

【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】令和 3 年 7 月 26 日 (2021.7.26)

【公表番号】特表 2020-518651 (P2020-518651A)

【公表日】令和 2 年 6 月 25 日 (2020.6.25)

【年通号数】公開・登録公報 2020-025

【出願番号】特願 2019-561277 (P2019-561277)

【国際特許分類】

A 6 1 K 47/34 (2017.01)

A 6 1 K 9/16 (2006.01)

A 6 1 K 38/02 (2006.01)

A 6 1 K 38/03 (2006.01)

A 6 1 K 38/04 (2006.01)

A 6 1 K 38/08 (2019.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

C 0 7 K 14/78 (2006.01)

C 0 7 K 14/00 (2006.01)

C 0 7 K 7/06 (2006.01)

C 0 7 K 7/08 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 9/16

A 6 1 K 38/02

A 6 1 K 38/03

A 6 1 K 38/04

A 6 1 K 38/08

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 3/10

C 0 7 K 14/78 Z N A

C 0 7 K 14/00

C 0 7 K 7/06

C 0 7 K 7/08

【手続補正書】

【提出日】令和 3 年 5 月 7 日 (2021.5.7)

【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】

1 : 1 を超える乳酸 (L A) のグリコール酸 (G A) に対する比 (L / G) を有するポリ (ラクチド - c o - グリコリド) (P L G A) を含む微粒子であって、
前記微粒子がさらに、 I V 型コラーゲンの 5 線維に由来する抗血管新生ペプチドを含む、前記微粒子。

【請求項 2】

前記 P L G A が少なくとも 6 0 : 4 0 の L / G である請求項 1 に記載の微粒子。

【請求項 3】

前記 P L G A が 6 5 : 3 5 の L / G である請求項 2 に記載の微粒子。

【請求項 4】

前記 P L G A が 7 5 : 2 5 の L / G である請求項 2 に記載の微粒子。

【請求項 5】

前記 P L G A が 8 5 : 1 5 の L / G である請求項 2 に記載の微粒子。

【請求項 6】

前記抗血管新生ペプチドがアミノ酸配列 L R R F S T X P X X X X N I N N V X N F (配列番号 1) を有し、その際、X は標準アミノ酸または遺伝的にコードされていないアミノ酸である請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の微粒子。

【請求項 7】

前記抗血管新生ペプチドがアミノ酸配列 L R R F S T X P X X X X D I N D V X N F (配列番号 2) を有し、その際、X は標準アミノ酸または遺伝的にコードされていないアミノ酸である請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の微粒子。

【請求項 8】

前記抗血管新生ペプチドが L R R F S T A P F A F I D I N D V I N F (配列番号 3) または L R R F S T A P F A F I N I N N V I N F (配列番号 4) である請求項 6 または 7 に記載の微粒子。

【請求項 9】

前記抗血管新生ペプチドが
 L R R F S T A P F A F I D I N D V I N W (配列番号 5) 、
 F T N I N N V T N (配列番号 6) 、
 F T D I N D V T N (配列番号 7) 、
 (4 - C l P h e) (A b u) N I N N V (A b u) N F (配列番号 8) 、
 A (A b u) N I N N V (A b u) N F (配列番号 9) 、
 F (A b u) N I N N V (A b u) N (配列番号 10) 、
 F (A l l y G l y) N I N N V (A l l y G l y) N F (配列番号 11) 、
 F A N I N N V A N F (配列番号 12) 、
 F I D I N D V I N F (配列番号 13) 、
 F I D I N D V I N W (配列番号 14) 、
 F I N I N N V I N F (配列番号 15) 、
 F S N I N N V S N F (配列番号 16) 、
 F V N I N N V V N F (配列番号 17) 、
 (d L) R R (d L) R R F S T A P F A F I D I N D V I N F (配列番号 18) 、
 (d L) R R F S T A P F A F I D I N D V I N (d F) (配列番号 19) 、
 L R R F S T A P F (d A) F I D I N D V I N F (配列番号 20) 、
 L R R F S T A P F A F I D I N D V I N (d F) (配列番号 21) 、
 L R R F S T A P F d A F I D I N D V I N F (配列番号 22) 、
 L R R F S T M P A M F (A b u) N I N N V (A b u) N F (配列番号 23) 、
 L R R F S T M P F (d A) F I N I N N V I N F (配列番号 24) 、
 L R R F S T M P F (N l e) F (A b u) N I N N V (A b u) N F (配列番号 25)
 、
 L R R F S T M P F A F (A b u) N I N N V (A b u) N F (配列番号 26) 、
 L R R F S T M P F A F I N I N N V I N F (配列番号 27) 、
 L R R F S T M P F d A F I N I N N V I N F (配列番号 28) 、
 L R R F S T M P F M (4 - C l P h e) (A b u) N I N N V (A b u) N F (配列番号 29) 、
 L R R F S T M P F M A (A b u) N I N N V (A b u) N F (配列番号 30) 、
 L R R F S T M P F M F (A b u) N I N N V (A b u) N F (配列番号 31) 、
 L R R F S T M P F M F (A l l y G l y) N I N N V (A l l y G l y) N F (配列番号 32)

