

【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29年3月23日 (2017.3.23)

【公開番号】特開2017-8114(P2017-8114A)

【公開日】平成29年1月12日 (2017.1.12)

【年通号数】公開・登録公報2017-002

【出願番号】特願2016-203842(P2016-203842)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/127 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/24 (2006.01)

A 6 1 K 47/28 (2006.01)

A 6 1 K 47/04 (2006.01)

A 6 1 K 47/02 (2006.01)

A 6 1 K 31/7036 (2006.01)

A 6 1 P 31/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 9/127

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/24

A 6 1 K 47/28

A 6 1 K 47/04

A 6 1 K 47/02

A 6 1 K 31/7036

A 6 1 P 31/00

【手続補正書】

【提出日】平成29年2月20日 (2017.2.20)

【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

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

(i) 有機溶媒に溶解させた脂質を含む脂質溶液であって、前記脂質がホスホリピド及びステロールの混合物である脂質溶液と、(i i) アミノグリコシド又はその薬学的に許容可能な塩を含む水性溶液とを、別々の流れから直列で混合するステップであって、前記混合するステップが、前記 アミノグリコシド又はその薬学的に許容可能な塩のコアセルベート化を誘導し、前記コアセルベートが、前記 アミノグリコシド又はその薬学的に許容可能な塩を豊富に含んだ小型の液滴である、ステップと

前記コアセルベート周囲に脂質層を形成するステップと、

前記 アミノグリコシド又はその薬学的に許容可能な塩を前記脂質層内部に捕獲するステップであって、前記脂質層内の前記 アミノグリコシド又はその薬学的に許容可能な塩の濃度が、前記脂質層外部の前記 アミノグリコシド又はその薬学的に許容可能な塩の濃度よりも高い、ステップと

水又は塩水を加えるステップであって、生じた脂質とアミノグリコシド又はその薬学的

に許容可能な塩との混合物を希釈する、ステップと

により製造されたりポソーム性アミノグリコシド調合物であって、

前記混合ステップにおける前記脂質溶液の流速と前記水性溶液の流速とが異なる、リポソーム性アミノグリコシド調合物。

【請求項 2】

前記脂質が水混和性有機溶媒に溶解される、請求項 1 に記載のリポソーム性アミノグリコシド調合物。

【請求項 3】

前記脂質が、界面活性剤との水性ミセル懸濁液として加えられる、請求項 1 に記載のリポソーム性アミノグリコシド調合物。

【請求項 4】

前記脂質が、前記界面活性剤の臨界ミセル濃度（CMC）未満まで前記ミセル懸濁液を水溶液で希釈することで、沈殿するように誘導される、請求項 3 に記載のリポソーム性アミノグリコシド調合物。

【請求項 5】

前記脂質が、前記水性溶液の pH を変えることによって前記脂質層を形成するように誘導される、請求項 1 に記載のリポソーム性アミノグリコシド調合物。

【請求項 6】

前記脂質を有機溶媒に溶解させて前記脂質溶液を形成し、前記コアセルベートが、前記アミノグリコシド又はその薬学的に許容可能な塩の水溶液を前記脂質溶液と混合させた後に形成される、請求項 1 に記載のリポソーム性アミノグリコシド調合物。

【請求項 7】

前記 2 つの流れが直列で混合される前に Y 又は T コネクタに入る、請求項 1 に記載のリポソーム性アミノグリコシド調合物。

【請求項 8】

前記脂質溶液が 1 - 3 L / 分の率で添加され、そして前記水性溶液が 1 . 5 - 4 . 5 L / 分の率で添加される、請求項 1 に記載のリポソーム性アミノグリコシド調合物。

【請求項 9】

前記脂質溶液が 1 L / 分の率で添加され、そして水性溶液が 1 . 5 L / 分の率で添加される、請求項 1 に記載のリポソーム性アミノグリコシド調合物。

【請求項 10】

前記脂質溶液が 1 L / 分の率で添加され、前記水性溶液が 1 . 5 L / 分の率で添加され、そして水又は塩水が 1 L / 分の率で添加される、請求項 1 に記載のリポソーム性アミノグリコシド調合物。

【請求項 11】

前記有機溶媒がエタノールである、請求項 6 に記載のリポソーム性アミノグリコシド調合物。

【請求項 12】

前記ホスホリピドがジパルミトイルホスファチジルコリン（DPPC）である、請求項 1 に記載のリポソーム性アミノグリコシド調合物。

【請求項 13】

前記の DPPC : コレステロール比が重量で 2 : 1 である、請求項 12 に記載のリポソーム性アミノグリコシド調合物。

【請求項 14】

前記脂質溶液が 10 - 30 mg / ml であり、前記薬物の水性溶液が 40 - 100 mg / ml である、請求項 6 に記載のリポソーム性アミノグリコシド調合物。

【請求項 15】

前記脂質溶液が 20 mg / ml であり、前記薬物の水性溶液が 75 mg / ml である、請求項 14 に記載のリポソーム性アミノグリコシド調合物。

【請求項 16】

前記アミノグリコシドがアミカシン又はその薬学的に許容可能な塩である、請求項1に記載のリボソーム性アミノグリコシド調合物。

【請求項 17】

前記アミノグリコシドがトブラマイシン又はその薬学的に許容可能な塩である、請求項1に記載のリボソーム性アミノグリコシド調合物。

【請求項 18】

前記アミノグリコシドがゲンタマイシン、ストレプトマイシン、ネチルミシン又はカナマイシン或いはそれらの薬学的に許容可能な塩である、請求項1に記載のリボソーム性アミノグリコシド調合物。

【請求項 19】

混合が渦流により行なわれる、請求項6に記載のリボソーム性アミノグリコシド調合物。

【請求項 20】

前記アミノグリコシドが硫酸アミカシンである、請求項1に記載のリボソーム性アミノグリコシド調合物。