

【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21年11月5日(2009.11.5)

【公表番号】特表2009-507929(P2009-507929A)

【公表日】平成21年2月26日(2009.2.26)

【年通号数】公開・登録公報2009-008

【出願番号】特願2008-531320(P2008-531320)

【国際特許分類】

A 61 K 47/22 (2006.01)

【F I】

A 61 K 47/22

【手続補正書】

【提出日】平成21年9月10日(2009.9.10)

【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】

懸濁物中の予め形成された結晶性微粒子に対する活性薬剤の結合を促進する方法であつて、

i) ジケトピペラジンからなる予め形成された微粒子を得る工程、

ii) 該活性薬剤の化学ポテンシャルを改变する工程であつて、該改变する工程が、溶媒の除去とは関係なく、該活性薬剤と微粒子との間のエネルギー的に好ましい相互作用を可能にする、工程；および

iii) 該活性薬剤を該微粒子の表面上に吸着させる工程；
を包含する、方法。

【請求項2】

前記化学ポテンシャルを改变する工程は、前記活性薬剤の構造、可撓性、硬性、溶解性または安定性を改变する工程を包含する、請求項1に記載の方法。

【請求項3】

前記活性薬剤の化学ポテンシャルを改变する工程は、溶液の状態を変化させる工程を包含する、請求項2に記載の方法。

【請求項4】

前記溶液の状態を変化させる工程は、活性薬剤改変因子を該溶液に添加する工程を包含する、請求項3に記載の方法。

【請求項5】

前記活性薬剤改変因子は、塩、界面活性剤、イオン、オスモライト、アルコール、カオトロープ、コスモトロープ、酸、塩基、および有機溶媒からなる群より選択される、請求項4に記載の方法。

【請求項6】

前記塩は、塩化ナトリウムである、請求項5に記載の方法。

【請求項7】

前記活性薬剤を前記微粒子の懸濁物の流体相に溶解し、そして該流体相のpHを変化させる工程をさらに包含する、請求項1に記載の方法。

【請求項8】

前記pHは、前記活性薬剤の添加の前に変えられる、請求項7に記載の方法。

【請求項 9】

前記 pH は、前記活性薬剤の添加の後に変えられる、請求項 7 に記載の方法。

【請求項 10】

前記活性薬剤改変因子は、前記活性薬剤の構造的安定性または薬力学を改善する、請求項 5 に記載の方法。

【請求項 11】

前記活性薬剤は、タンパク質、ペプチド、ポリペプチド、小分子、または核酸分子である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 12】

前記活性薬剤は、インスリン、グレリン、成長ホルモン、および副甲状腺ホルモン（PTH）からなる群より選択される、請求項 11 に記載の方法。

【請求項 13】

前記活性薬剤は、抗体または抗体フラグメントを含む、請求項 11 に記載の方法。

【請求項 14】

前記小分子は、疎水性分子である、請求項 11 に記載の方法。

【請求項 15】

前記小分子は、シクロスボリン A である、請求項 14 に記載の方法。

【請求項 16】

前記小分子は、イオン化可能な分子である、請求項 11 に記載の方法。

【請求項 17】

前記活性薬剤の化学ポテンシャルを改変する工程は、微粒子表面との 1 つ以上のエネルギー的に好ましい相互作用を調節する工程を包含する、請求項 2 に記載の方法。

【請求項 18】

前記活性薬剤と微粒子との間の 1 つ以上のエネルギー的に好ましい相互作用は、静電相互作用を含む、請求項 17 に記載の方法。

【請求項 19】

前記活性薬剤と微粒子との間の 1 つ以上のエネルギー的に好ましい相互作用は、疎水的相互作用を含む、請求項 17 に記載の方法。

【請求項 20】

前記活性薬剤と微粒子との間の 1 つ以上のエネルギー的に好ましい相互作用は、水素結合相互作用を含む、請求項 17 に記載の方法。

【請求項 21】

前記ジケトピペラジンは、フマリルジケトピペラジンである、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 22】

前記溶媒を除去するための工程をさらに含む、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 23】

活性薬剤と結晶性微粒子とを含む薬物送達組成物を調製するための方法であって、活性薬剤分子を含む活性薬剤溶液を提供する工程；

該活性薬剤の化学ポテンシャルを改変する工程；

微粒子を懸濁物または粉末で提供する工程、ここで、該微粒子はジケトピペラジンを含む；および

該活性薬剤溶液と該微粒子の懸濁物または粉末とを合わせる工程；
を包含する、方法。

【請求項 24】

前記活性薬剤の化学ポテンシャルを改変する工程は、該活性薬剤と微粒子との間の相互作用を可能にする、請求項 23 に記載の方法。

【請求項 25】

前記活性薬剤の化学ポテンシャルを改変する工程は、活性薬剤改変因子を前記溶液に添加する工程を包含する、請求項 23 に記載の方法。

【請求項 26】

前記活性薬剤改変因子は、塩、界面活性剤、イオン、オスモライト、アルコール、カオトロープ、コスモトロープ、酸、塩基、および有機溶媒からなる群より選択される、請求項25に記載の方法。

【請求項27】

前記活性薬剤改変因子は、前記活性薬剤分子の溶解性を減少させる、請求項26に記載の方法。

【請求項28】

前記活性薬剤改変因子は、前記活性薬剤と微粒子との間の会合を促進する、請求項26に記載の方法。

【請求項29】

前記活性薬剤改変因子は、前記活性薬剤分子の構造的安定性を改善する、請求項26に記載の方法。

【請求項30】

前記ジケトピペラジンは、フマリルジケトピペラジンである、請求項23に記載の方法。