

【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6年2月29日(2024.2.29)

【国際公開番号】WO2021/171034

【公表番号】特表2023-516630(P2023-516630A)

【公表日】令和5年4月20日(2023.4.20)

【年通号数】公開公報(特許)2023-074

【出願番号】特願2022-551825(P2022-551825)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/519(2006.01)

A 6 1 K 9/72(2006.01)

A 6 1 P 11/00(2006.01)

A 6 1 P 11/06(2006.01)

A 6 1 P 37/08(2006.01)

A 6 1 P 29/00(2006.01)

A 6 1 P 15/18(2006.01)

A 6 1 P 17/06(2006.01)

A 6 1 P 27/02(2006.01)

A 6 1 P 37/06(2006.01)

A 6 1 P 9/10(2006.01)

A 6 1 K 31/40(2006.01)

A 6 1 K 47/12(2006.01)

A 6 1 K 9/10(2006.01)

A 6 1 K 47/26(2006.01)

A 6 1 K 47/02(2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/519

A 6 1 K 9/72

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 15/18 1 7 1

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 9/10

A 6 1 K 31/40

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 9/10

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/02

【手続補正書】

【提出日】令和6年2月20日(2024.2.20)

【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

10

20

30

40

50

## 【補正の内容】

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

- ( i ) エンシフェントリン粒子；
- ( i i ) グリコピロレート；および
- ( i i i ) 水を含む希釈剤

を含み、

ここで：

該グリコピロレートは、該希釈剤中に溶解しており；

グリコピロレートの濃度は、 $5.0 \text{ mg/mL}$ 以下であり；および

該液体医薬組成物の pH は、 $3.0$  から  $6.0$  である、

吸入による投与に適した液体医薬組成物。

10

## 【請求項 2】

液体医薬組成物の pH が  $3.5$  から  $5.0$  である、請求項 1 に記載の液体医薬組成物。

## 【請求項 3】

液体医薬組成物が緩衝液をさらに含み、好ましくは該緩衝液がクエン酸緩衝液である、請求項 1 または請求項 2 に記載の液体医薬組成物。

## 【請求項 4】

緩衝液の濃度が  $10.0$  から  $40.0 \text{ mg/mL}$ 、好ましくは  $20.0$  から  $30.0 \text{ mg/mL}$  である、請求項 1 から 3 のいずれか一項に記載の液体医薬組成物。

20

## 【請求項 5】

グリコピロレートの濃度が  $0.01 \text{ mg/mL}$  から  $2.0 \text{ mg/mL}$ 、好ましくは  $0.02 \text{ mg/mL}$  から  $0.25 \text{ mg/mL}$  である、前述の請求項のいずれか一項に記載の液体医薬組成物。

## 【請求項 6】

液体医薬組成物中のエンシフェントリン：グリコピロレートの重量比が  $1:5$  から  $200:1$ 、好ましくは  $15:1$  から  $120:1$  である、前述の請求項のいずれか一項に記載の液体医薬組成物。

## 【請求項 7】

エンシフェントリン粒子の濃度が  $0.1$  から  $5.0 \text{ mg/mL}$ 、好ましくは  $0.15$  から  $2.5 \text{ mg/mL}$  である、前述の請求項のいずれか一項に記載の液体医薬組成物。

30

## 【請求項 8】

エンシフェントリン粒子が  $0.5$  から  $5.0 \mu\text{m}$  の  $D_v 50$  を有する、前述の請求項のいずれか一項に記載の液体医薬組成物。

## 【請求項 9】

グリコピロレートがグリコピロニウムの薬学的に許容される塩であり、

好ましくは、グリコピロレートが臭化グリコピロニウムまたは塩化グリコピロニウムであり、

より好ましくは、グリコピロレートが臭化グリコピロニウムである、前述の請求項のいずれか一項に記載の液体医薬組成物。

40

## 【請求項 10】

希釈剤が水であり、液体医薬組成物が、該液体医薬組成物の総重量に基づいて少なくとも  $80$  重量%の希釈剤を含む、前述の請求項のいずれか一項に記載の液体医薬組成物。

## 【請求項 11】

液体医薬組成物が等張化剤をさらに含み、好ましくは該等張化剤が塩化ナトリウムである、前述の請求項のいずれか一項に記載の液体医薬組成物。

## 【請求項 12】

等張化剤の濃度が  $1.0 \text{ mg/mL}$  以上、好ましくは  $4.0$  から  $20.0 \text{ mg/mL}$ 、より好ましくは  $6.0$  から  $12.0 \text{ mg/mL}$  である、請求項 11 に記載の液体医薬組成物。

50

## 【請求項 13】

液体医薬組成物が1つ以上の界面活性剤をさらに含み、好ましくは該1つ以上の界面活性剤がポリソルベートおよびソルビタンアルキルエステルから選択される、前述の請求項のいずれか一項に記載の液体医薬組成物。

## 【請求項 14】

1つ以上の界面活性剤の総濃度が、0.01から2.0 mg/mL、好ましくは0.1から1.0 mg/mLである、請求項13に記載の液体医薬組成物。

## 【請求項 15】

液体医薬組成物が：

- (i) エンシフェントリン粒子；
- (ii) グリコピロレート；
- (iii) 希釈剤
- (iv) ポリソルベート界面活性剤；
- (v) 任意にソルビタンアルキルエステル界面活性剤；
- (vi) クエン酸緩衝液；および
- (vii) 塩化ナトリウム

を含む、前述の請求項のいずれか一項に記載の液体医薬組成物。

10

## 【請求項 16】

液体医薬組成物が：

- (i) 0.1から2.5 mg/mLのエンシフェントリン粒子、任意に0.5から2.5 mg/mLのエンシフェントリン粒子；
- (ii) 0.01 mg/mLから2.0 mg/mLの臭化グリコピロニウム；
- (iii) 水；
- (iv) 0.1から1.0 mg/mLのポリソルベート20；
- (v) 任意に0.01から0.1 mg/mLのソルビタンモノラウレート；
- (vi) 5.0から15.0 mg/mLのクエン酸；
- (vii) 10.0から20.0 mg/mLのクエン酸三ナトリウム；および
- (viii) 5.0から15.0 mg/mLの塩化ナトリウム

を含む、前述の請求項のいずれか一項に記載の液体医薬組成物。

20

## 【請求項 17】

液体医薬組成物が、エンシフェントリンおよびグリコピロレートの化学的分解に関して、25の温度および60%の相対湿度で保存したとき、少なくとも1ヶ月間安定である、前述の請求項のいずれか一項に記載の液体医薬組成物。

30

## 【請求項 18】

液体医薬組成物がネブライザーによる投与に適している、前述の請求項のいずれか一項に記載の液体医薬組成物。

## 【請求項 19】

前述の請求項のいずれか一項に記載の液体医薬組成物を含む、ネブライザー。

## 【請求項 20】

慢性閉塞性肺疾患(COPD)、喘息、アレルギー性喘息、花粉症、アレルギー性鼻炎、気管支炎、肺気腫、気管支拡張症、成人呼吸窮迫症候群(ARDS)、ステロイド抵抗性喘息、重度の喘息、小児喘息、嚢胞性線維症、肺線維症、肺の線維症、間質性肺疾患、皮膚疾患、アトピー性皮膚炎、乾癬、眼の炎症、脳虚血、炎症性疾患および自己免疫疾患から選択される疾患若しくは状態の治療または予防のための、請求項1から18のいずれか一項に記載の液体医薬組成物。

40

## 【請求項 21】

疾患または状態が慢性閉塞性肺疾患(COPD)である、請求項21に記載の液体医薬組成物。

50