

【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2年6月18日(2020.6.18)

【公表番号】特表2019-521179(P2019-521179A)

【公表日】令和1年7月25日(2019.7.25)

【年通号数】公開・登録公報2019-030

【出願番号】特願2019-515776(P2019-515776)

【国際特許分類】

A 6 1 K	47/60	(2017.01)
A 6 1 K	47/02	(2006.01)
A 6 1 K	47/26	(2006.01)
A 6 1 K	9/19	(2006.01)
A 6 1 K	9/08	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/02	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 K	38/50	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	47/60	
A 6 1 K	47/02	
A 6 1 K	47/26	
A 6 1 K	9/19	
A 6 1 K	9/08	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	35/02	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 K	38/50	

【手続補正書】

【提出日】令和2年5月8日(2020.5.8)

【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】

再構成された凍結乾燥組成物であつて：

前記組成物1mLあたり100～5,000IUの濃度のポリアルキレンオキシド-アスパラギナーゼ；

緩衝液；

前記組成物の重量に基づき0.05～1wt%の塩および

前記組成物の重量に基づき0.1～25wt%の糖

を含み、前記ポリアルキレンオキシド-アスパラギナーゼが、ポリアルキレンオキシド基に共有結合的に結合したアスパラギナーゼを含む、組成物。

【請求項2】

前記緩衝液が、リン酸緩衝液、リン酸緩衝生理食塩水(PBS)、ダルベッコのリン酸緩衝生理食塩水(DPBS)、ハンクの平衡食塩溶液(HBSS)、アールの平衡食塩溶液(EBSS)、Tris緩衝液、リンガーの乳酸緩衝液またはホウ酸緩衝液を含む、請

求項1に記載の組成物。

【請求項3】

前記リン酸緩衝液が二塩基性リン酸ナトリウムおよび一塩基性リン酸ナトリウムを含む、請求項2に記載の組成物。

【請求項4】

前記組成物の重量に基づき0.05～1wt.%、0.1～0.8wt.%、0.1～0.5wt.%または0.2～0.3wt.%の濃度の二塩基性リン酸ナトリウム、および、前記組成物の重量に基づき0.005～1wt.%、0.01～0.5wt.%、0.01～0.1wt.%または0.05～0.07wt.%の濃度の一塩基性リン酸ナトリウムを含む、請求項3に記載の組成物。

【請求項5】

前記組成物の重量に基づき0.1～1wt.%、0.2～0.5wt.%または0.3～0.5wt.%の濃度の塩を含む、請求項1～4のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項6】

前記組成物の重量に基づき0.5～20wt.%、1～10wt.%または4～5wt.%の濃度の糖を含む、請求項1～5のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項7】

前記組成物1mLあたり100～5,000IUの濃度のポリアルキレンオキシド-アスパラギナーゼ；

前記組成物の重量に基づき0.1～0.8wt.%の濃度の二塩基性リン酸ナトリウム；

前記組成物の重量に基づき0.01～0.5wt.%の濃度の一塩基性リン酸ナトリウム；

前記組成物の重量に基づき0.1～1wt%の塩；および

前記組成物の重量に基づき0.5～20wt.%の糖を含む、請求項1～6のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項8】

前記組成物1mLあたり100～5,000IUの濃度のポリアルキレンオキシド-アスパラギナーゼ；

前記組成物の重量に基づき0.1～0.5wt.%の濃度の二塩基性リン酸ナトリウム；

前記組成物の重量に基づき0.01～0.1wt.%の濃度の一塩基性リン酸ナトリウム；

前記組成物の重量に基づき0.2～0.5wt%の塩；および

前記組成物の重量に基づき1～10wt.%の糖を含む、請求項1～7のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項9】

前記組成物1mLあたり100～5,000IUの濃度のポリアルキレンオキシド-アスパラギナーゼ；

前記組成物の重量に基づき0.2～0.3wt.%の濃度の二塩基性リン酸ナトリウム；

前記組成物の重量に基づき0.05～0.07wt.%の濃度の一塩基性リン酸ナトリウム；

前記組成物の重量に基づき0.3～0.5wt%の塩；および

前記組成物の重量に基づき4～5wt.%の糖を含む、請求項1～8のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項10】

前記塩が、塩化ナトリウム、塩化カリウム、塩化カルシウム、塩化マグネシウムまたはそれらの組み合わせである、請求項1～9のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項11】

前記塩が塩化ナトリウムである、請求項10に記載の組成物。

【請求項12】

前記糖が、単糖、二糖または多糖である、請求項1～11のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項13】

前記糖が、ショ糖、マンニトール、マルトース、トレハロース、2-ヒドロキプロピル-シクロデキストリン(HPCD)、ラクトース、グルコース、フルクトース、ガラクトース、グルコサミン等またはそれらの組み合わせである、請求項1～12のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項14】

