1 P	37/06	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/06	(2006.01)
A 6 1 P	17/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	21/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	35/02	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/519	
A 6 1 K	9/127	
A 6 1 K	47/28	
A 6 1 K	47/14	
A 6 1 K	47/24	
A 6 1 K	47/18	
A 6 1 P	37/06	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	17/00	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	21/00	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	35/02	

【手続補正書】

【提出日】平成26年5月9日(2014.5.9)

【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】

多胞リポソームを含む製剤であって、該多胞リポソームは、ある量のメトトレキサート、1つ以上の両親媒性脂質もしくはその塩、および1つ以上の中性脂質を含有し、該製剤の

投与を必要とする被験体への単一用量の該製剤の投与が、該メトレキサートの、即効型剤形のメトレキサートの血漿C_{max}に対し5%～50%の血漿C_{max}を生じ、ここで、該製剤は、シクロデキストリンを実質的に含まず、そして該被験体における該メトレキサートの持続期間が約1日間～約30日間である、製剤。

【請求項2】

前記メトレキサートがメトレキサートの塩基付加塩を含む、請求項1に記載の製剤。

【請求項3】

前記塩基付加塩がナトリウム塩である、請求項2に記載の製剤。

【請求項4】

前記塩基付加塩がカリウム塩である、請求項2に記載の製剤。

【請求項5】

前記塩基付加塩が対イオンとして有機塩基を含む、請求項2に記載の製剤。

【請求項6】

前記被験体におけるメトレキサートの前記持続期間が、約1日間～約7日間である、請求項1に記載の製剤。

【請求項7】

前記多胞リポソームがフォレートをさらに含む、請求項1に記載の製剤。

【請求項8】

前記多胞リポソームが、コレステロール、1つ以上の両親媒性脂質または1つ以上のその塩、および1つ以上のトリグリセリドを含む、請求項1に記載の製剤。

【請求項9】

前記両親媒性脂質が、1つ以上のホスファチジルコリンもしくはその塩、1つ以上のホスファチジルグリセロールもしくはその塩、またはこれらの組み合わせから選択される、請求項8に記載の製剤。

【請求項10】

前記ホスファチジルグリセロールがDPPG(ジパルミトイロホスファチジルグリセロールを含む、請求項9に記載の製剤。

【請求項11】

前記ホスファチジルコリンがDEC(ジエルコイルホスファチジルコリン)を含む、請求項9に記載の製剤。

【請求項12】

前記ホスファチジルコリンがDOPC(ジオレイルホスファチジルコリン)を含む、請求項9に記載の製剤。

【請求項13】

前記トリグリセリドが、トリオレイン、トリカブリリン、またはそれら2つの組み合わせである、請求項8に記載の製剤。

【請求項14】

前記多胞リポソームがリシンをさらに含む、請求項1に記載の製剤。

【請求項15】

前記メトレキサートの血漿中レベルの持続期間が約1日間、約2日間、約3日間、約4日間、約5日間、約6日間または約7日間である、請求項1に記載の製剤。

【請求項16】

前記製剤が少なくとも2年間、安定である、請求項1に記載の製剤。

【請求項17】

前記製剤が27～31Gの針ゲージを通して送達することができる、請求項1に記載の製剤。

【請求項18】

自己免疫疾患の処置における使用のための請求項1～17に記載の製剤。

【請求項19】

前記自己免疫疾患が、関節リウマチ、乾癬、ループス、強皮症、シェーグレン症候群、グ

ツドパスチャー症候群、ウェゲナー肉芽腫症、リウマチ性多発性筋痛、ギラン・バレー症候群、およびクローニン病からなる群から選択される、請求項18に記載の使用のための製剤。

【請求項20】

前記自己免疫疾患が関節リウマチである、請求項18に記載の使用のための製剤。

【請求項21】

前記自己免疫疾患がループスである、請求項18に記載の使用のための製剤。

【請求項22】

前記自己免疫疾患がクローニン病である、請求項18に記載の使用のための製剤。

【請求項23】

前記メトトレキサートが、メトトレキサートのナトリウム塩またはカリウム塩を含む、請求項18に記載の使用のための製剤。

【請求項24】

前記多胞リポソームがフォレートをさらに含む、請求項18に記載の使用のための製剤。

【請求項25】

前記多胞リポソームに被包されていないフォレートをさらに含む、請求項18に記載の使用のための製剤。

【請求項26】

M T Xを含有しないM V L内に被包されたフォレートをさらに含む、請求項18に記載の使用のための製剤。

【請求項27】

前記多胞リポソームがリシンをさらに含む、請求項18に記載の使用のための製剤。

【請求項28】

前記多胞リポソームが、コレステロール、ホスファチジルコリンもしくはその塩、ホスファチジルグリセロールもしくはその塩、またはこれらの組み合わせから選択される1つ以上の両親媒性脂質、およびトリカブリリンを含む、請求項18に記載の使用のための製剤。

