

【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1月25日(2007.1.25)

【公表番号】特表2006-513236(P2006-513236A)
 【公表日】平成18年4月20日(2006.4.20)
 【年通号数】公開・登録公報2006-016
 【出願番号】特願2004-564917(P2004-564917)
 【国際特許分類】

A 6 1 K 47/24 (2006.01)
A 6 1 K 47/16 (2006.01)
A 6 1 K 9/12 (2006.01)
A 6 1 K 9/50 (2006.01)
A 6 1 P 31/10 (2006.01)
A 6 1 K 31/7048 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 47/24
 A 6 1 K 47/16
 A 6 1 K 9/12
 A 6 1 K 9/50
 A 6 1 P 31/10
 A 6 1 K 31/7048

【手続補正書】
 【提出日】平成18年11月30日(2006.11.30)
 【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】

肺投与用医薬製剤であって、脂質マトリックス中に、1.0mg/ml未満の水溶解度を有する活性物質粒子を含む微粒子を含み；

ここで、当該医薬製剤中の活性物質粒子の少なくとも90%は、3 μ m未満の幾何学的直径を有し、且つ当該微粒子は20 μ m未満の質量平均直径を有する、前記医薬製剤。

【請求項2】

前記微粒子が10 μ m未満の質量平均直径を有する、請求項1に記載の医薬製剤。

【請求項3】

前記微粒子が5 μ m未満の質量平均直径を有する、請求項1に記載の医薬製剤。

【請求項4】

前記微粒子が5 μ m未満の質量平均空気力学的直径を有する、請求項1に記載の医薬製剤。

【請求項5】

前記活性物質粒子の少なくとも50%が、0.5 μ m～3 μ mの間の幾何学的直径を有する、請求項1に記載の医薬製剤。

【請求項6】

前記脂質マトリックスが1以上の燐脂質を含む、請求項1に記載の医薬製剤。

【請求項7】

前記脂質マトリックスが1以上のジパルミトイルホスファチジルコリン、ジステロイルホスファチジルコリン、ジアラキドイルホスファチジルコリン、ジベヘノイルホスファチ

ジルコリン、ジホスファチジルグリセロール、短鎖ホスファチジルコリン類、長鎖飽和ホスファチジルエタノールアミン類、長鎖飽和ホスファチジルセリン類、長鎖飽和ホスファチジルグリセロール類、および長鎖飽和ホスファチジリンノシトール類を含む、請求項1に記載の医薬製剤。

【請求項8】

前記微粒子が中空である、請求項1に記載の医薬製剤。

【請求項9】

前記微粒子が多孔性である、請求項1に記載の医薬製剤。

【請求項10】

前記微粒子が中空且つ多孔性である、請求項1に記載の医薬製剤。

【請求項11】

前記医薬製剤が $0.5\text{g}/\text{cm}^3$ 未満の嵩密度を有する、請求項1に記載の医薬製剤。

【請求項12】

前記医薬製剤が $0.3\text{g}/\text{cm}^3$ 未満の嵩密度を有する、請求項1に記載の医薬製剤。

【請求項13】

前記医薬製剤が $0.2\text{g}/\text{cm}^3$ 未満の嵩密度を有する、請求項1に記載の医薬製剤。

【請求項14】

前記微粒子が、乾燥粉末吸入器中でエアロゾル化のための乾燥粉末形態である、請求項1に記載の医薬製剤。

【請求項15】

前記微粒子が、計量式吸入器中でエアロゾル化のための推進剤中に懸濁されている、請求項1に記載の医薬製剤。

【請求項16】

前記微粒子が、ネブライザー中でエアロゾル化のための液体中に懸濁されている、請求項1に記載の医薬製剤。

【請求項17】

前記活性物質粒子が結晶性である、請求項1に記載の医薬製剤。

【請求項18】

前記微粒子が多価カチオンをさらに含む、請求項1に記載の医薬製剤。

【請求項19】

前記活性物質が $0.1\text{mg}/\text{ml}$ 未満の水溶解度を有する、請求項1に記載の医薬製剤。

【請求項20】

前記微粒子がスプレードライにより形成される、請求項1に記載の医薬製剤。

【請求項21】

前記不溶性活性物質が抗真菌剤を含む、請求項1に記載の医薬製剤。

【請求項22】

肺投与のための医薬製剤の製造方法であって、当該方法が活性物質粒子と疎水性材料を液体供給原料中に懸濁すること、ここで、当該活性物質粒子の少なくとも90%が $3\mu\text{m}$ 未満の幾何学的直径を有する；及び、

