

【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17年7月7日(2005.7.7)

【公表番号】特表2004-520409(P2004-520409A)

【公表日】平成16年7月8日(2004.7.8)

【年通号数】公開・登録公報2004-026

【出願番号】特願2002-567270(P2002-567270)

【国際特許分類第7版】

A 6 1 K 45/00  
A 6 1 K 9/16  
A 6 1 K 31/137  
A 6 1 K 31/566  
A 6 1 K 38/00  
A 6 1 K 47/12  
A 6 1 K 47/14  
A 6 1 K 47/18  
A 6 1 K 47/24  
A 6 1 K 47/26  
A 6 1 K 47/28  
A 6 1 K 47/30  
A 6 1 K 47/36  
A 6 1 K 47/42  
A 6 1 P 11/06

【F I】

A 6 1 K 45/00  
A 6 1 K 9/16  
A 6 1 K 31/137  
A 6 1 K 31/566  
A 6 1 K 47/12  
A 6 1 K 47/14  
A 6 1 K 47/18  
A 6 1 K 47/24  
A 6 1 K 47/26  
A 6 1 K 47/28  
A 6 1 K 47/30  
A 6 1 K 47/36  
A 6 1 K 47/42  
A 6 1 P 11/06  
A 6 1 K 37/02

【手続補正書】

【提出日】平成15年11月12日(2003.11.12)

【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】

生物活性剤を約 1 ~ 15 重量%、1, 2 - ジステアロイル - sn - グリセロール - 3 - ホスホコリン (DSPC) と 1, 2 - ジパルミトイル - sn - グリセロール - 3 - ホスホコリン (DPPC) との組み合わせを少なくとも約 65 重量%、およびロイシンを約 10 ~ 20 重量% 含有してなる、生物活性剤の肺送達用噴霧乾燥粒子。

【請求項 2】

約 0.4 g / cm<sup>3</sup> 未満のタップ密度を有する請求項 1 記載の粒子。

【請求項 3】

約 0.28 g / cm<sup>3</sup> 以下のタップ密度を有する請求項 2 記載の粒子。

【請求項 4】

約 0.22 g / cm<sup>3</sup> 以下のタップ密度を有する請求項 3 記載の粒子。

【請求項 5】

約 0.11 g / cm<sup>3</sup> 以下のタップ密度を有する請求項 4 記載の粒子。

【請求項 6】

約 0.05 g / cm<sup>3</sup> 以下のタップ密度を有する請求項 5 記載の粒子。

【請求項 7】

約 5 ミクロン ~ 約 30 ミクロンの平均幾何学的直径を有する請求項 1 記載の粒子。 \_\_

【請求項 8】

約 1 ミクロン ~ 約 5 ミクロンの空気力学的直径を有する請求項 1 記載の粒子。

【請求項 9】

約 1 ミクロン ~ 約 3 ミクロンの空気力学的直径を有する請求項 8 記載の粒子。

【請求項 10】

約 3 ミクロン ~ 約 5 ミクロンの空気力学的直径を有する請求項 8 記載の粒子。

【請求項 11】

多糖類、糖類、アミノ酸、ポリマー、タンパク質、脂質、界面活性剤、コレステロール、脂肪酸、脂肪酸エステルおよびその任意の組み合わせからなる群より選ばれる化合物をさらに含んでなる請求項 1 記載の粒子。

【請求項 12】

生物活性剤を約 5 ~ 10 重量% 含有してなる請求項 1 記載の粒子。

【請求項 13】

生物活性剤を約 7 ~ 9 重量% 含有してなる請求項 12 記載の粒子。

【請求項 14】

生物活性剤が アルブテロール、サルメテロール、エストロン、タンパク質またはペプチド、親水性および疎水性からなる群より選択される 請求項 1 記載の粒子。 \_\_

【請求項 15】

DSPC および DPPC を DPPC 3 部に対して DSPC 約 1 部、DPPC 1 部に対して DSPC 約 3 部、または DPPC 1 部に対して DSPC 約 1 部の比で含有してなる 請求項 1 記載の粒子。 \_\_

【請求項 16】

ロイシンを約 15 ~ 20 重量% 含有してなる請求項 1 記載の粒子。

【請求項 17】

ロイシンを約 16 重量% 含有してなる請求項 16 記載の粒子。

【請求項 18】

ヒトまたは獣医学的被験体の生理学的温度より高いマトリックス転移温度を有する請求項 1 記載の粒子。

【請求項 19】

約 1 時間より長い粒子からの生物活性剤の放出の半減期を有する請求項 1 記載の粒子。

【請求項 20】

制御放出非ポリマー粒子である請求項 1 記載の粒子。

【請求項 21】

処置、予防または診断を必要とする患者の肺系を經由する 送達に使用できる 請求項 1 ~

2 0 いずれか記載の粒子。――

【請求項 2 2】

送達が主に深肺、中央気道、小気道または上気道に対して行われる請求項 2 1 記載の粒子。――

【請求項 2 3】

送達乾燥粉体吸入器により行われる請求項 2 1 記載の粒子。

【請求項 2 4】

生物活性剤を約 1 ~ 1 5 重量%、1, 2 - ジステアロイル - sn - グリセロール - 3 - ホスホコリン (DSPC) と 1, 2 - ジパルミトイル - sn - グリセロール - 3 - [ホスホ - rac - (1 - グリセロール)] (DPPG) との組み合わせを少なくとも約 6 5 重量%、およびロイシンを約 1 0 ~ 2 0 重量%含有してなる、生物活性剤の肺送達用粒子。

