

【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20年7月3日 (2008.7.3)

【公表番号】特表2003-533469(P2003-533469A)

【公表日】平成15年11月11日 (2003.11.11)

【出願番号】特願2001-583737(P2001-583737)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/20 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/28 (2006.01)

A 6 1 K 47/44 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 K 38/28 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 9/12

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/20

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/28

A 6 1 K 47/44

A 6 1 P 3/10

A 6 1 K 37/26

【手続補正書】

【提出日】平成20年5月2日 (2008.5.2)

【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】 薬学的組成物であって、

有効量の高分子薬剤と、

アルカリ金属アルキルサルフェートと、

レシチン、ヒアルロン酸、グリコール酸、乳酸、カモミール抽出物、キュウリ抽出物、オレイン酸、リノール酸、リノレン酸、モノオレイン、モノオレエート、モノラウレート、ルリヂサ油、マツヨイグサ油、メントール、トリヒドロキシオキソコラニルグリシン、グリセリン、ポリグリセリン、リジン、ポリリジン、トリオレイン、ポリオキシエチレンエーテル、ポリドカノールアルキルエーテル、ケノデオキシコレート、デオキシコレート、それらの薬学的に許容される塩、それらのアナログ、及びそれらの混合物又は組合せからなる群から選択される 3 種類以上のミセル形成化合物と、

適当な溶媒と、を含んでおり、

アルカリ金属アルキルサルフェート及びミセル形成化合物の各々は、濃度が組成物全体

の約 0.1 - 20 wt./wt.% で存在しており、アルカリ金属アルキルサルフェートとミセル形成化合物の合計濃度は、組成物全体の 50 wt./wt.% よりも少なく、

前記高分子薬剤はミセルの形態である薬学的組成物。

【請求項 2】 アルカリ金属アルキルサルフェートの濃度は、組成物全体の約 5 wt./wt.% よりも少ない請求項 1 の組成物。

【請求項 3】 アルカリ金属アルキルサルフェートは、アルカリ金属 C8 - C22 アルキルサルフェートである請求項 1 の組成物。

【請求項 4】 アルカリ金属 C8 - C22 アルキルサルフェートはラウリル硫酸ナトリウムである請求項 3 の組成物。

【請求項 5】 3 種類以上のミセル形成化合物の各々は、濃度が、組成物全体の約 0.1 - 5 wt./wt.% である請求項 1 の組成物。

【請求項 6】 レシチンは、飽和又は不飽和であり、ホスファチジルコリン、ホスファチジルセリン、スフィンゴミエリン、ホスファチジルエタノールアミン、セファリン及びビリゾレシチンからなる群から選択される請求項 1 の組成物。

【請求項 7】 ミセル形成化合物の 1 種は、ヒアルロン酸、ヒアルロン酸の薬学的に許容される塩、ポリドカノールアルキルエーテル、トリヒドロキシオキソコラニルグリシン、トリヒドロキシオキソコラニルグリシンの薬学的に許容される塩、ポリオキシエチレンエーテル、ポリオキシエチレンエーテルのアナログ、ケノデオキシコレート及びそれらの混合物からなる群から選択され、ミセル形成化合物の濃度は、組成物全体の約 0.1 - 5 wt./wt.% である請求項 1 の組成物。

【請求項 8】 ヒアルロン酸の塩は、アルカリ金属のヒアルロン酸塩、アルカリ土類のヒアルロン酸塩及びヒアルロン酸アルミニウムからなる群から選択され、前記塩の濃度は組成物全体の約 0.1 - 5 wt./wt.% である請求項 7 の組成物。

【請求項 9】 3 種類のミセル形成化合物は、トリヒドロキシオキソコラニルグリシン、ポリオキシエチレンエーテル及びレシチンである請求項 4 の組成物。

【請求項 10】 3 種類のミセル形成化合物は、トリヒドロキシオキソコラニルグリシン、デオキシコレート及びグリセリンである請求項 4 の組成物。

【請求項 11】 3 種類のミセル形成化合物は、ポリドカノール 9 ラウリルエーテル、ポリリジン及びトリオレインである請求項 4 の組成物。

【請求項 12】 薬剤は、インシュリン、ヘパリン、低分子量ヘパリン、ヒルログ、ヒルゲン、フリジン、インターフェロン、サイトカイン、モノクローナル抗体、ポリクローナル抗体、イムノグロビン、化学治療剤、ワクチン、糖蛋白、細菌トキソイド、ホルモン、カルシトニン、グルカゴン様ペプチド、高分子抗生物質、蛋白質基の血栓溶解化合物、血小板阻害剤、DNA、RNA、遺伝子治療剤、アンチセンスオリゴヌクレオチド、オピオイド、麻酔薬、鎮痛薬、ステロイド及び鎮痛剤からなる群から選択される請求項 1 の組成物。

