

【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】令和4年9月20日(2022.9.20)

【公開番号】特開2022-121532(P2022-121532A)

【公開日】令和4年8月19日(2022.8.19)

【年通号数】公開公報(特許)2022-152

【出願番号】特願2022-101327(P2022-101327)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/337(2006.01)

A 6 1 P 35/00(2006.01)

A 6 1 K 31/454(2006.01)

A 6 1 K 9/16(2006.01)

A 6 1 K 47/26(2006.01)

A 6 1 K 47/38(2006.01)

A 6 1 K 47/32(2006.01)

10

【F I】

A 6 1 K 31/337

A 6 1 P 35/00

A 6 1 K 31/454

A 6 1 K 9/16

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/32

20

【手続補正書】

【提出日】令和4年9月8日(2022.9.8)

【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】

タキサンまたはその薬学的に許容される塩を含む粒子を含み、前記粒子が以下の特徴：

(i) 約  $0.050 \text{ g/cm}^3$  ~ 約  $0.15 \text{ g/cm}^3$  の平均かさ密度および/または

(ii) 少なくとも  $18 \text{ m}^2/\text{g}$ 、 $20 \text{ m}^2/\text{g}$ 、 $25 \text{ m}^2/\text{g}$ 、 $30 \text{ m}^2/\text{g}$ 、 $32 \text{ m}^2/\text{g}$ 、 $34 \text{ m}^2/\text{g}$  もしくは  $35 \text{ m}^2/\text{g}$  の比表面積 (SSA)

のうち的一方または両方を有する、組成物。

【請求項2】

前記タキサンが、パクリタキセル、ドセタキセル、カバジタキセル、タキサジエン、バツカチンIII、タクスキニンA、プレビフォリオールおよびタキススピンDまたはその薬学的に許容される塩からなる群より選択される、請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

前記タキサンが、パクリタキセル、ドセタキセルおよびカバジタキセルまたはその薬学的に許容される塩からなる群より選択される、請求項1に記載の組成物。

【請求項4】

前記タキサンが、パクリタキセルまたはその薬学的に許容される塩であり、前記粒子が、約  $0.050 \text{ g/cm}^3$  ~ 約  $0.12 \text{ g/cm}^3$  または約  $0.060 \text{ g/cm}^3$  ~ 約  $0.11 \text{ g/cm}^3$  の平均かさ密度を有する、請求項3に記載の組成物。

40

50

## 【請求項 5】

前記タキサンが、パクリタキセルまたはその薬学的に許容される塩であり、前記パクリタキセル粒子が、少なくとも  $18 \text{ m}^2/\text{g}$ 、 $20 \text{ m}^2/\text{g}$ 、 $25 \text{ m}^2/\text{g}$ 、 $30 \text{ m}^2/\text{g}$ 、 $32 \text{ m}^2/\text{g}$ 、 $34 \text{ m}^2/\text{g}$  または  $35 \text{ m}^2/\text{g}$  の比表面積 (SSA) を有する、請求項 3 または 4 に記載の組成物。

## 【請求項 6】

前記タキサンが、パクリタキセルまたはその薬学的に許容される塩であり、前記パクリタキセル粒子が、約  $22 \text{ m}^2/\text{g}$  ~ 約  $40 \text{ m}^2/\text{g}$ 、 $25 \text{ m}^2/\text{g}$  ~ 約  $40 \text{ m}^2/\text{g}$ 、 $30 \text{ m}^2/\text{g}$  ~ 約  $40 \text{ m}^2/\text{g}$  または約  $35 \text{ m}^2/\text{g}$  ~ 約  $40 \text{ m}^2/\text{g}$  の SSA を有する、請求項 3 または 4 に記載の組成物。

10

## 【請求項 7】

前記パクリタキセル粒子が、約  $0.060 \text{ g}/\text{cm}^3$  ~ 約  $0.11 \text{ g}/\text{cm}^3$  のかさ密度と約  $22 \text{ m}^2/\text{g}$  ~ 約  $40 \text{ m}^2/\text{g}$  の SSA とを有する、請求項 4 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の組成物。

## 【請求項 8】

前記パクリタキセルの少なくとも 40% (w/w) が、75 RPM で稼働する USP II のパドル法の装置内で 37、pH 7.0 の 50% メタノール / 50% 水 (v/v) 溶液に 30 分以内に溶解する、請求項 4 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の組成物。

## 【請求項 9】

前記タキサンが、ドセタキセルまたはその薬学的に許容される塩であり、前記粒子が、約  $0.050 \text{ g}/\text{cm}^3$  ~ 約  $0.12 \text{ g}/\text{cm}^3$  または約  $0.06 \text{ g}/\text{cm}^3$  ~ 約  $0.1 \text{ g}/\text{cm}^3$  の平均かさ密度を有する、請求項 3 に記載の組成物。

