

【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17年7月14日(2005.7.14)

【公表番号】特表2001-511765(P2001-511765A)

【公表日】平成13年8月14日(2001.8.14)

【出願番号】特願平10-520186

【国際特許分類第7版】

A 6 1 K 49/00

A 6 1 K 9/12

A 6 1 K 31/40

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 47/02

A 6 1 K 47/06

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/16

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 51/00

【F I】

A 6 1 K 49/00 C

A 6 1 K 9/12

A 6 1 K 31/40

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 47/02

A 6 1 K 47/06

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/16

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 43/00

【手続補正書】

【提出日】平成16年10月27日(2004.10.27)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】補正の内容のとおり

【補正方法】変更

【補正の内容】

手続補正書

平成16年10月27日

特許庁長官 殿

1. 事件の表示

平成10年特許願第520186号

2. 補正をする者

名 称 アメルシャム ヘルス アクスイエ セルスカブ

3. 代 理 人

識別番号 ~~100003908~~

住 所 東京都港区赤坂1丁目9番20号

第16興和ビル南館2階

日本ゼネラル・エレクトリック株式会社・極東特許部内

電話(3588)5200-5207

氏 名 弁理士(9390) 松 本 研



4. 補正対象書類名

明細書

5. 補正対象項目名

特許請求の範囲

6. 補正の内容

別紙の通り

方 式
審 査

特許請求の範囲

1. 気体含有又は気体発生物質を含むレポーターを水性キャリア液中に懸濁してなる懸濁液を含む標的設定可能な診断用及び／又は治療活性薬剤であって、当該薬剤が標的と2種以上の結合対を形成することができ、上記気体含有又は気体発生物質が2以上のベクター又は2箇所以上の結合部位に結合可能なベクター1個に結合している、薬剤。
2. 気体が空気、窒素、酸素、二酸化炭素、水素、不活性ガス、フッ化イオウ、六フッ化セレン、低分子量炭化水素、ケトン、エステル、ハロゲン化低分子量炭化水素又はこれらの混合物を含む、請求項1記載の薬剤。
3. 気体が過フッ化ケトン、過フッ化エーテル又はパーフルオロカーボンである、請求項2記載の薬剤。
4. 気体が六フッ化イオウ、パーフルオロプロパン、パーフルオロブタン又はパーフルオロペンタンを含む、請求項2記載の薬剤。
5. コアレセンス耐性表面膜、膜形成性蛋白、重合体物質、非重合体及び非重合性の壁形成性物質又は界面活性剤により安定化された微小気泡を有する、請求項1乃至請求項4のいずれか1項記載の薬剤。
6. 界面活性剤が1種以上のリン脂質を含む、請求項5記載の薬剤。
7. 界面活性剤物質の75%以上が正味全電荷を個々に有するリン脂質分子を含む、請求項6記載の薬剤。
8. 膜形成性界面活性剤物質の75%以上がホスファチジルセリン、ホスファチジルグリセロール、ホスファチジイルノシトール、ホスファチジン酸及びカルジオリピンから選択されるリン脂質1種以上を含む、請求項7記載の薬剤。
9. 上記リン脂質の80%以上がホスファチジルセリンを含む、請求項8記載の薬剤。
10. 気体含有又は気体発生物質が、1以上の細胞表面受容体に対する特異性を有する1以上の標的設定ベクターに結合しているとともに、治療応答を誘発できるように受容体系に結合可能な部分も更に有している、請求項1乃至請求項9のいずれか1項記載の薬剤。
11. ベクターが、抗体；細胞付着分子；細胞付着分子受容体；サイトカイン；生育因子；ペプチドホルモン及びその部分；細胞付着分子、サイトカイン、生育因子及びペプチドホルモンに対する受容体の非生物活性バインダー；オリゴヌクレオチド及び修飾オリゴヌクレオチド；DNA結合剤；プロテアーゼ基質／阻害剤；コンビナトリアルライブラリから得られた分子；小型生物活性分子；及び細胞表面プロテオグリカンに結合する蛋白及びペプチドから選択される、請求項1乃至請求項10のいずれか1項記載の薬剤。
12. 標的に対するベクターの親和性が、当該薬剤が標的と相互作用するが標的と固定的には結合しない程度である、請求項1乃至請求項11のいずれか1項記載の薬剤。
13. ベクターが、細胞付着蛋白に対するリガンド及び内皮細胞表面上に相当するリガンドを有する細胞付着蛋白から選択される、請求項12記載の薬剤。
14. ベクターが標的に容易に曝露されないような部位に位置づけられている、請求項1乃至請求項13のいずれか1項記載の薬剤。
15. ベクターがレポーターにアビジン－ビオチン及び／又はストレプトアビジン－ビオチン相互作用によってカップリング又は連結している、請求項1乃至請求項14のいずれか1項記載の薬剤。
16. ベクターがレポーターに共有結合又は非共有結合でカップリング又は連結している、請求項1乃至請求項14のいずれか1項記載の薬剤。
17. ベクターがレポーターに静電相互作用によってカップリング又は連結している、請求項1乃至請求項14のいずれか1項記載の薬剤。
18. 放射性部分又はX線造影剤、光造影プローブもしくはスピン標識として有効な部分を更に含んでいる、請求項1乃至請求項17のいずれか1項記載の薬剤。
19. 治療化合物を更に含有する請求項1乃至請求項18のいずれか1項記載の薬剤。
20. 治療化合物が抗新生物薬、血液製剤、生物学的応答調節剤、抗カビ剤、ホルモン又

