

【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 1 年 6 月 13 日 (2019.6.13)

【公表番号】特表 2018-515530 (P2018-515530A)

【公表日】平成 30 年 6 月 14 日 (2018.6.14)

【年通号数】公開・登録公報 2018-022

【出願番号】特願 2017-559086 (P2017-559086)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/7105 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 31/16 (2006.01)

A 6 1 P 37/04 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 K 9/14 (2006.01)

A 6 1 K 9/16 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 P 11/04 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/7105

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 31/16

A 6 1 P 37/04

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 9/14

A 6 1 K 9/16

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/36

A 6 1 P 11/04

【手続補正書】

【提出日】令和 1 年 5 月 9 日 (2019.5.9)

【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】

マイクロ粒子中のポリイノシン酸及びポリシチジル酸の組合せとデンプンとの比が約 1 : 1 ~ 約 1 : 5 である、ポリイノシン酸、ポリシチジル酸、デンプンおよび水を含む、マイクロ粒子。

【請求項 2】

前記マイクロ粒子中のポリイノシン酸及びポリシチジル酸の組合せとデンプンとの比が約 1 : 3 ~ 約 1 : 5 である、請求項 1 に記載のマイクロ粒子。

【請求項 3】

前記デンプンがアルファ化デンプンである、請求項 1 又は 2 に記載のマイクロ粒子。

【請求項 4】

前記デンプンがエンドウマメデンプンである、請求項 1 から 3 のいずれか一項に記載の

マイクロ粒子。

【請求項 5】

前記ポリイノシン酸及びポリシチジル酸のそれぞれの平均鎖長が、約 300 塩基対 ~ 6,000 塩基対である、請求項 1 から 4 のいずれか一項に記載のマイクロ粒子。

【請求項 6】

前記ポリイノシン酸及びポリシチジル酸の組合せの平均分子量が、約 180 kDa ~ 3,600 kDa である、請求項 1 から 5 のいずれか一項に記載のマイクロ粒子。

【請求項 7】

前記ポリイノシン酸及びポリシチジル酸がそれぞれナトリウム塩として存在する、請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載のマイクロ粒子。

【請求項 8】

ポリイノシン酸、ポリシチジル酸、デンプン、および水から本質的になる、請求項 1 から 7 のいずれか一項に記載のマイクロ粒子。

【請求項 9】

0.1 μm ~ 100 μm 、4 μm ~ 27 μm 、又は 2 μm ~ 20 μm の間のサイズを有する、請求項 1 から 8 のいずれか一項に記載のマイクロ粒子。

【請求項 10】

請求項 1 から 9 のいずれか一項に記載のマイクロ粒子を複数含む、組成物。

【請求項 11】

前記組成物のマイクロ粒子が、0.1 μm ~ 200 μm 、1 μm ~ 50 μm 、又は 2 μm ~ 20 μm の Dv50 を有する、請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 12】

乾燥粉末である、請求項 10 又は 11 に記載の組成物。

【請求項 13】

先天性免疫応答を活性化するために使用される、請求項 10 から 12 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 14】

ウイルス性呼吸器感染症を治療または予防するために用いられる、請求項 10 から 13 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 15】

上記ウイルス性呼吸器感染症が上気道感染症である、請求項 14 に記載の組成物。

【請求項 16】

前記感染症が、ヒトライノウイルス感染症またはインフルエンザウイルス感染症である、請求項 14 又は 15 に記載の組成物。

【請求項 17】

上気道のウイルス感染症を治療または予防する場合の使用のための組成物であって、前記組成物がマイクロ粒子を複数含む、前記マイクロ粒子が、ポリイノシン酸、ポリシチジル酸、デンプン及び水を含み、前記マイクロ粒子中のポリイノシン酸及びポリシチジル酸の組合せとデンプンとの比が約 1 : 1 ~ 約 1 : 5 の比である、組成物。

【請求項 18】

請求項 10 から 17 のいずれか一項に記載の組成物を含む、経鼻デリバリーシステム。

【請求項 19】

マイクロ粒子を複数含む組成物を含む経鼻デリバリーシステムであって、前記マイクロ粒子が、ポリイノシン酸、ポリシチジル酸、デンプン及び水を含み、前記マイクロ粒子中のポリイノシン酸及びポリシチジル酸の組合せとデンプンとの比が約 1 : 1 ~ 約 1 : 5 の比である、経鼻デリバリーシステム。