20

## 【請求項 10】

前記タキサンが、ドセタキセルまたはその薬学的に許容される塩であり、前記ドセタキセル粒子が、少なくとも  $18 \text{ m}^2/\text{g}$ 、 $20 \text{ m}^2/\text{g}$ 、 $25 \text{ m}^2/\text{g}$ 、 $30 \text{ m}^2/\text{g}$ 、 $35 \text{ m}^2/\text{g}$ 、 $40 \text{ m}^2/\text{g}$  または  $42 \text{ m}^2/\text{g}$  の SSA を有する、請求項 3 または 9 に記載の組成物。

## 【請求項 11】

前記タキサンが、ドセタキセルまたはその薬学的に許容される塩であり、前記ドセタキセル粒子が、約  $40 \text{ m}^2/\text{g}$  ~ 約  $50 \text{ m}^2/\text{g}$  または約  $43 \text{ m}^2/\text{g}$  ~ 約  $46 \text{ m}^2/\text{g}$  の SSA を有する、請求項 3 または 9 に記載の組成物。

30

## 【請求項 12】

前記ドセタキセル粒子が、約  $0.06 \text{ g}/\text{cm}^3$  ~ 約  $0.1 \text{ g}/\text{cm}^3$  のかさ密度と約  $40 \text{ m}^2/\text{g}$  ~ 約  $50 \text{ m}^2/\text{g}$  の SSA とを有する、請求項 9 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の組成物。

## 【請求項 13】

前記ドセタキセルの少なくとも 20% (w/w) が、75 RPM で稼働する USP II のパドル法の装置内で 37、pH 7.0 の 15% メタノール / 85% 水 (v/v) 溶液に 30 分以内に溶解する、請求項 9 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の組成物。

## 【請求項 14】

少なくとも 95 重量% のパクリタキセルまたはその薬学的に許容される塩を含む粒子を含み、前記粒子が少なくとも  $12 \text{ m}^2/\text{g}$  の比表面積 (SSA) を有する、組成物。

40

## 【請求項 15】

前記パクリタキセル粒子が、少なくとも  $12 \text{ m}^2/\text{g}$ 、 $15 \text{ m}^2/\text{g}$ 、 $20 \text{ m}^2/\text{g}$ 、 $25 \text{ m}^2/\text{g}$ 、 $30 \text{ m}^2/\text{g}$ 、 $32 \text{ m}^2/\text{g}$ 、 $34 \text{ m}^2/\text{g}$  または  $35 \text{ m}^2/\text{g}$  の SSA を有する、請求項 14 に記載の組成物。

## 【請求項 16】

前記パクリタキセルの少なくとも 40% (w/w) が、75 RPM で稼働する USP II のパドル法の装置内で 37、pH 7.0 の 50% メタノール / 50% 水 (v/v) 溶液に 30 分以内に溶解する、請求項 14 ~ 15 のいずれか 1 項に記載の組成物。

50

## 【請求項 17】

少なくとも95重量%のパクリタキセルを含む粒子を含み、前記パクリタキセルの少なくとも40% (w/w) が、75RPMで稼働するUSP I Iのパドル法の装置内で37℃、pH7.0の50%メタノール/50%水 (v/v) 溶液に30分以内に溶解する組成物。

## 【請求項 18】

少なくとも95重量%のドセタキセルを含み、前記ドセタキセルの少なくとも20% (w/w) が、75RPMで稼働するUSP I Iのパドル法の装置内で37℃、pH7.0の15%メタノール/85%水 (v/v) 溶液に30分以内に溶解する組成物。

## 【請求項 19】

前記粒子が、約0.4µm~約1.2µmまたは約0.6µm~約1.0µmの平均粒子径を有する、請求項1~18のいずれか1項に記載の組成物。

10

## 【請求項 20】

前記粒子が、コートされておらず、ポリマー、タンパク質、ポリエトキシ化ヒマシ油ならびにモノグリセリド、ジグリセリドおよびトリグリセリドとポリエチレングリコールのモノエステルおよびジエステルとからなるポリエチレングリコールグリセリドを含まない、請求項1~19のいずれか1項に記載の組成物。

## 【請求項 21】

薬学的に許容される水性担体をさらに含む懸濁液を含む、請求項1~20のいずれか1項に記載の組成物。

20

## 【請求項 22】

ポリソルベート、メチルセルロース、ポリビニルピロリドン、マンニトールおよびヒドロキシプロピルメチルセルロースからなる群より選択される1つまたは複数の成分をさらに含む、請求項1~21のいずれか1項に記載の組成物。

## 【請求項 23】

前記粒子が、前記化合物を少なくとも96%、97%、98%、99%または100%含む、請求項1~22のいずれか1項に記載の組成物。

30

40

50