【請求項29】

前記多胞リポソームがD O P Cおよびトリオレインを含む、請求項23に記載の使用のための製剤。

【請求項30】

前記多胞リポソームがD E P Cを含む、請求項23に記載の使用のための製剤。

【請求項31】

前記多胞リポソームがリシンをさらに含む、請求項23に記載の使用のための製剤。

【請求項32】

前記メトトレキサートの血漿中レベルの持続期間が約1日間、約2日間、約3日間、約4日間、約5日間、約6日間または約7日間である、請求項18に記載の使用のための製剤。

【請求項33】

前記製剤の投与が、前記被験体に該製剤を注射することを含む、請求項18に記載の使用のための製剤。

【請求項34】

前記注射が皮下注射である、請求項33に記載の使用のための製剤。

【請求項35】

前記注射が筋肉内注射である、請求項33に記載の使用のための製剤。

【請求項36】

前記注射が皮内注射である、請求項33に記載の使用のための製剤。

【請求項37】

前記注射が腫瘍内注射である、請求項33に記載の使用のための製剤。

【請求項38】

前記注射が脊髄内注射である、請求項 3 3 に記載の使用のための製剤。

【請求項 3 9】

前記注射が 5 日～7 日ごとに投与されるものである、請求項 3 3 に記載の使用のための製剤。

【請求項 4 0】

前記注射が週 1 回、投与されるものである、請求項 3 9 に記載の使用のための製剤。

【請求項 4 1】

癌の処置における使用のための請求項 1～17 に記載の製剤であって、該製剤が、該処置を必要とする被験体に、多くて 2 日ごとに投与されるものである、製剤。

【請求項 4 2】

前記癌が固形腫瘍癌である、請求項 4 1 に記載の使用のための製剤。

【請求項 4 3】

前記癌が、妊娠性絨毛腫瘍、乳癌、頭頸部癌、または肺癌である、請求項 4 2 に記載の使用のための製剤。

【請求項 4 4】

前記妊娠性絨毛腫瘍が、破壊性絨毛腺腫、絨毛癌、または胞状奇胎である、請求項 4 3 に記載の使用のための製剤。

【請求項 4 5】

前記癌が血液由来癌である、請求項 4 1 に記載の使用のための製剤。

【請求項 4 6】

前記血液由来癌が、急性リンパ芽球性白血病、非ホジキンリンパ腫、菌状息肉腫、または骨肉腫である、請求項 4 5 に記載の使用のための製剤。

【請求項 4 7】

前記メトトレキサートが、メトトレキサートのナトリウム塩またはカリウム塩を含む、請求項 4 1 に記載の使用のための製剤。

【請求項 4 8】

前記多胞リボソームが、コレステロール、ホスファチジルコリンもしくはその塩、ホスファチジルグリセロールもしくはその塩、またはこれらの組み合わせから選択される 1 つ以上の両親媒性脂質、およびトリカプリリンを含む、請求項 4 1 に記載の使用のための製剤。

【請求項 4 9】

前記多胞リボソームが D O P C を含む、請求項 4 7 に記載の使用のための製剤。

【請求項 5 0】

前記多胞リボソームがフォレートをさらに含む、請求項 4 1 に記載の使用のための製剤。

【請求項 5 1】

前記多胞リボソームに被包されていないフォレートをさらに含む、請求項 4 1 に記載の使用のための製剤。

【請求項 5 2】

M T X を含有しない M V L 内に被包されたフォレートをさらに含む、請求項 4 1 に記載の使用のための製剤。

【請求項 5 3】

前記多胞リボソームがリシンをさらに含む、請求項 4 7 に記載の使用のための製剤。

【請求項 5 4】

前記製剤の投与が、前記被験体に該製剤を注射することを含む、請求項 4 1 に記載の使用のための製剤。

【請求項 5 5】

前記注射が皮下注射である、請求項 5 4 に記載の使用のための製剤。

【請求項 5 6】

前記注射が 2 日ごとに投与されるものである、請求項 5 4 に記載の使用のための製剤。