【請求項 13】 薬剤は、インシュリンである請求項 1 の組成物。

【請求項 14】 組成物の pH は、5 乃至 8 の範囲である請求項 1 の組成物。

【請求項 15】 ミセルのサイズは、約 1 ~ 10 ナノメートルである請求項 1 の組成物。

【請求項 16】 溶媒は、水及びエタノールからなる群から選択される請求項 1 の組成物。

【請求項 17】 フェノール化合物、酸化防止剤、プロテアーゼ阻害剤及び無機塩からなる群から選択される 1 又は 2 種以上の要素をさらに含んでいる請求項 1 の組成物。

【請求項 18】 組成物は、フェノール、m-クレゾール及びそれらの混合物からなる群から選択されるフェノール化合物を、組成物全体の約 0.1 - 10 wt./wt.% の濃度で含んでいる請求項 17 の組成物。

【請求項 19】 酸化防止剤は、トコフェロール、デターオキシムメシレート、メチルパラベン、エチルパラベン、アスコルビン酸及びそれらの混合物からなる群から選択される請求項 17 の組成物。

【請求項 20】 プロテアーゼ阻害剤は、バシトラシン、バシトラシン誘導体、大豆トリプシン及びアプロチニンからなる群から選択される請求項 17 の組成物。

【請求項 21】 無機塩は、ナトリウム、カリウム、カルシウム及び亜鉛の塩からなる群から選択される請求項 17 の組成物。

【請求項 22】 混合ミセルの薬学的組成物であって、アルカリ金属アルキルサルフェート及び少なくとも 3 種類の化合物を用いて形成されたミセルに被包された高分子薬剤を含んでおり、前記化合物は、レシチン、ヒアルロン酸、グリコール酸、乳酸、カモミール抽出物、キュウリ抽出物、オレイン酸、リノール酸、リノレン酸、モノオレイン、モノオレエート、モノラウレート、ルリヂサ油、マツヨイグサ油、メントール、トリヒドロキシオキソコラニルグリシン、グリセリン、ポリグリセリン、リジン、ポリリジン、トリオレイン、ポリオキシエチレンエーテル、ポリドカノールアルキルエーテル、ケノデオキシコレート、デオキシコレート、それらの薬学的に許容される塩、それらのアナログ、及びそれらの混合物又は組合せからなる群から選択される、薬学的組成物。

【請求項 23】 薬学的組成物を作る方法であって、

有効量の高分子薬剤組成物を、適当な溶媒の中で、アルカリ金属アルキルサルフェート及び 3 種類以上のミセル形成化合物と混合することを含んでおり、前記化合物は、レシチン、ヒアルロン酸、グリコール酸、乳酸、カモミール抽出物、キュウリ抽出物、オレイン酸、リノール酸、リノレン酸、モノオレイン、モノオレエート、モノラウレート、ルリヂサ油、マツヨイグサ油、メントール、トリヒドロキシオキソコラニルグリシン、グリセリン、ポリグリセリン、リジン、ポリリジン、トリオレイン、ポリオキシエチレンエーテル、ポリドカノールアルキルエーテル、ケノデオキシコレート、デオキシコレート、それらの薬学的に許容される塩、それらのアナログ、及びそれらの混合物又は組合せからなる群から選択され、

アルカリ金属アルキルサルフェート及びミセル形成化合物の各々は、濃度が組成物全体の 0.1 - 20 wt. / wt. % で存在し、アルカリ金属アルキルサルフェートとミセル形成化合物の合計濃度は、組成物全体の 50 wt. / wt. % よりも少ない濃度である、方法。

【請求項 24】 a) 高分子薬剤は適当な溶媒の中でアルカリ金属アルキルサルフェートと混合され、第 1 のミセル組成物を生成し、

b) 3 種類以上の追加のミセル形成化合物は、ステップ a の第 1 ミセル組成物と混合される請求項 23 の方法。

【請求項 25】 ミセル形成化合物の 1 種はアルカリ金属アルキルサルフェートと同時に加えられ、第 1 ミセル組成物を生成する請求項 24 の方法。

【請求項 26】 安定剤を加えるステップをさらに含んでいる請求項 23 の方法。

【請求項 27】 防腐剤、酸化防止剤、プロテアーゼ阻害剤及び無機塩のうちの 1 又は 2 種以上を、混合ミセル薬学的組成物に加えるステップをさらに含んでいる請求項 23 の方法。

【請求項 28】 混合は、磁気攪拌機、プロペラ攪拌機及びソニケータからなる群から選択される高速攪拌機を用いて行われる請求項 23 の方法。

【請求項 29】 3 種類のミセル形成化合物は、トリヒドロキシオキソコラニルグリシン、ケノデオキシコレート及びグリセリンである請求項 4 の組成物。

【請求項 30】 3 種類のミセル形成化合物は、トリヒドロキシオキソコラニルグリシン、ポリオキシエチレンエーテル及びグリセリンである請求項 4 の組成物。

【請求項 31】 アルカリ金属アルキルサルフェートとミセル形成化合物の合計濃度は、組成物全体の 4 wt. / wt. % よりも少ない濃度である請求項 1 の組成物。

【請求項 32】 溶媒は水である請求項 1 の組成物。