

【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22年10月7日(2010.10.7)

【公表番号】特表2010-501520(P2010-501520A)

【公表日】平成22年1月21日(2010.1.21)

【年通号数】公開・登録公報2010-003

【出願番号】特願2009-525050(P2009-525050)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/536 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/72 (2006.01)

A 6 1 K 9/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/536

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 11/00

A 6 1 K 9/72

A 6 1 K 9/14

A 6 1 K 47/26

【手続補正書】

【提出日】平成22年8月20日(2010.8.20)

【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

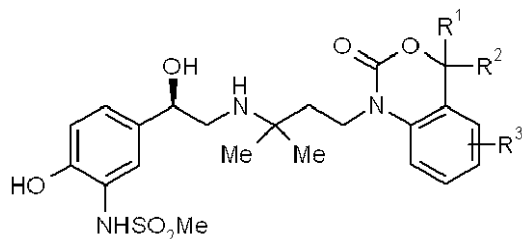
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

1 以上の光学異性的に純粋な一般式 1 の化合物



(式中、

R^1 及び R^2 は互いに独立して H、ハロゲン又は C_{1-4} -アルキルであり又は共に C_{1-6} -アルキレンであり;及び

R^3 は H、ハロゲン、OH、 C_{1-4} -アルキル又は $O-C_{1-4}$ -アルキル;である)

を含む吸入用粉末であって、前記化合物は任意に医薬的に許容可能な酸付加塩、それらの水和物又は溶媒和物の形態であり、任意に 1 以上の生理学的に許容可能な賦形剤との混合物である、前記吸入用粉末。

【請求項 2】

1 以上の光学異性的に純粋な一般式 1 の化合物

(式中、

R^1 及び R^2 は同じ又は異なって水素、フッ素、塩素、メチル、エチル、プロピル、ブチル又は共に $-\text{CH}_2-\text{CH}_2$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2$ 又は $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ であり； R^3 は水素、フッ素、塩素、OH、メチル、エチル、メトキシ又はエトキシである）であって、任意に医薬的に許容可能な酸付加塩、それらの水和物又は溶媒和物の形態であり、任意に 1 以上の生理学的に許容可能な賦形剤との混合物である前記化合物を含む請求項 1 記載の吸入用粉末。

【請求項 3】

1 以上の光学異性的に純粋な一般式 1 の化合物

(式中、

R^1 及び R^2 は同じ又は異なって、水素、メチル、エチル、プロピルであり、又は共に $-\text{CH}_2-\text{CH}_2$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2$ 又は $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ であり；

R^3 は水素、フッ素、OH、メチル又はメトキシである）

であって、任意に医薬的に許容可能な酸付加塩、それらの水和物又は溶媒和物の形態であり、任意に 1 以上の生理学的に許容可能な賦形剤との混合物である前記化合物を含む請求項 1 又は 2 記載の吸入用粉末。

【請求項 4】

1 以上の光学異性的に純粋な一般式 1 の化合物

(式中、

R^1 及び R^2 は同じ又は異なって、エチル、プロピル又は共に $-\text{CH}_2-\text{CH}_2$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2$ 又は $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ であり；

R^3 は水素、フッ素、OH、メチル又はメトキシである）

であって、任意に医薬的に許容可能な酸付加塩、それらの水和物又は溶媒和物の形態であり、任意に 1 以上の生理学的に許容可能な賦形剤との混合物である前記化合物を含む、請求項 1、2 又は 3 記載の吸入用粉末。

【請求項 5】

1 以上の光学異性的に純粋な一般式 1 の化合物

(式中

R^1 及び R^2 はエチル、プロピルであり又は共に $-\text{CH}_2-\text{CH}_2$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2$ 又は $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ であり；

R^3 は水素、フッ素、OH又はメトキシである）

であって、任意に医薬的に許容可能な酸付加塩、それらの水和物又は溶媒和物の形態であり、任意に 1 以上の生理学的に許容可能な賦形剤との混合物である前記化合物を含む、請求項 1、2 又は 3 記載の吸入用粉末。