前記糖が、ショ糖である、請求項13に記載の組成物。

【請求項15】

再構成された凍結乾燥組成物であって：

前記組成物1mLあたり100～5,000IUの濃度のポリアルキレンオキシド・アスパラギナーゼ；

前記組成物の重量に基づき0.2～0.3wt.%の濃度の二塩基性リン酸ナトリウム；

前記組成物の重量に基づき0.05～0.07wt.%の濃度の一塩基性リン酸ナトリウム；

前記組成物の重量に基づき0.3～0.5wt%の塩化ナトリウム；および

前記組成物の重量に基づき4～5wt.%のショ糖を含む、組成物。

【請求項16】

前記ポリアルキレンオキシド・アスパラギナーゼの濃度が、前記組成物1mLあたり500～2,500IU、前記組成物1mLあたり500～1,000IU、または前記組成物1mLあたり700～800IUである、請求項1～15のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項17】

前記ポリアルキレンオキシド・アスパラギナーゼの濃度が、前記組成物1mLあたり750IUである、請求項1～16のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項18】

前記ポリアルキレンオキシド基がポリエチレングリコール基を含む、請求項1～17のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項19】

前記ポリエチレングリコール基が2,000～10,000ダルトンの分子量を有する、請求項18に記載の組成物。

【請求項20】

前記ポリエチレングリコール基が5,000ダルトンの分子量を有する、請求項19に記載の組成物。

【請求項21】

前記ポリアルキレンオキシドがウレタン・リンカーによって前記アスパラギナーゼと共有結合的に結合する、請求項1～20のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項22】

前記ポリアルキレンオキシドがコハク酸リンカーによって前記アスパラギナーゼと共有結合的に結合する、請求項1～20のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項23】

前記組成物が、水酸化ナトリウム、塩酸またはそれらの組み合わせを含む、請求項1～22のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項24】

凍結乾燥された貯蔵安定組成物であって：

ポリアルキレンオキシド - アスパラギナーゼ ;
緩衝液 ;
塩および
糖

を含み、前記凍結乾燥された貯蔵安定組成物は実質的に脱水され、かつ前記凍結乾燥された貯蔵安定組成物は希釈緩衝液とともに再構成することによって、請求項 1 ~ 2 3 のいずれか一項に記載の組成物を形成することができる、組成物。

【請求項 2 5】

前記再構成することが、前記凍結乾燥された貯蔵安定組成物を注射用水（W F I）と混合することを含む、請求項 2 4 に記載の凍結乾燥された貯蔵安定組成物。

【請求項 2 6】

請求項 1 ~ 2 5 のいずれか一項に記載の凍結乾燥されたポリアルキレンオキシド - アスパラギナーゼ組成物の製造方法であって、凍結乾燥された貯蔵安定ポリアルキレンオキシド - アスパラギナーゼ組成物を生産するのに十分な、方法。

【請求項 2 7】

水性濃縮組成物を単位用容器内に導入することおよび前記単位用容器内の水性濃縮組成物を凍結乾燥することを含む、請求項 2 6 に記載の方法。

【請求項 2 8】

前記単位用容器がバイアルである、請求項 2 7 に記載の方法。

【請求項 2 9】

前記単位用容器中の凍結乾燥組成物を密封することをさらに含む、請求項 2 7 または 2 8 に記載の方法。

【請求項 3 0】

被験者中のアスパラギンを脱アミノ化する方法に使用するための、再構成された投与単位としての、請求項 1 ~ 2 5 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 3 1】

前記再構成された投与単位が、前記凍結乾燥された貯蔵安定組成物を、注射用水（W F I）とともに含む、請求項 3 0 に記載の組成物。

【請求項 3 2】

前記方法が、腫瘍状態の被験者の治療方法である、請求項 3 0 または 3 1 に記載の組成物。

【請求項 3 3】

前記腫瘍状態が癌である、請求項 3 2 に記載の組成物。

【請求項 3 4】

前記癌が白血病である、請求項 3 3 に記載の組成物。

【請求項 3 5】

前記白血病が急性リンパ芽球性白血病（A L L）または急性骨髄性白血病（A M L）である、請求項 3 4 に記載の組成物。

【請求項 3 6】

前記被験者が誘導相、連結相および維持相を含む治療投薬計画を処方されている、請求項 3 0 ~ 3 5 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 3 7】

前記方法が、単回の投与単位を被験者に前記誘導相で投与すること、および複数の投与単位を前記維持相の間に投与することを含む、請求項 3 6 に記載の組成物。

【請求項 3 8】

前記複数の投与単位が、投与単位を被験者に 3 週間ごとに投与することにより、被験者に投与される、請求項 3 7 に記載の組成物。

【請求項 3 9】

前記複数の投与単位が、投与単位を被験者に 2 週間ごとに投与することにより、被験者に投与される、請求項 3 7 に記載の組成物。

【請求項 4 0】

前記被験者が年少者である、請求項 3 0 ~ 3 9 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 4 1】

前記被験者が成人である、請求項 3 0 ~ 3 9 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 4 2】

1 つ以上の単位用量容器を含むキットであって、前記単位用量容器の各々が請求項 2 4 または 2 5 に記載の凍結乾燥された貯蔵安定性組成物を含む、キット。