

【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6部門第1区分
 【発行日】平成28年6月2日(2016.6.2)

【公表番号】特表2015-524913(P2015-524913A)
 【公表日】平成27年8月27日(2015.8.27)
 【年通号数】公開・登録公報2015-054
 【出願番号】特願2015-502383(P2015-502383)
 【国際特許分類】

G 0 1 N 33/15 (2006.01)

G 0 1 N 33/50 (2006.01)

【F I】

G 0 1 N 33/15 A

G 0 1 N 33/15 Z

G 0 1 N 33/50 Z

【手続補正書】

【提出日】平成28年4月4日(2016.4.4)

【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】

25 mN/m ~ 50 mN/mの表面張力を有する絶食状態生体関連媒体を調製するため、および哺乳類種の絶食状態の胃液及び絶食状態の上部小腸液を模擬するための、固定状態または水性濃縮が適切である均質な組成物であって、

前記均質な組成物は以下の界面活性剤：

(i) 少なくとも1つの胆汁塩；

(ii) 以下から選択された少なくとも1つのリン脂質；

・ 60重量% ~ 99重量%のホスファチジルコリン(PC)を含むリン脂質組成物；

・ 50重量% ~ 90重量%のモノアシルPCを含む、部分的に酵素分解されたジアシルリン脂質を含むリン脂質組成物；

・ PCと、前記部分的に酵素分解された、モノアシルPCのレベルは5重量% ~ 80重量%であるジアシルリン脂質との混合物を含むリン脂質組成物；

(iii) 少なくとも1つの脂肪酸又は前記脂肪酸の1価塩；および

(iv) コレステロール

を含む、均質な組成物。

【請求項2】

前記少なくとも1つのリン脂質組成物(ii)は以下：

・ 50% ~ 90%重量のモノアシルPCを含む部分的に酵素分解されたリン脂質組成物；

・ 部分的に酵素分解された、モノアシルPCのレベルは5重量% ~ 80重量%であるジアシルリン脂質との混合物を含むリン脂質組成物；

から選択される請求項1に記載の均質な組成物。

【請求項3】

(a) 前記界面活性剤の40モル% ~ 95モル%は、前記少なくとも1つの胆汁塩(i)からなること、並びに

前記界面活性剤の残りのモル%(即ち60モル% ~ 5モル%)は、前記少なくとも1つ

のリン脂質 (ii)、前記少なくとも1つの脂肪酸又は前記脂肪酸の1価塩 (iii) およびコレステロール (iv) ; および/または

(b) 2つの胆汁塩を含む前記界面活性剤からなることを特徴とする、請求項1または2に記載の均質な組成物。

【請求項4】

(a) 前記またはそれぞれの胆汁塩はコール酸ナトリウム、タウロコール酸ナトリウム、グリココール酸ナトリウム、デオキシコール酸ナトリウム、タウロデオキシコール酸ナトリウム、グリコデオキシコール酸ナトリウム、ウルソデオキシコール酸ナトリウム、ケノデオキシコール酸ナトリウム、タウロケノデオキシコール酸ナトリウム、グリコケノデオキシコール酸ナトリウム、コリルサルコシン酸ナトリウム、N-メチルタウロコール酸ナトリウム及びこれらの遊離酸からなる群から選択され; および/または

(b) 前記またはそれぞれの脂肪酸は、14~22個の炭素原子を有する脂肪酸であること; および/または

(c) 前記界面活性剤は0.001モル%~10モル%のコレステロールを含むことを特徴とする、請求項1~3のいずれか1項に記載の均質な組成物。

【請求項5】

(a) - 平均粒径10 μ m~1000 μ m、充填密度0.3g/cm³~0.7g/cm³、含水率5重量%未満の粉末;

- 粒径が200 μ m~2000 μ mの顆粒若しくはペレット;

- 錠剤; および

- カプセル;

から選択される固体形態、または

(b) 水性媒体中に分散した10重量%~60重量%の界面活性剤を含む水性濃縮物を含む液体組成物の形態、

であることを特徴とする請求項1~4のいずれか1項に記載の均質な組成物。

【請求項6】

哺乳類種の絶食状態胃液及び絶食状態上部小腸液を模擬するための、水性生体関連媒体であって、前記水性生体関連媒体は25mN/m~50mN/mの表面張力を有し、そして:

(i) 少なくとも1つの胆汁塩;

(ii) 少なくとも1つの:

