

【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12月14日(2017.12.14)

【公表番号】特表2017-514843(P2017-514843A)

【公表日】平成29年6月8日(2017.6.8)

【年通号数】公開・登録公報2017-021

【出願番号】特願2016-565482(P2016-565482)

【国際特許分類】

A 6 1 K	47/24	(2006.01)
A 6 1 K	9/08	(2006.01)
A 6 1 K	47/10	(2006.01)
A 6 1 K	47/36	(2006.01)
A 6 1 K	47/38	(2006.01)
A 6 1 K	47/34	(2017.01)
A 6 1 K	47/32	(2006.01)
A 6 1 K	47/28	(2006.01)
A 6 1 K	47/14	(2006.01)
A 6 1 K	31/573	(2006.01)
A 6 1 K	31/56	(2006.01)
A 6 1 P	27/02	(2006.01)
A 6 1 P	27/06	(2006.01)
A 6 1 P	27/04	(2006.01)
A 6 1 P	27/14	(2006.01)
A 6 1 K	9/10	(2006.01)
A 6 1 K	9/51	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	47/24
A 6 1 K	9/08
A 6 1 K	47/10
A 6 1 K	47/36
A 6 1 K	47/38
A 6 1 K	47/34
A 6 1 K	47/32
A 6 1 K	47/28
A 6 1 K	47/14
A 6 1 K	31/573
A 6 1 K	31/56
A 6 1 P	27/02
A 6 1 P	27/06
A 6 1 P	27/04
A 6 1 P	27/14
A 6 1 K	9/10
A 6 1 K	9/51

【手続補正書】

【提出日】平成29年10月31日(2017.10.31)

【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】

液晶性ドラッグデリバリーシステムを製造する方法であって、該方法は、

脂質成分及びアルコールを含有する第1の溶液を形成すること（ここで、該第1の溶液は40～55の温度に維持される）、

粘膜付着性の親水性ポリマー及びバッファーを含む第2の溶液を得ること（ここで、該第2の溶液は水溶液であり、5～55の温度に維持される）、

前記第1の溶液と前記第2の溶液とを混合することで、ナノ分散液とマイクロ分散液とが組み合わされた分散液を形成すること（ここで、該混合は、超音波処理、高剪断混合及びこれらの組み合わせから選択される高エネルギー混合プロセスによって達成される）、

前記ナノ分散液とマイクロ分散液とが組み合わされた分散液を-10°～室温の温度でマイクロ流動化にかけることで、ナノ分散液を形成すること、及び

該ナノ分散液を2～5でインキュベートすることで、液晶性ドラッグデリバリーシステムを形成すること、

を含み、ここで前記第1の溶液と前記第2の溶液との間の重量比は、1：1～1：15であり、

前記脂質成分は、ホスファチジルコリン及び中鎖脂肪（medium chain triglycerides）を含み、前記アルコールは、セチルアルコールであり、かつ前記粘膜付着性の親水性ポリマーは、ヒアルロン酸ナトリウム、キサンタンガム、グーガム、カルボキシメチルセルロース、1-4-グルカン、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）、タマリンド種子多糖類、アルギン酸ナトリウム、ポリカーボポール及びポリカルボフィル又はそれらの混合物からなる群から選択される、

方法。

【請求項2】

前記第1の溶液は、コレステロール、ポリエチレングリコール（PEG）400、ポリプロピレングリコール（PPG）、ステアリン酸PEG、ポロキサマー407、チロキサポール、ポリソルベート80、ポリ（乳酸-co-グリコール酸）又はヒマシ油を更に含有する、請求項1に記載の方法。

【請求項3】

前記第1の溶液中に少なくとも一種の医薬品有効成分（API）を溶解させることを更に含み、

前記少なくとも一種のAPIは、プロピオン酸フルチカゾン、デキサメタゾン、ベタメタゾン、ブデソニド、トリアムシノロンアセトニド、メチルプレドニゾロン、コルチゾン、ベクロメタゾン、フロ酸フルチカゾン、酢酸デオキシコルチコステロン、エタボン酸口テブレドノール、ジフルプレドナート、フルオロメトロン、リメキソロン、トラボプロスト、アジスロマイシン、モキシフロキサシン、ネチルマイシン、ネパフェナク、ジクロフェナク、ジフルプレドナート、ポサコナゾール、及び酢酸プレドニゾロンからなる群から選択される、

請求項1に記載の方法。

【請求項4】

水溶液中に分散されたナノ粒子を含む液晶性ドラッグデリバリーシステムであって、ここで該ナノ粒子は、脂質成分及びアルコールを含み、前記水溶液は、粘膜付着性の親水性ポリマー及びバッファーを含有し、該脂質成分は、該システムの0.1重量%～1重量%で存在し、該アルコールは、該システムの0.1重量%～5重量%で存在し、前記粘膜付着性の親水性ポリマーは、該システムの1重量%～5重量%で存在し、前記ナノ粒子は、40nm～900nmのサイズを有し、