【請求項 2 5】

約 0 . 4 g / c m<sup>3</sup> 未満のタップ密度を有する請求項 2 4 記載の粒子。――

【請求項 2 6】

約 5 ミクロン ~ 約 3 0 ミクロンの平均幾何学的直径を有する請求項 2 4 記載の粒子。――

【請求項 2 7】

約 1 ミクロン ~ 約 5 ミクロンの空気力学的直径を有する請求項 2 4 記載の粒子。――

【請求項 2 8】

多糖類、糖類、アミノ酸、ポリマー、タンパク質、脂質、界面活性剤、コレステロール、脂肪酸、脂肪酸エステルおよびその任意の組み合わせからなる群より選ばれる化合物をさらに含んでなる請求項 2 4 記載の粒子。――

【請求項 2 9】

生物活性剤がアルブテロール、サルメテロール、エストロン、タンパク質またはペプチド、親水性および疎水性からなる群より選択される請求項 2 4 記載の粒子。――

【請求項 3 0】

DSPC および DPPG を DPPG 3 部に対して DSPC 約 1 部、DPPG 1 部に対して DSPC 約 3 部または DPPG 1 部に対して DSPC 約 1 部の比で含有してなる請求項 2 4 記載の粒子。――

【請求項 3 1】

ヒトまたは獣医学的被験体の生理学的温度より高いマトリックス転移温度を有する請求項 2 4 記載の粒子。

【請求項 3 2】

約 1 時間より長い粒子からの生物活性剤の放出の半減期を有する請求項 2 4 記載の粒子。

【請求項 3 3】

制御放出非ポリマー粒子である請求項 2 4 記載の粒子。

【請求項 3 4】

処置、予防または診断を必要とする患者の肺系を経由する送達に使用できる請求項 2 4 ~ 3 3 いずれか記載の粒子。――

【請求項 3 5】

送達乾燥粉体吸入器により行われる請求項 3 4 記載の粒子。――

【請求項 3 6】

送達乾燥粉体吸入器により行われる請求項 3 4 記載の粒子。

【請求項 3 7】

生物活性剤を約 1 ~ 1 5 重量%、1, 2 - ジステアロイル - sn - グリセロール - 3 - [ホスホ - rac - (1 - グリセロール)] (DSPG) と 1, 2 - ジパルミトイル - sn - グリセロール - 3 - ホスホコリン (DPPC) との組み合わせを少なくとも約 6 5 重量%、およびロイシンを約 1 0 ~ 2 0 重量%含有してなる、生物活性剤の肺送達用粒子。

【請求項 3 8】

約  $0.4 \text{ g/cm}^3$  未満のタップ密度を有する請求項 37 記載の粒子。 \_\_

【請求項 39】

約 5 ミクロン ~ 約 30 ミクロンの平均幾何学的直径を有する請求項 37 記載の粒子。 \_\_

【請求項 40】

約 1 ミクロン ~ 約 5 ミクロンの空気力学的直径を有する請求項 37 記載の粒子。 \_\_

【請求項 41】

多糖類、糖類、アミノ酸、ポリマー、タンパク質、脂質、界面活性剤、コレステロール、脂肪酸、脂肪酸エステルおよびその任意の組み合わせからなる群より選ばれる化合物をさらに含んでなる請求項 37 記載の粒子。 \_\_

【請求項 42】

生物活性剤がアルブテロール、サルメテロール、エストロン、タンパク質またはペプチド、親水性および疎水性からなる群より選択される請求項 37 記載の粒子。 \_\_

【請求項 43】

粒子が、DSPG および DPPC を DPPC 3 部に対して DSPG 約 1 部、DPPC 1 部に対して DSPG 約 3 部または DPPC 1 部に対して DSPG 約 1 部の比で含有してなる請求項 37 記載の粒子。 \_\_

【請求項 44】

ヒトまたは獣医学的被験体の生理学的温度より高いマトリックス転移温度を有する請求項 37 記載の粒子。

【請求項 45】

約 1 時間より長い粒子からの生物活性剤の放出の半減期を有する請求項 37 記載の粒子。  
。

【請求項 46】

制御放出非ポリマー粒子である請求項 37 記載の粒子。

【請求項 47】

処置、予防または診断を必要とする患者の肺系を経由する送達に使用できる請求項 37 ~ 46 いずれか記載の粒子。 \_\_

【請求項 48】

送達が主に深肺、中央気道、小気道または上気道に対して行われる請求項 47 記載の粒子。 \_\_

【請求項 49】

送達が乾燥粉体吸入器により行われる請求項 47 記載の粒子。