

【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 3 年 1 月 28 日 (2021.1.28)

【公表番号】特表 2020-514261 (P2020-514261A)

【公表日】令和 2 年 5 月 21 日 (2020.5.21)

【年通号数】公開・登録公報 2020-020

【出願番号】特願 2019-533172 (P2019-533172)

【国際特許分類】

C 0 7 C 67/52 (2006.01)

C 0 7 C 69/157 (2006.01)

C 0 7 C 229/26 (2006.01)

C 0 7 C 67/28 (2006.01)

C 0 7 C 227/42 (2006.01)

C 0 7 C 227/26 (2006.01)

C 0 7 C 229/08 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 C 67/52

C 0 7 C 69/157 C S P

C 0 7 C 229/26

C 0 7 C 67/28

C 0 7 C 227/42

C 0 7 C 227/26

C 0 7 C 229/08

【手続補正書】

【提出日】令和 2 年 12 月 9 日 (2020.12.9)

【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) アセチルサリチル酸のエタノール溶液を準備するステップと、

b) リジンの水溶液を準備するステップと、

c) ステップ a) の溶液とステップ b) の溶液とを合わせて混合物を形成するステップと、

d) 任意選択で前記混合物を攪拌するステップと、

e) 前記混合物にアセトンを追加するステップと、

f) 前記混合物をインキュベートして、アセチルサリチル酸リシネート生成物を形成させるステップと、

g) 前記アセチルサリチル酸リシネート生成物を単離するステップであって、

アセチルサリチル酸を、リジンに比べて過剰に使用し、かつ、

種結晶を前記混合物に添加しないステップと、

h) 再結晶化グリシンを準備するステップであって、グリシンは、以下のステップ、

h 1) 水にグリシンを溶解するステップ、

h 2) アセトンを前記グリシンの溶液に添加するステップ、

h 3) 沈殿物が得られるまで、前記混合物を攪拌するステップ、

により再結晶化がなされる、ステップと、

i) ステップ h) の再結晶化グリシンをステップ g) のアセチルサリチル酸リシネート生成物と合わせて、アセチルサリチル酸リジン・グリシン (LASAG) 粒子を得るステップと、

を備えるアセチルサリチル酸リジン・グリシンの製造方法。

【請求項 2】

ステップ i) で得られる粒子が、 $40\text{ }\mu\text{m}$ 未満の中央粒径を有し、かつ、ステップ i) で得られる粒子の少なくとも 90% が、 $110\text{ }\mu\text{m}$ 未満の粒径を有する、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 3】

少なくとも、方法のステップ c) からステップ f)、および/または、ステップ h) 並びにステップ i) が、室温以下において実行される、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 4】

インキュベーションのステップ f) が、10 以下において実行される、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 5】

ステップ g) における単離が、濾過により実行される、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 6】

ステップ g) における単離が、遠心分離により実行される、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 7】

ステップ a) において準備されるアセチルサリチル酸の溶液が、8 ~ 12% (w/v) のアセチルサリチル酸で構成される、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 8】

ステップ a) において準備されるアセチルサリチル酸の溶液が、9 ~ 10% (w/v) のアセチルサリチル酸で構成される、請求項 7 に記載の方法。

【請求項 9】

ステップ b) において準備されるリジンの水溶液が、30 ~ 35% (w/v) のリジンで構成される、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 10】

ステップ b) において準備されるリジンの水溶液が、溶解したグリシンをさらに含み、かつ前記溶液中の前記グリシンの濃度が 2 ~ 20% (w/v) であってもよい、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 11】

ステップ b) において準備されるリジンの水溶液がリジン-水和物から調整されたものである、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 12】

アセチルサリチル酸とリジンが、1 ~ 0.9 のモル比で、または、1 ~ 0.95 のモル比で使用される、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 13】

ステップ g) 単離された生成物を洗浄するステップ、をさらに備える、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 14】

前記洗浄するステップが、生成物をアセトンで洗浄することを含む、請求項 13 に記載の方法。

【請求項 15】

無菌条件下で実行される、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 16】

非無菌条件下で実行され、かつ、さらなるステップ、j) 照射により生成物を滅菌すること、を備える、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 17】

請求項 1 に記載の方法により得ることのできる、100 μ m 未満の中央粒径を有するアセチルサリチル酸リジン・グリシン。

【請求項 18】

80 μ m 未満の中央粒径を有する、請求項 17 に記載のアセチルサリチル酸リジン・グリシン。

【請求項 19】

50 μ m 未満の中央粒径を有する、請求項 17 に記載のアセチルサリチル酸リジン・グリシン。