

【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19年9月27日(2007.9.27)

【公表番号】特表2007-502791(P2007-502791A)

【公表日】平成19年2月15日(2007.2.15)

【年通号数】公開・登録公報2007-006

【出願番号】特願2006-523579(P2006-523579)

【国際特許分類】

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/72 (2006.01)

A 6 1 K 9/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/04 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/20 (2006.01)

A 6 1 K 9/48 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/06 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 37/02

A 6 1 K 9/72

A 6 1 K 9/14

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/04

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 47/20

A 6 1 K 9/48

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 25/06

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成19年8月10日(2007.8.10)

【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】

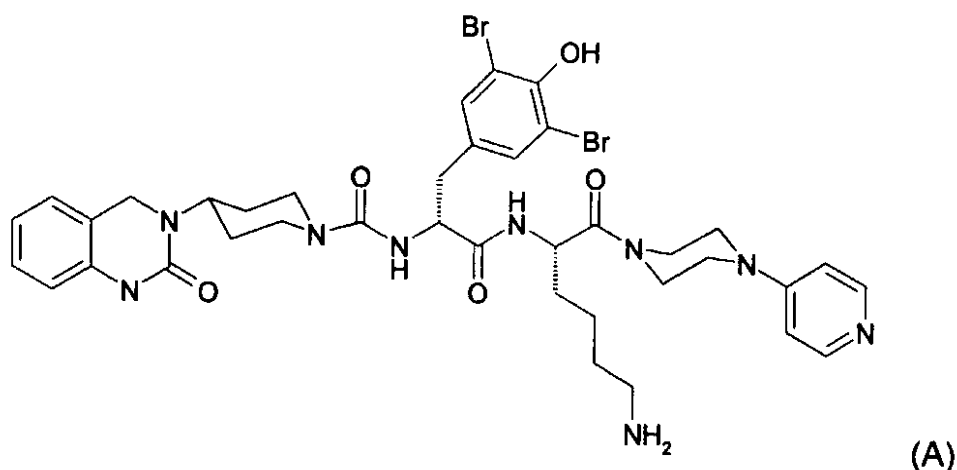
【特許請求の範囲】

【請求項1】

活性物質としてのCGRPアンタゴニスト1-[N<sup>2</sup>-[3,5-ジブromo-N-[ [4-(3,4-ジヒドロ-2(1H)-オキソキナゾリン-3-イル)-1-ピペリジニル]カルボニル]-D-チロシル]-L-リシ

ル) -4-(4-ピリジニル)-ピペラジン

【化1】



又はその生理学上許される塩及び不活性の、均一な賦形剤を含む、肺又は鼻吸入による投与のための吸入粉末であって、

(a) 活性物質の粒子サイズに関するパラメータ $X_{5.0}$ が $1\ \mu\text{m}$ から $6\ \mu\text{m}$ までの範囲であり、かつ

(b) 活性物質に関する特性値 $Q_{(5.8)}$ が少なくとも60%であることを特徴とする吸入粉末。

【請求項2】

活性物質の粒子サイズに関するパラメータ $X_{5.0}$ が $1\ \mu\text{m}$ から $3.5\ \mu\text{m}$ までの範囲である、請求項1記載の吸入粉末。

【請求項3】

活性物質塩基1-[ $N^2$ -[3,5-ジブromo-N-[ [4-(3,4-ジヒドロ-2(1H)-オキソキナゾリン-3-イル)-1-ピペリジニル]カルボニル]-D-チロシル]-L-リシル]-4-(4-ピリジニル)-ピペラジン(A)が無定形の微粉碎された製剤の形態で存在することを特徴とする、請求項1記載の吸入粉末。

【請求項4】

生理学上許される塩が1-[ $N^2$ -[3,5-ジブromo-N-[ [4-(3,4-ジヒドロ-2(1H)-オキソキナゾリン-3-イル)-1-ピペリジニル]カルボニル]-D-チロシル]-L-リシル]-4-(4-ピリジニル)-ピペラジン塩酸塩、硫酸塩、リン酸塩、臭化水素酸塩、炭酸塩、メタンスルホン酸塩、p-トルエンスルホン酸塩、硝酸塩、クエン酸塩、リンゴ酸塩、酒石酸塩、乳酸塩、コハク酸塩、グルコン酸塩、酢酸塩、ギ酸塩、プロピオン酸塩、カブロン酸塩、シュウ酸塩、マレイン酸塩、フマル酸塩、マンデル酸塩及びヒドロキシコハク酸塩の中から選ばれることを特徴とする、請求項1記載の吸入粉末。

【請求項5】

生理学上許される塩が1-[ $N^2$ -[3,5-ジブromo-N-[ [4-(3,4-ジヒドロ-2(1H)-オキソキナゾリン-3-イル)-1-ピペリジニル]カルボニル]-D-チロシル]-L-リシル]-4-(4-ピリジニル)-ピペラジン塩酸塩、硫酸塩及び臭化水素酸塩の中から選ばれることを特徴とする、請求項1記載の吸入粉末。