当該供給原料懸濁液をスプレードライして、活性物質粒子を該疎水性材料中に少なくとも部分的に含む微粒子を製造することを含む、前記方法。

【請求項23】

請求項22に記載の方法により製造された医薬製剤。

【請求項24】

肺投与のための医薬製剤であって、

脂質マトリックス中にアンフォテリシンB粒子を含む微粒子を含み；

ここで、当該医薬製剤中のアンフォテリシンB粒子の少なくとも90%は、 $3\mu\text{m}$ 未満の幾何学的直径を有し、且つ当該微粒子は $10\mu\text{m}$ 未満の質量平均直径を有する、前記医薬製剤。

【請求項 25】

前記微粒子が $6\mu\text{m}$ 未満の質量平均直径を有する、請求項24に記載の医薬製剤。

【請求項 26】

前記微粒子の少なくとも幾らかが、脂質マトリックス中にアンフォテリシンB粒子を多数含む、請求項24に記載の医薬製剤。

【請求項 27】

前記アンフォテリシンB粒子が結晶性である、請求項24に記載の医薬製剤。

【請求項 28】

前記脂質マトリックスが1以上のジパルミトイルホスファチジルコリン、ジステロイルホスファチジルコリン、ジアラキドイルホスファチジルコリン、ジベヘノイルホスファチジルコリン、ジホスファチジルグリセロール、短鎖ホスファチジルコリン類、長鎖飽和ホスファチジルエタノールアミン類、長鎖飽和ホスファチジルセリン類、長鎖飽和ホスファチジルグリセロール類、および長鎖飽和ホスファチジリノシトール類を含む、請求項24に記載の医薬製剤。

【請求項 29】

前記微粒子が中空および/または多孔性である、請求項24に記載の医薬製剤。

【請求項 30】

前記微粒子が $0.5\text{g}/\text{cm}^3$ 未満の嵩密度を有する、請求項24に記載の医薬製剤。

【請求項 31】

前記微粒子が $0.3\text{g}/\text{cm}^3$ 未満の嵩密度を有する、請求項24に記載の医薬製剤。

【請求項 32】

前記微粒子が、乾燥粉末吸入器中でエアロゾル化のための乾燥粉末形態である、請求項24に記載の医薬製剤。

【請求項 33】

前記微粒子が、計量式吸入器中でエアロゾル化のための駆出剤中に懸濁されている、請求項24に記載の医薬製剤。

【請求項 34】

前記微粒子が、ネブライザー中でエアロゾル化のための液体中に懸濁されている、請求項24に記載の医薬製剤。

【請求項 35】

前記微粒子が多価カチオンをさらに含む、請求項24に記載の医薬製剤。

【請求項 36】

前記微粒子がスプレードライにより形成される、請求項24に記載の医薬製剤。

【請求項 37】

前記微粒子が $5\mu\text{m}$ 未満の質量平均空気力学的直径を有する、請求項24に記載の医薬製剤。

—

【請求項 38】

肺投与のための医薬製剤の製造法であって、当該方法がアンフォテリシンB粒子と疎水性材料を液体供給原料中に懸濁すること、ここで、当該活性物質粒子の少なくとも90%は $3\mu\text{m}$ 未満の幾何学的直径を有する；及び、

当該供給原料懸濁液をスプレードライして、アンフォテリシンB粒子を該疎水性材料中に少なくとも部分的に含む微粒子を製造することを含む、前記方法。

【請求項 39】

請求項38に記載の方法により製造された医薬製剤。

【請求項 40】

前記微粒子が $5\mu\text{m}$ 未満の質量平均空気学的直径を有する、請求項39に記載の医薬製剤。

【請求項 41】

前記微粒子が中空および/または多孔性である、請求項38に記載の医薬製剤。