

【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21年5月28日(2009.5.28)

【公表番号】特表2008-542402(P2008-542402A)

【公表日】平成20年11月27日(2008.11.27)

【年通号数】公開・登録公報2008-047

【出願番号】特願2008-514997(P2008-514997)

【国際特許分類】

A 61 K 9/48 (2006.01)

A 61 K 47/04 (2006.01)

A 61 K 47/44 (2006.01)

A 61 K 47/18 (2006.01)

【F I】

A 61 K 9/48

A 61 K 47/04

A 61 K 47/44

A 61 K 47/18

【手続補正書】

【提出日】平成21年4月9日(2009.4.9)

【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】

活性物質用の乾燥製剤の製造方法であって、

(i) 不連続相の液滴を含む二相液系を形成するために活性物質を含む不連続相を連続相中に分散させるステップであり、前記液滴がそれぞれその表面に相界面を有するステップと、

(ii) 前記二相液系に供給したナノ粒子を前記相界面に凝集させることにより、前記液滴表面を前記ナノ粒子の少なくとも1つの層で被覆し、前記少なくとも1つのナノ粒子層が、その後の前記連続相の除去を可能にするのに十分な構造完全性を前記液滴にもたらすステップと、

(iii) 前記ナノ粒子被覆液滴から前記連続相を除去し、乾燥製剤を製造するステップと、

を含む製造方法。

【請求項2】

活性物質用の乾燥製剤の製造方法であって、

(i) 不連続相の液滴を含む二相液系を形成するために活性物質を含む不連続相を連続相中に分散させるステップであり、前記液滴がそれぞれその表面に相界面を有するステップと、

(ii) 前記連続相を除去し、乾燥製剤を製造するステップであり、その間に、前記二相液系に供給したナノ粒子を前記相界面に凝集させることにより、前記液滴表面を前記ナノ粒子の少なくとも1つの層で被覆し、前記少なくとも1つのナノ粒子層が前記連続相の除去に耐え得る十分な構造完全性を前記液滴にもたらすステップと、

を含む製造方法。

【請求項3】

不連続相が油性媒体又は脂質媒体であり、連続相が水性である、請求項 1 又は 2 に記載の方法。

【請求項 4】

不連続相が水性であり、各液滴が単独又は多重の脂質二重層によって囲まれており、連続相もまた水性である、請求項 1 又は 2 に記載の方法。

【請求項 5】

不連続相及び連続相のどちらか、又は両方が、ナノ粒子が凝集する前に、乳濁液を安定化させる乳化剤を含む、請求項 3 又は 4 に記載の方法。

【請求項 6】

乳化剤がレシチン又はオレイルアミンである、請求項 5 に記載の方法。

【請求項 7】

活性物質が、親油性薬剤化合物から選択され、不連続相が油性媒体又は脂質媒体である、請求項 1 ~ 6 のいずれかに記載の方法。

【請求項 8】

ステップ (i) の二相液系が形成される前に、ナノ粒子を不連続相に分散させることによって前記ナノ粒子を供給する、請求項 3、及び 5 ~ 7 のいずれかに記載の方法。

【請求項 9】

ステップ (i) の二相液系が形成される前に、不連続相及び連続相の両方にナノ粒子を分散させることによって前記ナノ粒子を供給する、請求項 3、及び 5 ~ 7 のいずれかに記載の方法。

【請求項 10】

ナノ粒子が親水性表面を有する、請求項 1 ~ 9 のいずれかに記載の方法。

【請求項 11】

親水性表面を有するナノ粒子が、シリカナノ粒子である、請求項 10 に記載の方法。

【請求項 12】

ナノ粒子が 20 ~ 80 nm の範囲内の平均直径を有する、請求項 1 ~ 11 のいずれかに記載の方法。

【請求項 13】

ナノ粒子のサイズが、ナノ粒子サイズと前記ナノ粒子被覆液滴のサイズとの比が約 1 : 10 となるサイズである、請求項 1 ~ 12 のいずれかに記載の方法。

【請求項 14】

ステップ (ii) が、 $0.5 \times 10^{-4} \sim 1 \times 10^{-1}$ M の NaCl が存在する状態で実施される、請求項 1 ~ 13 のいずれかに記載の方法。

【請求項 15】

ステップ (iii) が噴霧乾燥によって実施される、請求項 1 ~ 14 のいずれかに記載の方法。

【請求項 16】

活性物質用の乾燥製剤の製造方法であって、

(i) 油性媒体の液滴を含む二相液系を形成するために活性物質を含む油性媒体を水性相中に分散させるステップであり、前記液滴がそれぞれその表面に相界面を有するステップと、

(ii) 前記二相液系に供給したナノ粒子を前記相界面に凝集させることにより、前記液滴表面を前記ナノ粒子の少なくとも 1 つの層で被覆するステップであり、前記少なくとも 1 つのナノ粒子層が、その後の前記連続相の除去を可能にするのに十分な構造完全性を前記液滴にもたらし、前記ナノ粒子の平均直径が 20 ~ 80 nm の範囲内であり、不連続相とナノ粒子との質量比が少なくとも 1 : 0.05 で前記ナノ粒子を供給するステップと、

(iii) ナノ粒子被覆液滴から前記連続相を除去し、乾燥製剤を製造するステップと、を含む製造方法。

【請求項 17】

不連続相及び連続相のどちらか、又は両方が、ナノ粒子が凝集する前に、乳濁液を安定

化させる乳化剤を含む、請求項16に記載の方法。

【請求項18】

乳化剤がレシチン又はオレイルアミンである、請求項17に記載の方法。

【請求項19】

活性物質が、親油性薬剤化合物から選択される、請求項16～18のいずれかに記載の方法。

【請求項20】

ステップ(i)の二相液系が形成される前に、ナノ粒子を不連続相に分散させることによって前記ナノ粒子を供給する、請求項16～19のいずれかに記載の方法。

【請求項21】

ステップ(i)の二相液系が形成される前に、不連続相及び連続相の両方にナノ粒子を分散させることによって前記ナノ粒子を供給する、請求項16～19のいずれかに記載の方法。

【請求項22】

ナノ粒子が親水性表面を有する、請求項16～21のいずれかに記載の方法。

【請求項23】

親水性表面を有するナノ粒子が、シリカナノ粒子である、請求項22に記載の方法。

【請求項24】

ナノ粒子のサイズが、ナノ粒子サイズとナノ粒子被覆液滴のサイズとの比が約1:10となるサイズである、請求項16～23のいずれかに記載の方法。

【請求項25】

ステップ(ii)が、 $0.5 \times 10^{-4} \sim 1 \times 10^{-1}$ MのNaClが存在する状態で実施される、請求項16～24のいずれかに記載の方法。

【請求項26】

ステップ(ii)が約 1×10^{-4} のNaClが存在する状態で実施される、請求項25に記載の方法。

【請求項27】

ステップ(iii)が噴霧乾燥によって実施される、請求項16～26のいずれかに記載の方法。

【請求項28】

請求項1～27のいずれかに従って製造された乾燥製剤。