

【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23年8月4日(2011.8.4)

【公表番号】特表2007-505830(P2007-505830A)

【公表日】平成19年3月15日(2007.3.15)

【年通号数】公開・登録公報2007-010

【出願番号】特願2006-525902(P2006-525902)

【国際特許分類】

A 6 1 K 9/72 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/726 (2006.01)

A 6 1 K 31/727 (2006.01)

A 6 1 K 31/737 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

A 6 1 K 47/42 (2006.01)

A 6 1 K 31/198 (2006.01)

A 6 1 K 9/14 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/08 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 9/72

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 29/00

A 6 1 K 31/726

A 6 1 K 31/727

A 6 1 K 31/737

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/18

A 6 1 K 47/42

A 6 1 K 31/198

A 6 1 K 9/14

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 11/08

A 6 1 P 11/06

【誤訳訂正書】

【提出日】平成23年6月14日(2011.6.14)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

1つまたは複数のグリコサミノグリカンおよび疎水性アミノ酸を含む、粘液の浄化を促進するための組成物であって、肺吸入用の乾燥粉末であり、2% w/w以上の疎水性アミノ酸を含む、組成物。

【請求項 2】

炎症を低下させることができる、請求項1に記載の組成物。

【請求項 3】

1つまたは複数の更なる粘液活性剤を含む、請求項1または2に記載の組成物。

【請求項 4】

1つまたは複数の粘液活性剤が粘液内の架橋を減少させ、粘液を希釈する、請求項1から3のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 5】

グリコサミノグリカンがヘパリンおよび/またはヘパリノイドである、請求項1に記載の組成物。

【請求項 6】

ヘパリノイドがダナパロイドナトリウム、またはデルマタン硫酸である、請求項5に記載の組成物。

【請求項 7】

ヘパリノイドがヘパリン、デルマタン硫酸およびコンドロイチン硫酸を含む、請求項5に記載の組成物。

【請求項 8】

硫酸化グリコサミノグリカン、ポリ硫酸グリコサミノグリカン化合物、または硫酸化ムコ多糖を含む、請求項1から7のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 9】

50%と99%の間の微粒子の割合を有し、前記微粒子の割合が、5 μm未満の空気力学的粒径を有する粒子の質量割合である、請求項1に記載の組成物。

【請求項 10】

疎水性アミノ酸が50%w/wまでの量で含まれる、請求項1に記載の組成物。

【請求項 11】

疎水性アミノ酸がロイシンである、請求項1から10のいずれかに記載の組成物。

【請求項 12】

10 μm未満の空気力学的質量中央径を有するグリコサミノグリカンの粒子を含む、請求項1から11のいずれかに記載の組成物。

【請求項 13】

粒子が2～5 μmの空気力学的質量中央径を有する、請求項12に記載の組成物。

【請求項 14】

20 μm以上の粒径を有する担体粒子をさらに含む、請求項1から13のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 15】

治療において使用するための、請求項1から14のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

肺疾患を治療するための、請求項15に記載の医薬組成物。

【請求項 17】

肺疾患が粘液の分泌過多または粘液の異常な粘弾性を伴う、請求項16に記載の医薬組成物。

【請求項 18】

肺疾患が慢性気管支炎、急性喘息、のう胞性線維症(CF)、慢性閉塞性肺疾患(COPD)または気管支拡張である、請求項16または17に記載の医薬組成物。

【請求項 19】

請求項1から14のいずれか一項に記載の組成物を治療有効量含む、肺疾患を治療するための医薬。

## 【請求項 20】

1つまたは複数のグリコサミノグリカンを噴霧乾燥することを含む、請求項1から14のいずれか一項に記載の組成物中で使用するための粒子を生成する方法。

## 【請求項 21】

噴霧乾燥が、制御された速度で動く小滴を生成するための手段を含む噴霧乾燥機の使用を含む、請求項20に記載の方法。

## 【請求項 22】

小滴の生成地点から5mmにおける小滴の速度が20m/s未満である、請求項21に記載の方法。

## 【請求項 23】

噴霧乾燥機が超音波ネブライザーを含む、請求項21または22に記載の方法。

## 【請求項 24】

1つまたは複数のグリコサミノグリカンを疎水性アミノ酸と同時に噴霧乾燥する、請求項20から23のいずれか一項に記載の方法。

## 【請求項 25】

請求項1から14のいずれか一項に記載の組成物中で使用するための粒子を生成する方法であって、空気または圧縮ガスまたは流体の存在下で1つまたは複数のグリコサミノグリカンの粒子をジェットミリングすることを含む方法。

