

【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11月17日(2016.11.17)

【公表番号】特表2015-533164(P2015-533164A)

【公表日】平成27年11月19日(2015.11.19)

【年通号数】公開・登録公報2015-072

【出願番号】特願2015-536854(P2015-536854)

【国際特許分類】

A 6 1 K 9/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 31/192 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 9/14

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 31/192

【手続補正書】

【提出日】平成28年9月29日(2016.9.29)

【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】

活性医薬成分と、100nm以下のメジアン粒径を有するナノ粒子材料の少なくとも部分的なコーティングとを含むコア粒子から味マスクされた微粒子医薬製剤を調製する方法であって、

1) 前記コア粒子を流動層中で第1のポリマー層でコーティングする工程と、

2) 100nm以下のメジアン粒径を有するナノ粒子材料の存在下で、前記コア粒子の前記第1のポリマー層を流動層中で水不溶性の第2のポリマー層でコーティングする工程と

を有し、前記第1のポリマー層は、少なくとも部分的に水溶性である、方法。

【請求項2】

請求項1記載の方法において、前記コア粒子を前記第1のポリマー層でコーティングする工程は、前記微粒子医薬製剤のポリマー負荷が2重量%～15重量%となるのに十分な量のポリマー溶液を噴霧する工程を含むものである方法。

【請求項3】

請求項2記載の方法において、前記第1のポリマー層を第2のポリマー層でコーティングする工程は、前記微粒子医薬製剤のポリマー負荷が2重量%～20重量%となるのに十分な量の第2のポリマー溶液を噴霧する工程を含むものである方法。

【請求項4】

請求項1記載の方法において、前記第1のポリマー層は水溶性ポリマーを含むものである方法。

【請求項5】

請求項1記載の方法において、前記第1のポリマー層は、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアルコー

ル、アンモニオメタクリレートコポリマー、エチルセルロース、およびこれらの組み合せから成る群から選択されるポリマーを含むものである方法。

【請求項 6】

請求項 1 記載の方法において、前記コア粒子を前記第 1 のポリマー層でコーティングする工程は、 $100\text{ nm} \sim 500\text{ nm}$ の範囲のメジアン粒径を有するナノ粒子材料の存在下で行われるものである方法。

【請求項 7】

請求項 6 記載の方法において、前記噴霧されたポリマー溶液のメジアン液滴径は、 $5\text{ }\mu\text{m} \sim 15\text{ }\mu\text{m}$ の範囲のメジアン液滴径から独立して選択されるものである方法。

【請求項 8】

請求項 6 記載の方法であって、さらに、前記第 2 のポリマー層をナノ粒子材料の少なくとも部分的なコーティングでコーティングする工程を有する方法。

【請求項 9】

請求項 1 記載の方法において、前記第 2 のポリマー層は、アンモニオメタクリレートコポリマー、エチルセルロース、酢酸セルロース、およびこれらの組み合せから成る群から選択される水不溶性ポリマーを含むものである方法。

【請求項 10】

請求項 1 記載の方法において、前記第 1 および第 2 のポリマー溶液の噴霧速度は、 $0.5\text{ ml / 分} \sim 5\text{ ml / 分}$ の範囲の噴霧速度から独立して選択されるものである方法。

【請求項 11】

請求項 10 記載の方法において、前記第 1 のポリマー溶液および前記第 2 のポリマー溶液の流動化流量は、 $0.1\text{ cm}^3\text{ / s} \sim 5\text{ cm}^3\text{ / s}$ の範囲の流動化流量から独立して選択されるものである方法。

【請求項 12】

請求項 10 記載の方法において、前記第 1 のポリマー溶液および前記第 2 のポリマー溶液は、それぞれ $5\text{ psig} \sim 35\text{ psig}$ の範囲内から独立して選択される噴霧圧で噴霧されるものである方法。

【請求項 13】

請求項 1 記載の方法において、 $1\text{ cm / 秒} \sim 10\text{ cm / 秒}$ の範囲の流動化速度は、前記第 1 および第 2 のポリマー溶液でコーティングする工程の間、維持されるものである方法。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0008

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0008】

先行技術の方法における重要な課題は、伝統的な流動層コーティング法における API 粒子の凝集であり、通常 $100\text{ }\mu\text{m}$ よりもはるかに大きい粒径をもたらし、これらの投薬を不快なものにする好ましくないザラザラした食感に繋がる。本発明は、薬物粒子の凝集を最小限にした流動層コーティングにより、味マスクされた API 粉末を製造する方法を提供する。本発明の方法はまた、API's が比較的高い力価を有することが可能となるように、低いポリマー負荷を必要とする。

この出願の発明に関連する先行技術文献情報としては、以下のものがある（国際出願日以降国際段階で引用された文献及び他国に国内移行した際に引用された文献を含む）。

（先行技術文献）

（特許文献）

（特許文献 1）米国特許出願公開第 2002/098227 号明細書

（特許文献 2）欧州特許出願公開第 2201939 号明細書

（特許文献 3）米国特許出願公開第 2011/0003006 号明細書

(特許文献4) 米国特許出願公開第2004/0137156号明細書

(特許文献5) 米国特許出願公開第2008/0179433号明細書

(特許文献6) 米国特許出願公開第2009/0269411号明細書

(特許文献7) 米国特許第6,740,341号明細書

(特許文献8) 米国特許第6,475,523号明細書

(特許文献9) 米国特許第6,740,341号明細書

(特許文献10) 米国特許第7,276,249号明細書

(特許文献11) 米国特許第8,252,370号明細書

(特許文献12) 米国特許第5,552,152号明細書

(非特許文献)

(非特許文献1) International Search Report and Written Opinion; Mailed 2014-01-03 for the corresponding PCT Application No. PCT/US2013/064064

(非特許文献2) Yang J, et al., "Dry Particle Coating for Improving the Flowability of Cohesive Powders". Powder Technology, V. 158, 2005, pgs. 21-22.

(非特許文献3) Chen Y, et al., "Fluidization of Coated Group C Powders"; AlCHE Journal, V. 54, 2008, pgs. 104-121.

(非特許文献4) Chen Y, et al., "Fluidized Bed Film Coating of Cohesive Geldart Group C Powders" Powder Technology. v189 (2009) pgs. 466-480.

(非特許文献5) Han, X. et al., "Simultaneous Micronization and Surface Modification for Improvement of Flow and Dissolution of Drug Particles" International Journal of Pharmaceutics, "2011. 415 (1-2) : p. 185-195.

(非特許文献6) Pfeffer, R. et al., "Synthesis of Engineered Particulates With Tailored Properties Using Dry Particle Coating," Powder Technology, Vol. 117, pp. 40-67, 2001.

(非特許文献7) Yang, J. et al., "Dry Particle Coating for Improving the Flowability of Cohesive Powders." Powder Technology, 158, 2005, 21-33.