【請求項 6】

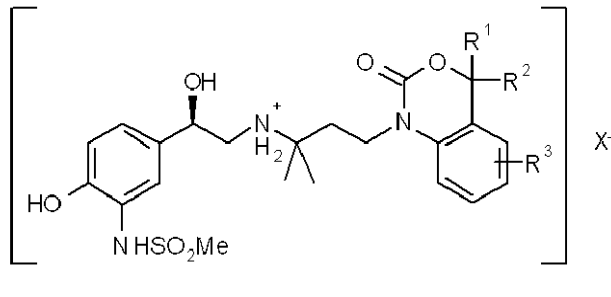
1 以上の光学異性的に純粋な一般式 1 の化合物であって、それらの遊離塩基の形態である前記化合物を含む、請求項 1～5 いずれか 1 項記載の吸入用粉末

【請求項 7】

1 以上の光学異性的に純粋な一般式 1 の化合物であって、それらの医薬的に許容可能な酸付加塩の形態である前記化合物を含む、請求項 1～5 いずれか 1 項記載の吸入用粉末。

【請求項 8】

1 以上の光学異性的に純粋な一般式 1 の化合物が、
一般式 1 -HX



(式中

X⁻は単置換又は多置換された負に荷電したアニオンであり、及び基R¹、R²及びR³は上記定義の通りである)のそれらの酸付加塩の形態であり、任意に互変異性体、互変異性体の混合物、それらの水和物又は溶媒和の形態であり、及び任意に1以上の生理学的に許容可能な賦形剤との混合物である、前記化合物を含む、請求項1～5又は7いずれか1項記載の吸入用粉末。

【請求項9】

一般式1の化合物が、0.1 μm～10 μmの固有の粒径X₅₀及び60%より高いパラメータ-Q_(5,8)を有することを特徴とする、請求項1～8いずれか1項記載の吸入用粉末。

【請求項10】

一般式1の化合物を微粉末化し、続いてペンタン、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン、エタノール、メタノール、クロロホルム及び塩化メチレンから選択される有機溶媒を用いて順化することを特徴とする、請求項1～9いずれか1項記載の吸入用粉末。

【請求項11】

1以上の一般式1の化合物のみを含むことを特徴とする、請求項1～10いずれか1項記載の吸入用粉末。

【請求項12】

1以上の一般式1の化合物に加えて、少なくとも1つの生理学的に許容可能な賦形剤を含み、前記化合物が任意にそれらの水和物又は無水和物の形態であることを特徴とする、請求項1～10いずれか1項記載の吸入用粉末。

【請求項13】

生理学的に許容可能な賦形剤が、単糖類、二糖類、オリゴ糖類および多糖類、ポリラクチド/グリコリド、多価アルコール、アミノ酸、キトサン、ステアリン酸のアルカリ金属塩およびアルカリ土類金属塩、およびこれらの賦形剤同士の混合物から選択され、任意にそれらの水和物又は無水和物の形態であることを特徴とする、請求項12記載の吸入用粉末。

【請求項14】

生理学的に許容可能な賦形剤がグルコース、フルクトース、アラビノース、ラクトース、サッカロース、マルトース、トレハロース、マルトデキストリン、デンプン、セルロース、レゾマー、ソルビトール、マンニトール、キシリトール、塩酸アルギニン、ステアリン酸Mg、塩化ナトリウム、炭酸カルシウム及びこれらの賦形剤同士の混合物からなる群から選択され、任意にそれらの水和物又は無水和物の形態であることを特徴とする、請求項13記載の吸入用粉末。

【請求項15】

生理学的に許容可能な賦形剤がグルコース、フルクトース、アラビノース、ラクトース、サッカロース、マルトース、トレハロース、マルトデキストリン及びこれらの賦形剤同士の混合物からなる群から選択され、任意にそれらの水和物又は無水和物の形態であることを特徴とする、請求項14記載の吸入用粉末。

【請求項16】

式1の化合物と生理学的に許容可能な賦形剤の比が5:100～1:1000000の範囲であることを特徴とする、請求項1～15いずれか1項記載の吸入用粉末。

【請求項 17】

生理学的に許容可能な賦形剤が約 $1.7 \sim 120 \mu\text{m}$ の平均粒子径を有することを特徴とする、請求項 1 ～ 15 いずれか 1 項記載の吸入用粉末。

【請求項 18】

請求項 1 ～ 17 いずれか 1 項記載の吸入用粉末の呼吸器疾患の治療の為に医薬組成物の調製の為に使用。

【請求項 19】

請求項 1 ～ 17 いずれか 1 項記載の吸入用粉末を含むことを特徴とする、医薬製剤。