【請求項 20】

先天性免疫応答を活性化する医薬の製造のための、請求項 10 から 12 のいずれか一項に記載の組成物の使用。

【請求項 2 1】

上気道ウイルス感染症を予防および／または治療するための医薬の製造のための、請求項 1 0 から 1 2 のいずれか一項に記載の組成物の使用。

【請求項 2 2】

上気道ウイルス感染症を予防および／または治療するための医薬の製造のためのマイクロ粒子を複数含む組成物の使用であって、前記マイクロ粒子が、ポリイノシン酸、ポリシチジル酸、デンプン及び水を含み、前記マイクロ粒子中のポリイノシン酸及びポリシチジル酸の組合せとデンプンとの比が約 1 : 1 ~ 約 1 : 5 である、組成物の使用。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 8 3

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 8 3】

本発明の開示は、その特定の実施形態を参照して記載されているが、本開示の真の精神および範囲から逸脱することなく、様々な変更がなされ、同等物が置換され得ることを当業者は理解すべきである。加えて、多くの修飾がなされることによって、本発明の開示の目的、精神および範囲に対して、特定の状況、材料、物質の組成、プロセス、プロセスステップまたはステップを適応させることができる。すべてのこのような修飾は、本開示の範囲内であることが意図されている。本発明は次の態様を含む。

(1) マイクロ粒子中のポリイノシン酸 - ポリシチジル酸とデンプンとの比が約 1 : 1 ~ 約 1 : 5 である、ポリイノシン酸 - ポリシチジル酸およびデンプンを含む、マイクロ粒子

。
(2) 前記マイクロ粒子中のポリイノシン酸 - ポリシチジル酸とデンプンとの比が約 1 : 3 ~ 約 1 : 5 である、上記 (1) に記載のマイクロ粒子。

(3) 前記マイクロ粒子中のポリイノシン酸 - ポリシチジル酸とデンプンとの比が約 1 : 3 または約 1 : 5 である、上記 (2) に記載のマイクロ粒子。

(4) 前記デンプンがアルファ化デンプンである、上記 (1) から (3) のいずれか一項に記載のマイクロ粒子。

(5) 前記デンプンがエンドウマメデンプンである、上記 (1) から (4) のいずれか一項に記載のマイクロ粒子。

(6) 前記ポリイノシン酸 - ポリシチジル酸の平均鎖長が、約 3 0 0 塩基対 ~ 6 , 0 0 0 塩基対である、上記 (1) から (5) のいずれか一項に記載のマイクロ粒子。

(7) 前記ポリイノシン酸 - ポリシチジル酸の平均分子量が、約 1 8 0 k D a ~ 3 , 6 0 0 k D a である、上記 (1) から (6) のいずれか一項に記載のマイクロ粒子。

(8) 前記ポリイノシン酸 - ポリシチジル酸がナトリウム塩として存在する、上記 (1) から (7) のいずれか一項に記載のマイクロ粒子。

(9) 水をさらに含む、上記 (1) から (8) のいずれか一項に記載のマイクロ粒子。

(1 0) ポリイノシン酸 - ポリシチジル酸、デンプン、および水から本質的になる、上記 (1) から (9) のいずれか一項に記載のマイクロ粒子。

(1 1) 0 . 1 μ m ~ 1 0 0 μ m の間のサイズを有する、上記 (1) から (1 0) のいずれか一項に記載のマイクロ粒子。

(1 2) 4 μ m ~ 2 7 μ m のサイズを有する、上記 (1 1) に記載のマイクロ粒子。

(1 3) 2 μ m ~ 2 0 μ m のサイズを有する、上記 (1 1) に記載のマイクロ粒子。

(1 4) 上記 (1) から (1 3) のいずれか一項に記載の複数のマイクロ粒子を含む、組成物。

(1 5) ポリイノシン酸 - ポリシチジル酸 (ポリ (I : C)) およびデンプンを含むマイクロ粒子を含む、組成物。

(1 6) 前記組成物のマイクロ粒子が、0 . 1 μ m ~ 2 0 0 μ m の D v 5 0 を有する、上記 (1 4) または (1 5) に記載の組成物。

(1 7) 前記組成物のマイクロ粒子が、 $1\mu\text{m} \sim 50\mu\text{m}$ のDv50を有する、上記(1 6)に記載の組成物。

(1 8) 前記組成物のマイクロ粒子が $2\mu\text{m} \sim 20\mu\text{m}$ のDv50を有する、上記(1 7)に記載の組成物。

(1 9) 液体である、上記(1 4)から(1 8)のいずれか一項に記載の組成物。

(2 0) 有機溶媒を含む、上記(1 4)から(1 9)のいずれか一項に記載の組成物。

(2 1) 前記有機溶媒が、グリセロール、エタノール、またはその組合せである、上記(2 0)に記載の組成物。

(2 2) リン酸緩衝食塩水を含む、上記(1 4)から(1 9)のいずれか一項に記載の組成物。

(2 3) 乾燥粉末である、上記(1 4)から(1 8)のいずれか一項に記載の組成物。

(2 4) 前記粒子が、1カ月間室温で貯蔵中安定している、上記(2 3)に記載の組成物。

(2 5) 上気道のウイルス感染症を治療または予防する方法であって、前記組成物を患者へ投与することを含む方法における使用のための、上記(1 4)から(2 4)のいずれか一項に記載の組成物。