号 3 2)、

L R R F S T M P F M F A N I N N V A N F (配列番号 3 3)、

L R R F S T M P F M F G N I N N V G N F (配列番号 3 4)、

L R R F S T M P F M F I N I N N (配列番号 3 5)、

L R R F S T M P F M F I N I N N V I N F (配列番号 3 6)、

L R R F S T M P F M F S N I N N V S N F (配列番号 3 7)、

L R R F S T M P F M F T N I N N (配列番号 3 8)、

L R R F S T M P F M F T N I N N V T N F (配列番号 3 9)、または

L R R F S T M P F M F V N I N N V V N F (配列番号 4 0)

のいずれか 1 つである請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の微粒子。

【請求項 1 0】

前記微粒子がほぼ球形である請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の微粒子。

【請求項 1 1】

前記微粒子が非球形である、たとえば、楕円体である請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の微粒子。

【請求項 1 2】

さらに、P L G A - P E G コポリマーを含む請求項 1 ~ 1 1 のいずれか 1 項に記載の微粒子。

【請求項 1 3】

約 1 0 % ~ 約 9 5 % の P L G A - P E G コポリマー (ポリマーの質量で) を含む請求項 1 2 に記載の微粒子。

【請求項 1 4】

前記微粒子が前記微粒子の重量で約 0 . 1 % ~ 約 2 0 % のペプチドを含む請求項 1 ~ 1 3 のいずれか 1 項に記載の微粒子。

【請求項 1 5】

請求項 1 ~ 1 4 のいずれか 1 項に記載の微粒子と、薬学上許容できるキャリアまたは賦形剤とを含む医薬組成物。

【請求項 1 6】

過剰な遊離のペプチドをさらに含み、前記過剰な遊離のペプチドは配列番号 1 または配列番号 2 (X は標準アミノ酸または遺伝的にコードされていないアミノ酸である) であってもよい請求項 1 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 7】

配列番号 3 ~ 配列番号 4 0 から選択される過剰な遊離のペプチドをさらに含む請求項 1 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 8】

約 2 0 % ~ 約 9 5 % の遊離のペプチド (モルで)を含む請求項 1 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 9】

前記微粒子によって含まれる前記抗血管新生ペプチドが前記遊離のペプチドと同じペプチドである請求項 1 7 または 1 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 0】

前記微粒子によって含まれる前記抗血管新生ペプチドが前記遊離のペプチドとは異なるペプチドである請求項 1 7 または 1 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 1】

黄斑変性症、黄斑浮腫、網膜静脈閉塞症及び糖尿病性網膜症の 1 以上の治療を必要とする対象において当該治療をするための、請求項 1 5 ~ 2 0 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 2】

前記対象が加齢性黄斑変性症 (A M D) を有する請求項 2 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 3】

前記 A M D が湿性 A M D である請求項 2 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 4】

前記対象が糖尿病性黄斑浮腫を有する請求項 2 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 5】

前記対象が網膜静脈閉塞症または糖尿病性網膜症を有する請求項 2 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 6】

月に 1 回だけ投与される請求項 2 1 ~ 2 5 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 7】

2ヵ月ごとに 1 回だけ投与される請求項 2 1 ~ 2 5 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 8】

3ヵ月ごとに 1 回だけ投与される請求項 2 1 ~ 2 5 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 9】

4ヵ月ごとに 1 回だけ投与される請求項 2 1 ~ 2 5 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 3 0】

5ヵ月または 6 ヲ月ごとに 1 回だけ投与される請求項 2 1 ~ 2 5 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 3 1】

前記対象の状態が難治性である、または V E G F 遮断療法に部分的にしか応答しない請求項 2 1 ~ 3 0 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 3 2】

V E G F 遮断療法の代わりに投与される請求項 3 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 3】

V E G F 遮断療法を受けている前記対象に投与される請求項 3 1 に記載の医薬組成物。