

【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1月21日(2016.1.21)

【公表番号】特表2015-513311(P2015-513311A)

【公表日】平成27年5月7日(2015.5.7)

【年通号数】公開・登録公報2015-030

【出願番号】特願2014-547437(P2014-547437)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/436 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/436

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/12

A 6 1 P 37/06

【手続補正書】

【提出日】平成27年11月20日(2015.11.20)

【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】

a . 疎水性のポリ(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)ブロックコポリマーと、

b . 親水性のポリ(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)ブロックコポリマーと、

c . ラパマイシンと

を含む、乾燥し、流動性及び圧縮性のある組成物。

【請求項2】

ラパマイシンと、

i . a : b の w / w 比率が 1 : 4 以上である (a) 平均分子量が 2 0 0 0 であり疏水性物質の重量パーセントが 9 0 % である疏水性のポリ(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)ブロックコポリマー及び (b) 平均分子量が 1 2 , 6 0 0 であり疏水性物質の重量パーセントが 3 0 % である親水性のポリ(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)ブロックコポリマーの混合物、

ii . a : b の w / w 比率が 1 : 3 以上である (a) 平均分子量が 2 7 5 0 であり疏水性物質の重量パーセントが 9 0 % である疏水性のポリ(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)ブロックコポリマー及び (b) 平均分子量が 1 2 , 6 0 0 であり疏水性物質の重量パーセントが 3 0 % である親水性のポリ(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)ブロックコポリマーの混合物、

iii . a : b の w / w 比率が 1 : 4 以上である (a) 平均分子量が 3 6 5 0 であり疏水性物質の重量パーセントが 8 0 % である疏水性のポリ(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)ブロックコポリマー及び(b)平均分子量が7,700であり疎水性物質の重量パーセントが30%である親水性のポリ(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)ブロックコポリマーの混合物、

iv. a : b の w / w 比率が1 : 3以上である(a)平均分子量が3650であり疎水性物質の重量パーセントが80%である疎水性のポリ(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)ブロックコポリマー及び(b)平均分子量が14,600であり疎水性物質の重量パーセントが20%である親水性のポリ(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)ブロックコポリマーの混合物、並びに

v. a : b の w / w 比率が1 : 4以上である(a)平均分子量が3650であり疎水性物質の重量パーセントが80%である疎水性のポリ(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)ブロックコポリマー及び(b)平均分子量が12,600であり疎水性物質の重量パーセントが30%である親水性のポリ(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)ブロックコポリマーの混合物

からなる群から選択される混合物とを含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 3】

i. (a) : (b) の w / w 比率が1 : 4以上である(a)平均分子量が3650であり疎水性物質の重量パーセントが80%であるポリ(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)ブロックコポリマー及び(b)平均分子量が12,600であり疎水性物質の重量パーセントが30%であるポリ(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)ブロックコポリマーの混合物と、

ii. ラパマイシンと

を含む、請求項 2 に記載の組成物。

【請求項 4】

ラパマイシンと、

i. w / w 比率が1 : 4以上であるPluronic L61とPluronic F127の混合物、

ii. w / w 比率が1 : 3以上であるPluronic L81とPluronic F127の混合物、

iii. w / w 比率が1 : 4以上であるPluronic L92とPluronic F87の混合物、

iv. w / w 比率が1 : 3以上であるPluronic L92とPluronic F108の混合物、及び

v. w / w 比率が1 : 4以上であるPluronic L92とPluronic F127の混合物

からなる群から選択される混合物とを含む、請求項 1 ~ 3 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 5】

w / w 比率が1 : 4以上であるPluronic L92とPluronic F127の混合物を含む、請求項 4 に記載の組成物。

【請求項 6】

親水性のポリ(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)ブロックコポリマーと疎水性のポリ(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)ブロックコポリマーの総重量を基準として、少なくとも5重量%の親水性のポリ(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)ブロックコポリマーを含む、請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 7】

親水性のポリ(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)ブロックコポリマーと疎水性のポリ(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)ブロックコポリマーの総重量を基準として、少なくとも10重量%の親水性のポリ(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)ブロックコポリマーを含む、請求項 6 に記載の組成物。