【請求項6】

生理学上許される塩が1-[ $N^2$ -[3,5-ジブromo-N-[ [4-(3,4-ジヒドロ-2(1H)-オキソキナゾリン-3-イル)-1-ピペリジニル]カルボニル]-D-チロシル]-L-リシル]-4-(4-ピリジニル)-ピペラジン塩酸塩であり、かつ無定形の微粉碎された製剤として存在することを特徴とする、請求項1記載の吸入粉末。

【請求項7】

使用される賦形剤が単糖類、二糖類、オリゴ糖及び多糖類、ポリアルコール、塩、ポリラクチド、ポリグリコリド又はこれらの賦形剤の互いの混合物であることを特徴とする、

請求項 1 記載の吸入粉末。

【請求項 8】

使用される賦形剤がグルコース、アラビノース、ラクトース又はサッカロース、マルトース、トレハロース、デキストラン、澱粉、セルロース誘導体、マンニトール、ソルビトール、キシリトール、塩化ナトリウム、炭酸カルシウム、ポリラクチド、ポリグリコリド又はこれらの賦形剤の互いの混合物であることを特徴とする、請求項 7 記載の吸入粉末。

【請求項 9】

流動性アジュバントが賦形剤として使用されることを特徴とする、請求項 1 記載の吸入粉末。

【請求項 10】

使用される流動性アジュバントがステアリン酸マグネシウム、ステアリン酸カルシウム、ステアリン酸、ステアリルアルコール、ベヘン酸カルシウム、アラキドン酸カルシウム、水素化植物油、脂肪酸エステル、ナトリウムステアリルフマレート、ドデシル硫酸ナトリウム、ドデシル硫酸マグネシウム又はこれらの流動性アジュバントの混合物であることを特徴とする、請求項 9 記載の吸入粉末。

【請求項 11】

活性物質対賦形剤の比が 1:9 から 5:1 までであることを特徴とする、請求項 1 記載の吸入粉末。

【請求項 12】

活性物質の比表面積対不活性賦形剤の比表面積の商が、夫々の場合に適用当りに利用できる粉末の合計量を基準として、0.05 より大きくかつ 22 未満であることを特徴とする、請求項 1 記載の吸入粉末。

【請求項 13】

活性物質の比表面積対不活性賦形剤の比表面積の商が、夫々の場合に適用当りに利用できる粉末の合計量を基準として、0.1 より大きく、かつ 22 未満であることを特徴とする、請求項 1 記載の吸入粉末。

【請求項 14】

活性物質の比表面積対不活性賦形剤の比表面積の商が、夫々の場合に適用当りに利用できる粉末の合計量を基準として、0.5 より大きく、かつ 22 未満であることを特徴とする、請求項 1 記載の吸入粉末。

【請求項 15】

活性物質の比表面積対不活性賦形剤の比表面積の商が、夫々の場合に適用当りに利用できる粉末の合計量を基準として、0.7 より大きく、かつ 22 未満であることを特徴とする、請求項 1 記載の吸入粉末。

【請求項 16】

活性物質の比表面積対不活性賦形剤の比表面積の商が、夫々の場合に適用当りに利用できる粉末の合計量を基準として、15 未満であることを特徴とする、請求項 12 から 15 の何れか 1 項記載の吸入粉末。

【請求項 17】

(a) 活性物質を微粉碎し、  
(b) 微粉碎された活性物質を状態調節し、  
(c) 本発明の一種以上の賦形剤と好適に混合し、そして  
(d) 投与すべき量のこうして得られた粉末混合物を特定の周囲の気候条件下で単一用量でインハレットに詰めることを特徴とする、請求項 1 から 16 のいずれか 1 項記載の吸入粉末の調製方法。

【請求項 18】

請求項 17 に従って得られる、請求項 1 から 16 のいずれか 1 項記載の吸入粉末。

【請求項 19】

請求項 1 から 16 のいずれか 1 項又は請求項 18 記載の吸入粉末を含む医薬組成物。

【請求項 20】

頭痛、片頭痛又は群発性頭痛の治療のための医薬組成物を調製するための請求項 1 から 16 のいずれか 1 項又は請求項 18 記載の吸入粉末の使用。

【請求項 21】

カプセル（インハレット）を調製するための請求項 1 から 16 のいずれか 1 項又は請求項 18 記載の吸入粉末の使用。

【請求項 22】

請求項 1 から 16 のいずれか 1 項又は請求項 18 記載の吸入粉末 2mg ~ 50mg の充填物を含むことを特徴とする、カプセル（インハレット）。

【請求項 23】

1-〔N<sup>2</sup>-〔3,5-ジプロモ-N-〔〔4-(3,4-ジヒドロ-2(1H)-オキソキナゾリン-3-イル)-1-ピペリジニル〕カルボニル〕-D-チロシル〕-L-リシル〕-4-(4-ピリジニル)-ピペラジン(A) 2mg ~ 50mg を含むことを特徴とする、請求項 22 記載のカプセル（インハレット）。