

【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 18 年 1 月 5 日 (2006.1.5)

【公表番号】特表 2002-512947 (P2002-512947A)

【公表日】平成 14 年 5 月 8 日 (2002.5.8)

【出願番号】特願 2000-545506 (P2000-545506)

【国際特許分類】

A 6 1 K 38/43 (2006.01)

A 6 1 K 9/127 (2006.01)

A 6 1 K 9/50 (2006.01)

A 6 1 K 47/24 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 P 7/04 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 37/465

A 6 1 K 9/127

A 6 1 K 9/50

A 6 1 K 47/24

A 6 1 K 47/34

A 6 1 P 7/04

【手続補正書】

【提出日】平成 17 年 7 月 14 日 (2005.7.14)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 治療的に有効量の凝固因子 VIII (FVIII) 及び実質的に中性のコロイド状粒子を含有する非経口投与用薬学的組成物であって、前記粒子が生物適合性親水性ポリマーにより誘導された両親媒性リピドを約 1 ~ 20 モルパーセント含有し、前記ポリマーが実質的に正味電荷を帯びていないものである組成物において、

前記 FVIII が前記コロイド状粒子内に被包されていない薬学的組成物。

【請求項 2】 前記コロイド状粒子が、平均粒子直径約 0.05 ないし約 0.4 ミクロンを有する請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 3】 前記コロイド状粒子が平均粒子直径約 0.1 ミクロンを有する請求項 2 の薬学的組成物。

【請求項 4】 前記両親媒性リピドが、天然又は合成源由来のリン脂質である請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 5】 前記両親媒性リピドが、ホスファチジルエタノールアミン (PE) である請求項 4 の薬学的組成物。

【請求項 6】 前記生物適合性親水性ポリマーが、ポリアルキルエーテル、ポリ乳酸及びポリグリコール酸ファミリーからなる群から選択される請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 7】 前記生物適合性親水性ポリマーが、ポリエチレングリコールである請求項 6 の薬学的組成物。

【請求項 8】 前記ポリエチレングリコールが、約 1000 ないし約 5000 ダルトンの分子量を有する請求項 7 の薬学的組成物。

【請求項 9】 前記ポリエチレングリコールが、約 2000 ダルトンの分子量を有する請

求項 8 の薬学的組成物。

【請求項 10】 前記 FVIII が、天然源由来のものである請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 11】 前記 FVIII が、組替えにより調製されたものである請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 12】 前記粒子対 FVIII 比 (w / ユニット FVIII) が、約 0 . 1 m g / ユニットないし約 10 m g / ユニットである請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 13】 前記粒子対 FVIII 比 (w / ユニット FVIII) が、約 1 m g / ユニットである請求項 12 の薬学的組成物。

【請求項 14】 血友病に罹っている患者を治療する方法であって、前記患者に、薬学的に有効量の凝固 VIII 因子 (FVIII) 及び実質的に中性のコロイド状粒子を含有する非経口投与用薬学的組成物を投与することを含み、前記粒子が生物適合性親水性ポリマーにより誘導された両親媒性リピドを約 1 ~ 20 モルパーセント含有し、前記ポリマーが実質的に正味電荷を帯びていないものである方法において、

前記 FVIII が前記コロイド状粒子内に被包されていないものである方法。

【請求項 15】 前記患者が、FVIII 阻害抗体を発現している前記請求項 14 の方法。

【請求項 16】 血友病に罹っている患者の治療のための非経口投与用薬学的組成物の調製におけるコロイド状粒子の使用であって、前記薬学的組成物が治療的に有効量の凝固 VIII 因子 (FVIII) 及び実質的に中性のコロイド状粒子を含み、前記粒子が生物適合性親水性ポリマーにより誘導された両親媒性リピド約 1 ~ 20 モルパーセントを含有し、前記ポリマーが実質的に正味電荷を帯びていないものである使用において、

前記 FVIII が前記コロイド状粒子内に被包されていないものである使用。

【請求項 17】 前記患者が、FVIII 阻害抗体を発現している請求項 16 の使用。

【請求項 18】 薬学的に有効量の蛋白又はポリペプチド及び実質的に中性のコロイド状粒子を含有する非経口投与用薬学的組成物であって、前記粒子が生物適合性親水性ポリマーにより誘導された両親媒性リピドを約 1 ~ 20 モルパーセント含有し、前記ポリマーが実質的に正味電荷を帯びていないものである薬学的組成物において、

前記蛋白又はポリペプチドが、

(a) 前記コロイド状粒子の外側に結合し得る蛋白又はポリペプチド、及び

(b) ポリエチレングリコールに結合し得る蛋白又はポリペプチド

からなる群から選択され、並びに

前記蛋白又はポリペプチドが前記コロイド状粒子内に被包されていないものである薬学的組成物。

【請求項 19】 非経口投与用薬学的組成物の調製におけるコロイド状粒子の使用であって、前記薬学的組成物が治療的に有効量の蛋白又はポリペプチド及び実質的に中性のコロイド状粒子を含み、前記粒子が生物適合性親水性ポリマーにより誘導された両親媒性リピドを約 1 ~ 20 モルパーセント含有し、前記ポリマーが実質的に正味電荷を帯びていないものである使用において、

前記蛋白又はポリペプチドが、

(a) 前記コロイド状粒子の外側に結合し得る蛋白又はポリペプチド、及び

(b) ポリエチレングリコールに結合し得る蛋白又はポリペプチド

からなる群から選択されるものであり、並びに

前記蛋白又はポリペプチドが前記コロイド状粒子内に被包されていないものである使用

。

【請求項 20】 前記コロイド状粒子が、さらに天然又は合成源から得られた第 2 の両親媒性リピドを含む請求項 1 の薬学的組成物。

【請求項 21】 前記第 2 の両親媒性リピドが、ホスファチジルコリンである請求項 20 の薬学的組成物。