

【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5年8月10日(2023.8.10)

【公開番号】特開2021-46392(P2021-46392A)

【公開日】令和3年3月25日(2021.3.25)

【年通号数】公開・登録公報2021-015

【出願番号】特願2020-153558(P2020-153558)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00(2006.01)

10

A 6 1 K 9/14(2006.01)

A 6 1 K 9/10(2006.01)

A 6 1 K 47/38(2006.01)

A 6 1 K 31/353(2006.01)

A 6 1 P 39/06(2006.01)

A 6 1 P 35/00(2006.01)

A 6 1 P 31/04(2006.01)

A 6 1 P 31/12(2006.01)

A 6 1 P 29/00(2006.01)

A 6 1 P 37/08(2006.01)

20

A 6 1 K 31/7052(2006.01)

【F I】

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 9/14

A 6 1 K 9/10

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 31/353

A 6 1 P 39/06

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 37/08

A 6 1 K 31/7052

30

【手続補正書】

【提出日】令和5年8月2日(2023.8.2)

【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

40

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

医薬組成物を調製する方法であって、

医薬化合物を少なくとも部分的に可溶化できる、有機溶媒を含む溶媒中に、25 で 1
mg/ml以下の水への溶解度を有する前記医薬化合物を用意すること、

ナノ構造化セルロースの水性分散液を用意すること、及び

貧溶媒再結晶プロセスで、前記溶媒中の前記医薬化合物を、貧溶媒として作用するナノ構
造化セルロースの前記水性分散液に添加して、前記医薬化合物の過飽和濃度を得ること、

50

前記医薬化合物が前記過飽和濃度で核を形成し、次いで核形成によりナノ粒子に成長し続けることにより、50 nm以下の平均径を有するナノサイズ医薬粒子を用意すること、
 を含み、

前記医薬組成物が、92～99.95% (w/w)の水を含む、方法。

【請求項2】

前記ナノ構造化セルロースが、200 nm以下の平均フィブリル径を有するナノフィブリル状セルロースを含む、請求項1に記載の方法。

【請求項3】

前記ナノフィブリル状セルロースが、水に分散されると、 22 ± 1 の水性媒体中、0.5% (w/w)の濃度で回転レオメーターによって決定される、ゼロせん断粘度が5000～50000 Pa・sであり、降伏応力が3～15 Paである、請求項2に記載の方法。

10

【請求項4】

前記ナノ構造化セルロースがナノ結晶セルロースを含む、請求項1に記載の方法。

【請求項5】

前記ナノ結晶セルロースが、2～20 nmの平均フィブリル径及び100～400 nmの平均フィブリル長を有する、請求項4に記載の方法。

【請求項6】

前記医薬組成物における前記ナノ構造化セルロースの含有量が0.05～8% (w/w)である、請求項1～請求項5のいずれか一項に記載の方法。

20

【請求項7】

前記医薬組成物における前記ナノ構造化セルロースの含有量が0.05～0.5% (w/w)であるか、又は1～8% (w/w)である、請求項6に記載の方法。

【請求項8】

前記医薬化合物が、25 で0.6 mg/ml以下の水への溶解度、及び/又は低いバイオアベイラビリティを有する、請求項1～請求項7のいずれか一項に記載の方法。

【請求項9】

前記医薬化合物の含有量が、前記医薬組成物100 μl当たり0.05～1 mgである、請求項1～請求項8のいずれか一項に記載の方法。

【請求項10】

前記溶媒がエタノールを含む、請求項1～請求項9のいずれか一項に記載の方法。

30

【請求項11】

得られた医薬組成物を凍結乾燥することを含む、請求項1～請求項10のいずれか一項に記載の方法。

【請求項12】

請求項1～請求項11のいずれか一項に記載の方法で医薬組成物を調製することを含む、1 mg/ml以下の水への低い溶解度を有する前記医薬化合物を安定化させる方法。

【請求項13】

ナノ構造化セルロースマトリックス中、25 で1 mg/ml以下の水への溶解度を有する医薬化合物のナノサイズ医薬粒子を含み、前記ナノサイズ医薬粒子は、50 nm以下の平均径を有し、

40

92～99.95% (w/w)の水を含む、

請求項1～請求項11のいずれか一項に記載の方法により得られる、医薬組成物。

【請求項14】

前記ナノ構造化セルロースが、200 nm以下の平均フィブリル径を有するナノフィブリル状セルロースを含む、請求項13に記載の医薬組成物。

【請求項15】

前記ナノフィブリル状セルロースが、水に分散されると、 22 ± 1 の水性媒体中、0.5% (w/w)の濃度で回転レオメーターによって決定される、ゼロせん断粘度が5000～50000 Pa・sであり、降伏応力(せん断減粘が始まるせん断応力)が3～

50

15 Paである、請求項14に記載の医薬組成物。

【請求項16】

前記ナノ構造化セルロースがナノ結晶セルロースを含む、請求項13に記載の医薬組成物。

【請求項17】

前記ナノ結晶セルロースが、2～20nmの平均フィブリル径及び100～400nmの平均フィブリル長を有する、請求項16に記載の医薬組成物。

【請求項18】

前記医薬組成物における前記ナノ構造化セルロースの含有量が0.05～8% (w/w)である、請求項13～請求項17のいずれか一項に記載の医薬組成物。

10

【請求項19】

前記医薬組成物における前記ナノ構造化セルロースの含有量が0.05～0.5% (w/w)であるか、又は1～8% (w/w)である、請求項18に記載の医薬組成物。

【請求項20】

前記医薬化合物が、25℃で0.6mg/ml以下の水への溶解度、及び/又は低いバイオアベイラビリティを有する、請求項13～請求項19のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項21】

前記医薬化合物の含有量が、医薬組成物100μl当たり0.05～1mgである、請求項13～請求項20のいずれか一項に記載の医薬組成物。

20

【請求項22】

前記医薬化合物の前記ナノ構造化セルロースマトリックスからの溶解率が、10分で50%以上である、請求項13～請求項21のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項23】

25℃で1mg/ml以下の水への溶解度を有する医薬化合物のバイオアベイラビリティを増強するための医薬として使用するための請求項13～請求項22のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項24】

請求項1～請求項11のいずれか一項に記載の方法で、25℃で1mg/ml以下の水への溶解度を有する医薬化合物を安定化させるための、ナノ構造化セルロースの使用。

30

40

50