

【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-ジパルミトイール-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0.4g/cm³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0.28g/cm³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0.22g/cm³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0.11g/cm³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0.05g/cm³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DPPC3部に対してDSPC約1部、DPPC1部に対してDSPC約3部、またはDPPC1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経由する送達に使用できる請求項1～

20 いずれか記載の粒子。

【請求項 22】

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21記載の粒子。

【請求項 23】

送達が乾燥粉体吸入器により行われる請求項21記載の粒子。

【請求項 24】

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-ジパルミトイール-sn-グリセロ-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粒子。

【請求項 25】

約0.4g/cm³未満のタップ密度を有する請求項24記載の粒子。

【請求項 26】

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24記載の粒子。

【請求項 27】

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24記載の粒子。

【請求項 28】

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24記載の粒子。

【請求項 29】

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24記載の粒子。

【請求項 30】

DSPCおよびDPPGをDPPG3部に対してDSPC約1部、DPPG1部に対してDSPC約3部またはDPPG1部に対してDSPC約1部の比で含有してなる請求項24記載の粒子。

【請求項 31】

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24記載の粒子。

【請求項 32】

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24記載の粒子。

【請求項 33】

制御放出非ポリマー粒子である請求項24記載の粒子。

【請求項 34】

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24～33いずれか記載の粒子。

【請求項 35】

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34記載の粒子。

【請求項 36】

送達が乾燥粉体吸入器により行われる請求項34記載の粒子。

【請求項 37】

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-3-[ホスホ-rac-(1-グリセロール)](DSPG)と1,2-ジパルミトイール-sn-グリセロ-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粒子。

【請求項 38】

約 0.4 g / cm³ 未満のタップ密度を有する請求項 3_7 記載の粒子。__

【請求項 3_9】

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 3_7 記載の粒子。__

【請求項 4_0】

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 3_7 記載の粒子。__

【請求項 4_1】

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 3_7 記載の粒子。__

【請求項 4_2】

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 3_7 記載の粒子。__

【請求項 4_3】

粒子が、D S P G および D P P C を D P P C 3 部に対して D S P G 約 1 部、D P P C 1 部に対して D S P G 約 3 部または D P P C 1 部に対して D S P G 約 1 部の比で含有してなる請求項 3_7 記載の粒子。__

【請求項 4_4】

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 3_7 記載の粒子。__

【請求項 4_5】

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 3_7 記載の粒子。__

【請求項 4_6】

制御放出非ポリマー粒子である請求項 3_7 記載の粒子。__

【請求項 4_7】

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 3_7 ~ 4_6 いずれか記載の粒子。__

【請求項 4_8】

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 4_7 記載の粒子。__

【請求項 4_9】

送達が乾燥粉体吸入器により行われる請求項 4_7 記載の粒子。__