(2 6) 前記ウイルス感染症が、ヒトライノウイルス感染症またはインフルエンザウイルス感染症である、上記(2 5)に記載の使用のための組成物。

(2 7) 慢性閉塞性肺疾患(COPD)を有する患者において、上気道のウイルス感染症を予防する方法であって、前記組成物を患者に投与することを含む方法における使用のための、上記(1 4)から(2 4)のいずれか一項に記載の組成物。

(2 8) 上気道のウイルス感染症を治療または予防する方法における使用のための組成物であって、

前記組成物がマイクロ粒子を含み、

前記マイクロ粒子が、ポリイノシン酸 - ポリシチジル酸(ポリ(I : C))およびデンプンを、約1 : 1 ~ 約1 : 5の比で含み、

前記方法が前記組成物を患者に投与することを含む、組成物。

(2 9) 慢性閉塞性肺疾患(COPD)を有する対象において、上気道のウイルス感染症を予防する方法における使用のための組成物であって、

前記組成物がマイクロ粒子を含み、

前記マイクロ粒子が、ポリイノシン酸 - ポリシチジル酸(ポリ(I : C))およびデンプンを、約1 : 1 ~ 約1 : 5の比で含み、

前記方法が前記組成物を患者に投与することを含む、組成物。

(3 0) 前記組成物を投与することが経鼻投与を含む、上記(2 5)から(2 9)のいずれか一項に記載の使用のための組成物。

(3 1) 対象においてウイルス感染症を治療または予防する方法であって、上記(1 4)から(2 4)のいずれか一項に記載の組成物を前記対象に投与することを含む、方法。

(3 2) 前記ウイルス感染症がヒトライノウイルス感染症またはインフルエンザウイルス感染症である、上記(3 1)に記載の方法。

(3 3) 慢性閉塞性肺疾患(COPD)を有する対象において、上気道のウイルス感染症を予防する方法であって、上記(1 4)から(2 4)のいずれか一項に記載の組成物を前記対象に投与することを含む、方法。

(3 4) 対象においてウイルス感染症を治療または予防する方法であって、マイクロ粒子を含む組成物を前記対象に投与することを含み、前記マイクロ粒子が、ポリイノシン酸 - ポリシチジル酸(ポリ(I : C))およびデンプンを、約1 : 1 ~ 約1 : 5の比で含む、方法。

(3 5) 前記ウイルス感染症が、ヒトライノウイルス感染症またはインフルエンザウイルス感染症である、上記(3 4)に記載の方法。

(3 6) 慢性閉塞性肺疾患(COPD)を有する対象において、上気道のウイルス感染症を予防する方法であって、マイクロ粒子を含む組成物を前記対象に投与することを含み、

前記マイクロ粒子が、ポリイノシン酸 - ポリシチジル酸（ポリ（I：C））およびデンプンを、約 1：1～約 1：5 の比で含む、方法。

（37）前記組成物を投与することが経鼻投与を含む、上記（31）から（36）のいずれか一項に記載の方法。

（38）上記（14）から（30）のいずれか一項に記載の組成物を含む、経鼻デリバリーシステム。

（39）マイクロ粒子を含む組成物を含む経鼻デリバリーシステムであって、前記マイクロ粒子が、ポリイノシン酸 - ポリシチジル酸（ポリ（I：C））およびデンプンを、約 1：1～約 1：5 の比で含む、経鼻デリバリーシステム。

（40）上気道ウイルス感染症を予防および／または治療するための医薬の製造のための、上記（14）から（24）のいずれか一項に記載の組成物の使用。

（41）上気道ウイルス感染症を予防および／または治療するための医薬の製造のためのマイクロ粒子を含む組成物の使用であって、前記マイクロ粒子が、ポリイノシン酸 - ポリシチジル酸（ポリ（I：C））およびデンプンを、約 1：1～約 1：5 の比で含む、組成物の使用。

（42）慢性閉塞性肺疾患（COPD）を有する対象において、上気道のウイルス感染症を予防するための医薬の製造のための、上記（14）から（24）のいずれか一項に記載の組成物の使用。

（43）慢性閉塞性肺疾患（COPD）を有する対象において、上気道のウイルス感染症を予防するための医薬の製造のためのマイクロ粒子を含む組成物の使用であって、前記マイクロ粒子が、ポリイノシン酸 - ポリシチジル酸（ポリ（I：C））およびデンプンを、約 1：1～約 1：5 の比で含む、組成物の使用。