## 【請求項 26】

疎水性アミノ酸の存在下で粒子をジェットミリングする、請求項25に記載の方法。

## 【請求項 27】

0.1パールと3パールの間で入口圧力でジェットミリングを行う、請求項25または26に記載の方法。

## 【請求項 28】

3パールと12パールの間で入口圧力でジェットミリングを行う、請求項25から27のいずれか一項に記載の方法。

## 【請求項 29】

少なくとも90体積%の活性粒子がジェットミリングの前に直径20 μm未満である、請求項25から28のいずれか一項に記載の方法。

## 【請求項 30】

生成する乾燥粒子の90%がレーザー回折によって測定して10 μm未満の大きさを有する、請求項20から29のいずれか一項に記載の方法。

## 【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0077

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0077】

投与効率は乾燥粉末配合物の微粒子の割合(FPF)に非常に依存し、さまざまな賦形剤を加えて、非常に十分なFPFが得られることを確実にする必要がある。

## 【誤訳訂正 3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0097

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0097】

微粒子の割合(FPF)はEDで割ったFPDとして通常定義し、パーセンテージとして表す。本明細書では、EDのFPFはFPF(ED)と呼び、 $FPF(ED) = (FPD/ED) \times 100\%$ として計算する。

## 【誤訳訂正 4】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】 0 0 9 8

【訂正方法】 変更

【訂正の内容】

【 0 0 9 8 】

微粒子の割合 (FPF) はMDで割ったFPDとして定義し、パーセンテージとして表すこともできる。本明細書では、MDのFPFはFPF(MD)と呼び、 $FPF(MD) = (FPD / MD) \times 100\%$ として計算する。

【誤訳訂正 5】

【訂正対象書類名】 明細書

【訂正対象項目名】 0 1 0 3

【訂正方法】 変更

【訂正の内容】

【 0 1 0 3 】

好ましくは、添加剤物質は抗接着性物質であり、それは粒子間の凝集性を低下させる傾向があり、微粒子が吸入デバイスの内側表面に付着した状態になるのも妨げる。添加剤物質は減摩剤または流動促進剤であり、吸入器中での医薬組成物のより良い流れを与えることが有利である。このように使用される添加剤物質は、通常は必ずしも抗接着剤または減摩剤と呼ぶことはできないが、それらは粒子間の凝集性を低下させる効果、または粉末の流れを改善する効果を有する。添加剤物質は力制御物質(FCA)と呼ばれることが多く、これらは通常はより良い用量再現性および充分な細粒の割合をもたらす。

【誤訳訂正 6】

【訂正対象書類名】 明細書

【訂正対象項目名】 0 1 0 5

【訂正方法】 変更

【訂正の内容】

【 0 1 0 5 】

一般に、乾燥粉末配合物に含まれる添加剤物質の最適量は、添加剤物質および活性剤の化学組成および他の性質、ならびに存在する場合は担体粒子などの他の粒子の性質に依存するであろう。一般に、添加剤物質の有効性は、組成物の細粒の割合に関して測定する。

【誤訳訂正 7】

【訂正対象書類名】 明細書

【訂正対象項目名】 0 2 0 7

【訂正方法】 変更

【訂正の内容】

【 0 2 0 7 】

粉末の処理を試験するために、Monohalerおよび20mgの粉末を充填したカプセルを使用して作業を行い、前に説明した方法で迅速なTSIに移した。この試験は60lpmのTSI流速、および約5  $\mu$ mのカットオフを使用した。

【誤訳訂正 8】

【訂正対象書類名】 明細書

【訂正対象項目名】 0 2 1 2

【訂正方法】 変更

【訂正の内容】

【 0 2 1 2 】

さらに、5  $\mu$ m未満の大きさを有する粒子の質量の割合を粒径データから得て、FPFとして表す。