

【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11月10日(2005.11.10)

【公表番号】特表2002-504090(P2002-504090A)

【公表日】平成14年2月5日(2002.2.5)

【出願番号】特願平10-540262

【国際特許分類第7版】

A 6 1 K 9/10

A 6 1 K 9/50

A 6 1 K 38/00

A 6 1 K 38/43

A 6 1 K 39/395

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 47/24

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/34

C 1 2 N 15/09

// C 0 7 K 14/505

C 1 2 N 9/16

【F I】

A 6 1 K 9/10

A 6 1 K 9/50

A 6 1 K 39/395 A

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 47/24

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 37/02

A 6 1 K 37/48

C 1 2 N 15/00 A

C 0 7 K 14/505

C 1 2 N 9/16 A

C 1 2 N 9/16 B

【手続補正書】

【提出日】平成17年3月18日(2005.3.18)

【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17年3月18日

特許庁長官殿



1. 事件の表示

平成10年特許願第540262号

2. 補正をする者

事件との関係 特許出願人

名 称 エラン ドラッグ デリバリー リミテッド



3. 代 理 人

居 所 〒100-0004 東京都千代田区大手町二丁目2番1号

新 大 手 町 ビ ル ザ ン グ 3 3 1

電 話 (3 2 1 1) 3 6 5 1 (代 表)

氏 名 (6 6 6 9) 浅 村 皓



4. 補正により増加する請求項の数 2

5. 補正対象書類名

請求の範囲

6. 補正対象項目名

請求の範囲

7. 補正の内容 別紙のとおり



請 求 の 範 囲

1. マイクロ粒子が不溶性の非水性液体である連続相に懸濁したマイクロ粒子の不連続相を含む液体調合物中の安定な粒子であって、マイクロ粒子は、少なくとも1種の生物分子生成物を保持する微粉末化された糖ガラスを含み、糖ガラス中の生物分子生成物は安定な固体溶液中に存在するかまたはそれ自体糖ガラス中の懸濁物中に存在する粒子。
2. 連続相は低いまたはきわめて低いHLB値の脂溶性界面活性剤を包含する請求項1記載の調合物。
3. 糖ガラスは、トレハロース、パラチニット、グルコピラノシルソルビトール、グルコピラノシルマンニトール、ラクチトールならびにマンニトールおよびイノシトールのような単糖アルコールからなる群より選択される1種または2種以上の糖から形成される請求項1または2記載の調合物。
4. 非水性連続相は生物適合性である請求項1記載の調合物。
5. 非水性連続相は疎水性溶媒である請求項1記載の調合物。
6. 非水性連続相は水混和性である請求項1記載の調合物。
7. 糖ガラスマイクロ粒子は直径約0.1~10 μ 、好ましくは直径10 μ 未満、たとえば直径1または2または5 μ 、最も好ましくは直径1 μ 未満である請求項1~7のいずれかに記載の調合物。
8. マイクロ粒子は粒子サイズに大きな違いを示さない請求項7記載の調合物。
9. マイクロ粒子は本質的に乾燥していて、約1%未満のきわめて低い水分含量を有する請求項1~8のいずれかに記載の調合物。
10. 生物分子生成物は薬物または他の生物学的に活性な成分たとえばタンパク質、抗体、酵素（たとえば制限エンドヌクレアーゼ）等であり、生物学的材料たとえば食品、染料、飲料等を包含する請求項1~9のいずれかに記載の調合物。
11. マイクロ粒子は連続相内で単一分散相懸濁液を構成する請求項1~10のいずれかに記載の調合物。
12. 不連続相中に約1%~50%以上たとえば約10重量%のマイクロ粒子を含有する請求項1~11のいずれかに記載の調合物。
13. 連続相中における界面活性剤の量は約0.01容量%~約10容量%、たとえば

1 容量%である請求項 2 記載の調合物。

14. ソルビタンセスキオレエート、マンニッドモノオレエート、ソルビタントリステアレートおよびグリセロールモノステアレート、レシチン（ホスファチジルコリン）、ジパルミトイルホスファチジルコリン、ジステアロイルホスファチジルコリン、ジミリストイルホスファチジルコリンならびにソルビタンラウレート、パルミテート、ステアレートおよびオレエートからなる群より選択される 1 種または 2 種以上の界面活性剤を含有する請求項 2 または 13 記載の調合物。

15. 連続非水液体相は、胡麻油、落花生油、大豆油、エチルオレエートおよび鉱油からなる群より選択される 1 種または 2 種以上の疎水性非毒性溶媒を包含するまたはそれらから構成される請求項 1 または 2 記載の調合物。

16. 連続非水液体相はポリエチレングリコール、グリセロール、エチレングリコール、プロピレングリコール、プロピレンオキシド、ポリプロピレングリコールからなる群より選択される水混和性の非水性溶媒からなるかまたは構成される請求項 1 または 2 記載の調合物。

17. 液体調合物中で安定な粒子を製造する方法において、糖ガラス中に保持された 1 種または 2 種以上の生物分子生成物を含有するマイクロ粒子を製造し、そのマイクロ粒子を粒子が不溶性であり懸濁液を形成する非水性連続液体相に添加し、糖ガラス中の生物分子生成物を安定な固体溶液とするかまたはそれ自体を糖ガラス中に懸濁液とする各工程からなる方法。

18. マイクロ粒子の単相分散性単一粒子懸濁液を少なくとも 1 種の低いまたはきわめて低い HLB を有する界面活性剤の連続相に包含させることによって非水性連続液体相に製造する請求項 17 記載の方法。

19. 粒子の添加前に連続非水性液体相に界面活性剤を加える請求項 18 記載の方法。

20. 生物分子生成物は薬物前駆体であり、最終活性薬剤成分は前駆体が患者にその調合物を投与したのち体液によって湿潤したときのみを開始される化学反応によって合成または放出される二次薬物調合物である請求項 1 または 2 記載の調合物。

21. 2 種以上の生物分子生成物を保持するマイクロ粒子を含有する請求項 1 ま

たは 2 記載の調合物。

22. 水性環境と接触された場合に 1 種またはそれ以上の生物分子生成物を放出するマイクロ粒子の混合物を含有する請求項 1、2 または 2 2 記載の調合物。

23. 2 種またはそれ以上の生物分子生成物が、水性環境中に放出された場合に相互作用する請求項 21 または 22 記載の調合物。

24. 生物分子生成物は制限エンドヌクレアーゼ酵素であり、調合物は DNA の水性溶液と接触すると、糖ガラス中に保持された懸濁酵素が DNA を含有する水相に溶解し DNA を切断できる請求項 1 または 2 記載の調合物を使用する DNA の切断方法。