

【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28年6月30日(2016.6.30)

【公表番号】特表2015-519330(P2015-519330A)

【公表日】平成27年7月9日(2015.7.9)

【年通号数】公開・登録公報2015-044

【出願番号】特願2015-510480(P2015-510480)

【国際特許分類】

A 6 1 K	9/16	(2006.01)
A 6 1 K	9/51	(2006.01)
A 6 1 K	9/54	(2006.01)
A 6 1 K	9/58	(2006.01)
A 6 1 K	9/26	(2006.01)
A 6 1 K	9/32	(2006.01)
A 6 1 K	47/34	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	9/16
A 6 1 K	9/51
A 6 1 K	9/54
A 6 1 K	9/58
A 6 1 K	9/26
A 6 1 K	9/32
A 6 1 K	47/34

【手続補正書】

【提出日】平成28年5月13日(2016.5.13)

【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】

複数の被覆された粒子を含む組成物であって、前記被覆された粒子が、  
固体の医薬品またはその塩を含む芯粒子であって、前記医薬品またはその塩がpH範囲  
の間の任意の箇所で25で約1mg/mL以下の水溶性を有し、前記医薬品またはその塩が前記芯粒子の少なくとも約80重量%を構成する、芯粒子；及び

前記芯粒子を取り囲む表面改変剤を含むコーティングであって、前記表面改変剤が、親水性ブロック-疎水性ブロック-親水性ブロックの配置を含むトリブロックコポリマーを  
含み、前記疎水性ブロックが少なくとも約2kDaの分子量を有し、前記親水性ブロック  
が前記トリブロックコポリマーの少なくとも約15重量%を構成し、前記疎水性ブロック  
が前記芯粒子の表面と会合し、前記親水性ブロックが前記被覆された粒子の表面に存在し  
、前記被覆された粒子を親水性にし、前記表面改変剤が前記芯粒子の表面上に少なくとも  
約0.001分子/nm<sup>2</sup>の密度で存在する、コーティング、

を含み、前記被覆された粒子が、粘液中で0.5を超える相対速度を有する、組成物。

【請求項2】

複数の被覆された粒子を含む組成物を粘液膜に送達することを含む方法であって、前記  
被覆された粒子が、

固体の医薬品またはその塩を含む芯粒子であって、前記医薬品またはその塩がpH範囲

の間の任意の箇所で 25 で約 1 mg / mL 以下の水溶性を有し、前記医薬品またはその塩が前記芯粒子の少なくとも約 80 重量 % を構成する芯粒子；及び

芯粒子を取り囲む表面改変剤を含むコーティングであって、前記表面改変剤が、親水性ブロック - 疎水性ブロック - 親水性ブロックの配置を含むトリブロックコポリマーを含み、前記疎水性ブロックが少なくとも約 2 kDa の分子量を有し、前記親水性ブロックが前記トリブロックコポリマーの少なくとも約 15 重量 % を構成し、前記疎水性ブロックが、芯粒子の表面と会合し、前記親水性ブロックが前記被覆された粒子の表面に存在し、前記被覆された粒子を親水性にし、前記表面改変剤が芯粒子の表面上に少なくとも約 0.001 分子 / nm<sup>2</sup> の密度で存在する、コーティング、

を含み、前記被覆された粒子が、粘液中で 0.5 を超える相対速度を有する、方法。

【請求項 3】

被覆された粒子を形成する方法であって、

芯粒子を、表面改変剤を含む溶液と組み合わせる工程、ここで前記芯粒子は、25 の溶液中で約 1 mg / mL 以下の溶解性を有し、芯粒子のそれぞれの少なくとも約 80 重量 % を構成する固体の医薬品またはその塩を含む；

