

【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19年9月27日(2007.9.27)

【公表番号】特表2007-502792(P2007-502792A)

【公表日】平成19年2月15日(2007.2.15)

【年通号数】公開・登録公報2007-006

【出願番号】特願2006-523585(P2006-523585)

【国際特許分類】

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/72 (2006.01)

A 6 1 K 9/14 (2006.01)

A 6 1 P 25/06 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 37/02

A 6 1 K 9/72

A 6 1 K 9/14

A 6 1 P 25/06

【手続補正書】

【提出日】平成19年8月10日(2007.8.10)

【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

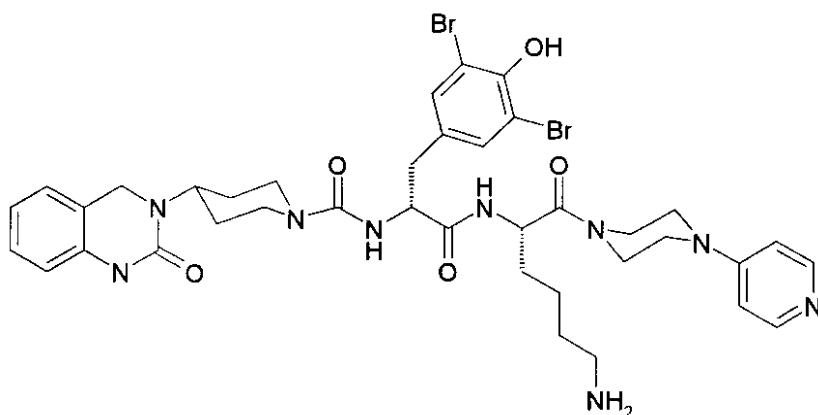
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記式(A)

【化1】



の活性物質塩基1-[N²-[3,5-ジブromo-N-[[4-(3,4-ジヒドロ-2(1H)-オキソキナゾリン-3-イル)-1-ピペリジニル]カルボニル]-D-チロシル]-L-リシル]-4-(4-ピリジニル)-ピペラジンを球状ナノ構造微粒子の形態で含んでなる粉末吸入薬であって、

(a) 前記粒子が $1 \text{ m}^2/\text{g} \sim 25 \text{ m}^2/\text{g}$ の比表面積を有し、

(b) 固有値 $Q_{(5.8)}$ が50%～100%であり、

(c) パラメーター X_{50} が $1 \text{ }\mu\text{m} \sim 6 \text{ }\mu\text{m}$ の範囲であり、かつ

(d) $5 \text{ }\mu\text{m}$ 未満の粒径の吸入可能微細粒子フラクションが、該製剤組成物の活性物質フラクション(計量用量)に基づいて40%より多い

ことを特徴とする粉末吸入薬。

【請求項 2】

前記固有値 $Q_{(2.5)}$ が 70% ~ 100% であることを特徴とする請求項 1 記載の粉末吸入薬。

【請求項 3】

20% を超える $2.8 \mu\text{m}$ 未満の粒径の微細粒子フラクションを含有することを特徴とする請求項 1 又は 2 記載の粉末吸入薬。

【請求項 4】

25% を超える $2.8 \mu\text{m}$ 未満の粒径の微細粒子フラクションを含有することを特徴とする請求項 1 又は 2 記載の粉末吸入薬。

【請求項 5】

球状ナノ構造微粒子の形態の活性物質塩基 (A) の製造方法であって、以下の工程：

(a) 活性物質塩基 (A) を有機溶媒又は有機-水性溶媒混合物に溶かして活性物質の濃度が 0.5wt.% ~ 20wt.% の活性物質の溶液を調製する工程、

(b) このようにして得た活性物質溶液を、 $1 \mu\text{m} \sim 20 \mu\text{m}$ の範囲のパラメーター X_{50} と、10% ~ 100% の固有値 $Q_{(5.8)}$ (シンパテックレーザー回折で測定) を有する液滴サイズの噴霧ミストを得るように常法で噴霧する工程、

(c) このようにして得た噴霧ミストを、以下のパラメーターを固守しながら乾燥ガスを用いて乾燥させる工程：

(i) $100 \sim 350$ の乾燥ガスの入口温度、及び

(ii) $40 \sim 120$ の乾燥ガスの出口温度、及び

(d) 乾燥ガスの流れから乾燥した固形フラクションを常法で分離する工程を含む方法。

【請求項 6】

球状ナノ構造微粒子の形態の活性物質塩基 (A) の製造方法であって、以下の工程：

(a) 活性物質塩基 (A) を有機溶媒又は有機-水性溶媒混合物に溶かして活性物質の濃度が 0.5wt.% ~ 20wt.% の活性物質の溶液を調製する工程、

(b) このようにして得た活性物質溶液を、 $1 \mu\text{m} \sim 20 \mu\text{m}$ の範囲のパラメーター X_{50} と、10% ~ 100% のパラメーター $Q_{(5.8)}$ (シンパテックレーザー回折で測定) を有する液滴サイズの噴霧ミストを得るように、 $1 \text{Nm}^3/\text{h} \sim 15 \text{Nm}^3/\text{h}$ の噴霧ガスの流量で常法で噴霧する工程、

(c) このようにして得た噴霧ミストを、以下のパラメーターを固守しながら乾燥ガスを用いて乾燥させる工程：

(i) $100 \sim 350$ の乾燥ガスの入口温度、

(ii) $40 \sim 120$ の乾燥ガスの出口温度、及び

(iii) $15 \text{Nm}^3/\text{h} \sim 1500 \text{Nm}^3/\text{h}$ の乾燥ガスの流量、及び

(d) 乾燥ガスの流れから乾燥した固形フラクションを常法で分離する工程を含む方法。

【請求項 7】

活性物質を溶かすために使用する溶媒が有機-水性溶媒系であり、水のモル比がアルコール成分のモル比の 0.1 ~ 10 倍量であることを特徴とする請求項 5 又は 6 記載の方法。

【請求項 8】

前記有機-水性溶媒系が、エタノール/メタノール/水から成り、水のモル比がアルコール成分のモル比の 0.1 ~ 10 倍量であることを特徴とする請求項 5 又は 6 記載の方法。

【請求項 9】

前記有機-水性溶媒系が、エタノール/プロパノール/水から成り、水のモル比がアルコール成分のモル比の 0.1 ~ 10 倍量であることを特徴とする請求項 5 又は 6 記載の方法。

【請求項 10】

前記有機-水性溶媒系が、エタノール/水から成り、水のモル比がアルコール成分のモル比の 0.1 ~ 10 倍量であることを特徴とする請求項 5 又は 6 記載の方法。

【請求項 11】

請求項 5 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の方法で得られる請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の粉末吸入薬。

【請求項 12】

請求項 5 ~ 10 のいずれか 1 項に従って得られる球状ナノ構造微粒子の形態の活性物質塩基 (A) の、肺吸入又は鼻吸入用粉末吸入薬を製造するための使用。

【請求項 13】

請求項 1 ~ 4 又は 11 のいずれか 1 項に記載の粉末吸入薬を含有し、10 ~ 100mgの活性物質含量を有する、予計量型製剤形態。

【請求項 14】

請求項 1 ~ 4 又は 11 のいずれか 1 項に記載の粉末吸入薬を含有し、10 ~ 100mgの活性物質含量を有する、吸入用カプセル剤 (粉末インハレット)。