該システムは、6～7.5のpH、250mOs m/L～340mOs m/Lのモル浸透圧濃度、及び200cP～1000cPの粘度を有し、

前記脂質成分は、ホスファチジルコリン及び中鎖脂肪を含み、前記アルコールは、セチルアルコールであり、かつ前記粘膜付着性の親水性ポリマーは、ヒアルロン酸ナトリウム、キサンタンガム、グーガム、カルボキシメチルセルロース、1-4-グルカン、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)、タマリンド種子多糖類、アルギン酸ナトリウム、ポリカーボポール、ポリカルボフィル及びそれらの混合物からなる群から選択される、

液晶性ドラッグデリバリーシステム。

【請求項5】

前記ナノ粒子は、コレステロール、ポリエチレングリコール(PEG)400、ポリプロピレングリコール(PPG)、ステアリン酸PEG、ポロキサマー407、チロキサポール、ポリソルベート80、ヒマシ油、PEG化ヒマシ油、ポリ(乳酸-co-グリコール酸)又はそれらの混合物を更に含む、請求項4に記載の液晶性ドラッグデリバリーシステム。

【請求項6】

医薬品有効成分(API)を前記システムの0.01重量%~0.5重量%で更に含み、ここで該APIは、前記ナノ粒子中に入れられており、該APIは、抗炎症剤、ペプチド、抗酸化剤、アゾール誘導体、抗線内障薬、又はこれらの組み合わせである、

請求項4に記載の液晶性ドラッグデリバリーシステム。

【請求項7】

医薬品有効成分(API)を前記システムの0.01重量%~0.5重量%で更に含み、ここで該APIは、前記ナノ粒子中に入れられており、前記APIは、プロピオン酸フルチカゾン、デキサメタゾン、ベタメタゾン、ブデソニド、トリアムシノロンアセトニド、メチルプレドニゾロン、コルチゾン、ベクロメタゾン、フロ酸フルチカゾン、酢酸デオキシコルチコステロン、エタボン酸ロテプレドノール、ジフルプレドナート、フルオロメトロン、リメキソロン、トラボプロスト、モキシフロキサシン、アジスロマイシン、ネチルマイシン、ネパフェナク、ジクロフェナク、ジフルプレドナート、ポサコナゾール、酢酸プレドニゾロン、及びこれらの組み合わせからなる群から選択される、請求項4に記載の液晶性ドラッグデリバリーシステム。

【請求項8】

眼疾患を治療するための請求項6に記載の液晶性ドラッグデリバリーシステム。

【請求項9】

前記眼疾患は、術後炎症、炎症、アレルギー性鼻炎、アレルギー性結膜炎、マイボーム腺機能不全、感染症、結膜炎、角膜炎、潰瘍、眼瞼炎、線内障、ブドウ膜炎、糖尿病性黄斑浮腫、糖尿病性網膜症、加齢性黄斑変性、眼内炎、脈絡膜血管新生、涙管機能不全、角膜水疱又はドライアイ病である、請求項8に記載の液晶性ドラッグデリバリーシステム。

【請求項10】

硝子体注射、眼へのスプレー、又は点眼液によって投与される、請求項8に記載の液晶性ドラッグデリバリーシステム。

【請求項11】

前記眼疾患が眼瞼炎であり、前記APIがプロピオン酸フルチカゾンである、請求項9に記載の液晶性ドラッグデリバリーシステム。

【請求項12】

前記眼疾患がアレルギー性結膜炎であり、前記APIがエタボン酸ロテプレドノールである、請求項9に記載の液晶性ドラッグデリバリーシステム。

【請求項13】

前記眼疾患が術後炎症であり、前記APIがデキサメタゾンである、請求項9に記載の液晶性ドラッグデリバリーシステム。

【請求項14】

前記眼疾患が感染症であり、前記APIがモキシフロキサシンである、請求項9に記載の液晶性ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 15】

前記眼疾患が角膜炎であり、前記A P Iがアゾール誘導体である、請求項9に記載の液晶性ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 16】

前記眼疾患がブドウ膜炎である、請求項9に記載の液晶性ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 17】

前記眼疾患が緑内障である、請求項9に記載の液晶性ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 18】

前記眼疾患が糖尿病性網膜症である、請求項9に記載の液晶性ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 19】

前記眼疾患が加齢性黄斑変性である、請求項9に記載の液晶性ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 20】

前記眼疾患が脈絡膜血管新生である、請求項9に記載の液晶性ドラッグデリバリーシステム。