【請求項 8】

Carr指数が20未満である、請求項1~7のいずれかに記載の組成物。

【請求項 9】

Carr指数が10未満である、請求項8に記載の組成物。

【請求項 10】

Carr指数が5未満である、請求項9に記載の組成物。

【請求項 11】

安定化剤をさらに含む、請求項1~10のいずれかに記載の組成物。

【請求項 12】

安定化剤がクエン酸である、請求項11に記載の組成物。

【請求項 13】

乾燥し、流動性及び圧縮性のあるラパマイシン組成物を調製するための方法であって、
a. (i) 疎水性のポリ(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)ブロックコポリマーと、(ii) 親水性のポリ(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)ブロックコポリマーと、(iii) ラパマイシンとを有機溶媒中で混合して有機混合物を形成するステップ、及び
b. 前記有機混合物を乾燥させるステップ

を含む方法。

【請求項 14】

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)ブロックコポリマーが、

i. a : b の w / w 比率が1 : 4 以上である (a) 平均分子量が2000 であり疏水性物質の重量パーセントが90 % である疏水性のポリ(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)ブロックコポリマーの混合物、及び (b) 平均分子量が12,600 であり疏水性物質の重量パーセントが30 % である親水性のポリ(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)ブロックコポリマーの混合物、

ii. a : b の w / w 比率が1 : 3 以上である (a) 平均分子量が2750 であり疏水性物質の重量パーセントが90 % である疏水性のポリ(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)ブロックコポリマーの混合物及び (b) 平均分子量が12,600 であり疏水性物質の重量パーセントが30 % である親水性のポリ(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)ブロックコポリマーの混合物、

iii. a : b の w / w 比率が1 : 4 以上である (a) 平均分子量が3650 であり疏水性物質の重量パーセントが80 % である疏水性のポリ(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)ブロックコポリマー及び (b) 平均分子量が7,700 であり疏水性物質の重量パーセントが30 % である親水性のポリ(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)ブロックコポリマーの混合物、並びに

iv. a : b の w / w 比率が1 : 3 以上である (a) 平均分子量が3650 であり疏水性物質の重量パーセントが80 % である疏水性のポリ(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)ブロックコポリマー及び (b) 平均分子量が14,600 であり疏水性物質の重量パーセントが20 % である親水性のポリ(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)ブロックコポリマーの混合物、並びに

v. a : b の w / w 比率が1 : 4 以上である (a) 平均分子量が3650 であり疏水性物質の重量パーセントが80 % である疏水性のポリ(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)ブロックコポリマー及び (b) 平均分子量が12,600 であり疏水性物質の重量パーセントが30 % である親水性のポリ(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)ブロックコポリマ

ーの混合物

からなる群から選択される、請求項 1 3 に記載の方法。

【請求項 1 5】

ステップ(a)が、

- i . w / w 比率が1 : 4 以上であるPluronic L61とPluronic F127の混合物、
- ii . w / w 比率が1 : 3 以上であるPluronic L81とPluronic F127の混合物、
- iii . w / w 比率が1 : 4 以上であるPluronic L92とPluronic F87の混合物、
- iv . w / w 比率が1 : 3 以上であるPluronic L92とPluronic F108の混合物、及び
- v . w / w 比率が1 : 4 以上であるPluronic L92とPluronic F127の混合物

からなる群から選択される混合物を混合することを含む、請求項 1 3 又は 1 4 に記載の方法。

【請求項 1 6】

有機溶媒が、アルコール及びハロゲン化炭化水素からなる群から選択される、請求項 1 3 ~ 1 5 のいずれかに記載の方法。

【請求項 1 7】

有機溶媒がエタノールである、請求項 1 3 ~ 1 6 のいずれかに記載の方法。

【請求項 1 8】

有機溶媒がジクロロメタンである、請求項 1 3 ~ 1 6 のいずれかに記載の方法。

【請求項 1 9】

少量の水が有機溶媒に加えられる、請求項 1 3 ~ 1 8 のいずれかに記載の方法。

【請求項 2 0】

水が、有機溶媒水混合物の2 5 重量%未満を占める、請求項 1 9 に記載の方法。