- はホルモン類縁体、ビタミン、酵素、抗アレルギー剤、組織因子抑制剤、血小板抑制剤、凝固蛋白標的抑制剤、フィブリン形成抑制剤、フィブリン溶解促進剤、抗血管形成剤、循環薬、代謝強化剤、抗結核剤、抗ウイルス剤、血管拡張剤、抗生物質、抗炎症剤、抗抗原虫剤、抗リウマチ剤、麻酔剤、アヘン剤、強心配糖体、神経筋ブロック剤、鎮静剤、局所麻酔薬、全身麻酔薬又は遺伝子物質である、請求項 19 記載の薬剤。
21. 治療化合物がジスルフィド基を介してレポーターに共有結合でカップリング又は連結している、請求項 19 又は請求項 20 記載の薬剤。
22. 親油性治療化合物又は親油性誘導体化治療化合物が疎水性相互作用を介してレポーターに連結している、請求項 19 又は請求項 20 記載の薬剤。
23. 下記成分：
- i) 選択された標的に対して親和性を有する予備標的設定ベクターを有する第 1 の投与可能な組成物；及び
 - ii) 上記予備標的設定ベクターに対して親和性を有するベクターを有する請求項 1 乃至請求項 22 のいずれか 1 項記載の薬剤を含む第 2 の投与可能な組成物
- を含む複合製剤。
24. 予備標的設定ベクターがモノクローナル抗体である、請求項 23 記載の複合製剤。
25. 下記成分：
- i) 請求項 1 乃至請求項 22 のいずれか 1 項記載の薬剤を含む第 1 の投与可能な組成物；及び
 - ii) 上記薬剤をその標的から置換又は放出させることのできる物質を含有する第 2 の投与可能な組成物
- を含む複合製剤。
26. 下記成分：
- i) 請求項 21 記載の薬剤を含む第 1 の投与可能な組成物；及び
 - ii) 上記第 1 の投与可能な組成物の薬剤中の治療化合物とレポーターをカップリング又は連結しているジスルフィド基を還元的に切断し得る還元剤を含む第 2 の投与可能な組成物
- を含む複合製剤。
27. 請求項 1 記載の標的設定可能な診断用及び／又は治療活性薬剤の調製方法であって、薬剤が標的と 2 種以上の結合対を形成できるように気体含有又は気体発生物質を含有するレポーターに 1 以上のベクターをカップリング又は連結することを含む方法。
28. 治療化合物もレポーターと結合させる、請求項 27 記載の方法。
29. 請求項 1 乃至請求項 22 のいずれか 1 項記載の薬剤を標的設定超音波造影剤として使用する方法。
30. 請求項 1 乃至請求項 22 のいずれか 1 項記載の薬剤をヒト又はヒト以外の動物の身体に投与し、身体の一部の超音波、磁気共鳴、X線、放射線又は光による像を形成させることからなる身体を増強された像を形成させる方法。
31. 下記工程：
- i) 選択された標的に対して親和性を有する予備標的設定ベクターを上記身体に投与し；しかる後
 - ii) 上記予備標的設定ベクターに対して親和性を有するベクターを有する請求項 1 乃至請求項 22 のいずれか 1 項記載の薬剤を投与する
- ことを含む、請求項 30 記載の方法。
32. 予備標的設定ベクターがモノクローナル抗体である、請求項 31 記載の方法。
33. 下記工程：
- i) 請求項 1 乃至請求項 22 のいずれか 1 項記載の薬剤を上記身体に投与し；しかる後、
 - ii) 上記薬剤をその標的から置換又は放出させることのできる物質を投与する
- ことを含む請求項 30 記載の方法。
34. 薬剤が更に治療化合物を含有する、請求項 30 乃至請求項 33 のいずれか 1 項記載

の方法。

35. 治療化合物がジスルフィド基を介してレポーターに共有結合でカップリング又は連結しており、ジスルフィド基を還元的に切断し得る還元剤を含有する組成物を後から投与する、請求項34記載の方法。
36. 請求項1乃至請求項22のいずれか1項記載の薬剤による標的のイン・ビトロ検査方法であって、標的発現細胞がフローチャンバー内に固定して配置されており、キャリア液中に薬剤を懸濁してなる懸濁液を上記チャンバーに通し、上記細胞への該薬剤の結合を測定する、方法。
37. 生体内で起こるせん断速度を模擬すべくキャリア液の流量を制御する、請求項36記載の方法。