前記芯粒子を表面改変剤で被覆して、被覆された粒子を形成する工程、ここで前記表面改変剤は、親水性ブロック - 疎水性ブロック - 親水性ブロックの配置を含むトリブロックコポリマーを含み、前記疎水性ブロックが少なくとも約 2 kDa の分子量を有し、前記親水性ブロックがトリブロックコポリマーの少なくとも約 15 重量 % を構成し、前記疎水性ブロックが、芯粒子の表面と会合し、前記親水性ブロックが、被覆された粒子の表面に存在し、被覆された粒子を親水性にし、被覆された粒子が、粘液中で 0.5 を超える相対速度を有する；

を含む、方法。

【請求項 4】

表面改変剤が、芯粒子に共有結合で結合している、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 5】

表面改変剤が、芯粒子に非共有結合で吸着している、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 6】

表面改変剤が、被覆された粒子の表面上に、1 平方ナノメートルにつき、少なくとも約 0.01 分子の密度で存在する、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 7】

トリブロックコポリマーの親水性ブロックが、トリブロックコポリマーの少なくとも約 30 重量 % を構成する、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 8】

トリブロックコポリマーの疎水性ブロックが、少なくとも約 3 kDa の分子量を有する、請求項 7 に記載の組成物。

【請求項 9】

トリブロックコポリマーが、ポリ(エチレンオキシド) - ポリ(プロピレンオキシド) - ポリ(エチレンオキシド) またはポリ(エチレングリコール) - ポリ(プロピレンオキシド) - ポリ(エチレングリコール) である、請求項 8 に記載の組成物。

【請求項 10】

トリブロックコポリマーの親水性ブロックが、ポリ(エチレンオキシド)もしくはポリ(エチレングリコール)、またはこれらの誘導体を含む、請求項 7 に記載の組成物。

【請求項 11】

ポリ(エチレンオキシド) またはポリ(エチレングリコール) ブロックが、少なくとも約 2 kDa の分子量を有する、請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 12】

トリブロックコポリマーの疎水性ブロックが、ポリ(プロピレンオキシド) である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 13】

ポリ(プロピレンオキシド)ブロックが、少なくとも約3kDaの分子量を有する、請求項12に記載の組成物。

【請求項14】

表面改変剤が、溶液中に少なくとも約0.1(重量/容積)%の濃度で存在する、請求項1に記載の組成物。

【請求項15】

芯粒子のそれぞれが、結晶性医薬品またはその塩を含む、請求項1に記載の組成物。

【請求項16】

芯粒子のそれぞれが、非晶性医薬品またはその塩を含む、請求項1に記載の組成物。

【請求項17】

芯粒子のそれぞれが、固体医薬品の塩を含む、請求項1に記載の組成物。

【請求項18】

医薬品が、治療用薬剤または診断用薬剤の少なくとも1種である、請求項1に記載の組成物。

【請求項19】

医薬品が、小分子、ペプチド、ペプチド模倣体、タンパク質、核酸、または脂質の少なくとも1種である、請求項1に記載の組成物。

【請求項20】

医薬品またはその塩が、25で約0.1mg/mL以下の水溶性を有する、請求項1に記載の組成物。

【請求項21】

医薬品が、芯粒子の少なくとも約85重量%を構成する、請求項1に記載の組成物。

【請求項22】

芯粒子が、少なくとも約20nmかつ約1μm以下の平均サイズを有する、請求項1に記載の組成物。

【請求項23】

被覆された粒子が、少なくとも約20nmかつ約1μm以下の平均サイズを有する、請求項1に記載の組成物。

【請求項24】

被覆された粒子が、ヒト子宮頸腔粘液中を、1秒の時間尺度で、粒子が水中を拡散する拡散係数の1/500を超える拡散係数で拡散する、請求項1に記載の組成物。

【請求項25】

被覆された粒子が、粘液中で0.8を超える相対速度を有する、請求項1に記載の組成物。

【請求項26】

粘液がヒト頸部粘液である、請求項1に記載の組成物。

【請求項27】

請求項1に記載の組成物および1種または複数の薬学上許容される担体、添加物、および/または希釈剤を含む医薬組成物。

【請求項28】

請求項1に記載の組成物を含む、粘液膜に吸入、注射、または局所投与するのに適した医薬製剤。