・60重量%~99重量%のホスファチジルコリン(PC)を含むリン脂質組成物;

・50重量%~90重量%のモノアシルPCを含む、部分的に酵素分解されたジアシルリン脂質を含むリン脂質組成物;

・PCと、前記部分的に酵素分解された、モノアシルPCのレベルは5重量%~80重量%であるジアシルリン脂質との混合物;

から選択される少なくとも1つのリン脂質組成物;

(iii) 少なくとも1つの脂肪酸又は前記脂肪酸の1価塩; および

(iv) コレステロール

を含むことを特徴とする水性生体関連媒体。

【請求項7】

少なくとも1つのリン脂質組成物(ii)は:

・50%~90%重量のモノアシルPCを含む部分的に酵素分解されたリン脂質組成物;

・PCと、前記部分的に酵素分解された、モノアシルPCのレベルは5重量%~80重量%であるジアシルリン脂質との混合物を含むリン脂質組成物;

から選択される請求項6に記載の水性生体関連媒体。

【請求項8】

(a) 前記表面張力は、35mN/m~45mN/mであり、

(b) 前記界面活性剤の40モル%~95モル%は、前記少なくとも1つの胆汁塩(i

) からなり、前記界面活性剤の残りのモル% (即ち60モル% ~ 5モル%) は、前記少なくとも1つのリン脂質(ii)、前記少なくとも1つの脂肪酸又は前記脂肪酸の1価塩(iii) およびコレステロール(iv) からなり; および/または

(c) 界面活性剤は2つの胆汁塩を含む、
ことを特徴とする請求項6または7に記載の水性生体関連媒体。

【請求項9】

(a) 前記またはそれぞれの胆汁塩は、コール酸ナトリウム、タウロコール酸ナトリウム、グリココール酸ナトリウム、デオキシコール酸ナトリウム、タウロデオキシコール酸ナトリウム、グリコデオキシコール酸ナトリウム、ウルソデオキシコール酸ナトリウム、ケノデオキシコール酸ナトリウム、タウロケノデオキシコール酸ナトリウム、グリコケノデオキシコール酸ナトリウム、コリルサルコシン酸ナトリウム、N-メチルタウロコール酸ナトリウム及びこれらの遊離酸からなる群から選択され; および/または、

(b) 前記またはそれぞれの脂肪酸は、14炭素原子~22炭素脂肪酸であり; および/または、

(c) 前記界面活性剤は0.001モル% ~ 10モル%のコレステロールを含む、
ことを特徴とする請求項6~8のいずれか1項に記載の水性生体関連媒体。

【請求項10】

緩衝剤、浸透圧関連成分、安定剤、抗酸化剤、pH調整剤、殺菌剤および酵素から選択される成分を更に含む、請求項6~9のいずれか1項に記載の水性生体関連媒体。

【請求項11】

請求項1~5のいずれか1項に記載の均一な組成物を、所定の量だけ水又は水性媒体に添加することによって、請求項6~8のいずれか1項に記載の水性生体関連媒体を調整する方法。

【請求項12】

均一な生体関連組成物を調製するための方法であって、請求項1に記載および、

(a) 固体形態、前記方法は、

溶媒、水又はこれらの混合物に界面活性剤を溶解させること、及び

前記溶媒、水又はこれらの混合物を除去し、それによって含水率が5重量%未満の固体組成物をもたらす; または、

(b) 10重量% ~ 60重量%の界面活性剤は、水を除去するための乾燥ステップなしで15 ~ 60の水性媒体中に溶解又は分散する水性濃縮物;

のいずれかである方法。

【請求項13】

水性媒体で、共に又は順次、界面活性剤を個別に計量および溶解することを含む、請求項6~10のいずれか1項に記載の水性生体関連媒体を調製するための方法。

【請求項14】

PCとの酵素分解されたジアシルリン脂質の逆混合による50重量% ~ 90重量%のモノアシルPCを含む、部分的に酵素分解されたジアシルリン脂質を調整するための最初のステップを更に含むことを特徴とする請求項11~13のいずれか1項に記載の方法。

【請求項15】

溶解性試験、溶出試験、生物学的同等性評価、薬剤放出評価、IVIVC、インシリコモデリング及びシミュレーション、薬剤の過飽和、薬剤の沈殿、薬剤の安定性、亢進された処方性能の評価または薬剤浸透性研究のための請求項6~10のいずれか1項に記載の水性絶食状態生体関連媒体の使用。