

【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2部門第1区分

【発行日】平成23年3月24日(2011.3.24)

【公表番号】特表2010-517759(P2010-517759A)

【公表日】平成22年5月27日(2010.5.27)

【年通号数】公開・登録公報2010-021

【出願番号】特願2009-549040(P2009-549040)

【国際特許分類】

B 01 J 13/00 (2006.01)

B 01 F 17/00 (2006.01)

A 61 K 9/10 (2006.01)

A 61 K 47/20 (2006.01)

【F I】

B 01 J 13/00 A

B 01 F 17/00

A 61 K 9/10

A 61 K 47/20

【手続補正書】

【提出日】平成23年2月1日(2011.2.1)

【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】

水性媒体中における固体非晶質サブミクロン粒子の安定な分散体を製造する方法であつて、次の工程を含む、方法：

1)

a) 水性連続相を提供する水性媒体；

油性相を提供し、水性媒体に分散している粒子間の物質の流れにより粒子成長を阻害する阻害剤；

ドクサートナトリウム；

を含むエマルジョンと

b) 非晶質および／または結晶状態で存在する実質的に水不溶性の物質(ここで、実質的に水不溶性物質対阻害剤の比率は10：1(w/w)より小さい)；および

c) 所望によりエマルジョン滴および／または該粒子の凝集を阻止する第二の安定化剤を合わせ、

2) 結晶状態の実質的に水不溶性の物質が存在するならば、混合物の温度を実質的に水不溶性の物質の融解温度付近まで上げ、そして

3) 実質的に水不溶性の物質を該油性層に移動させ、工程2)で温度を上昇させていたならば温度を低下させ、それにより該非晶質粒子の安定な分散体を提供する。

【請求項2】

該水性媒体に分散している粒子の成長が、製造後環境温度で1時間にわたり、平均粒子径の10%の未満である、請求項1に記載の方法。

【請求項3】

実質的に水不溶性の物質をその結晶状態で添加する、請求項1または2に記載の方法。

【請求項4】

実質的に水不溶性の物質をその非晶質状態で添加する、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 5】

実質的に水不溶性の物質が実質的に水不溶性の薬理学的活性化合物である、請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の方法。

【請求項 6】

水不溶性物質の融点が 225 以下である、請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の方法。

【請求項 7】

水性媒体が水から成る、請求項 1 ~ 6 のいずれかに記載の方法。

【請求項 8】

阻害剤が実質的に水不溶性の物質と十分に混和性であり、実質的に単相混合物の本物質と本阻害剤を含む固体粒子を分散体中に形成する、請求項 1 ~ 7 のいずれかに記載の方法。

【請求項 9】

水不溶性物質および阻害剤の比が重量で 2 : 1 w / w である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 10】

工程 1 a) におけるエマルジョンがさらに共阻害剤を含む、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 11】

分散体から固体粒子を単離する工程をさらに含む、請求項 1 ~ 10 のいずれかに記載の方法。

【請求項 12】

ドクサートナトリウムまたは 1 種以上の付加的安定化剤、またはその混合物を懸濁液に添加する、請求項 1 ~ 11 のいずれかに記載の方法。

【請求項 13】

請求項 1 ~ 12 のいずれかに記載の方法により得られる、非晶質サブミクロン粒子の分散体。

【請求項 14】

医薬として使用するための、請求項 1 3 に記載の分散体。

【請求項 15】

請求項 1 4 に記載の分散体を薬学的に許容される担体または希釈剤と共に含む、医薬組成物。

【請求項 16】

請求項 1 5 に記載の医薬組成物を投与することによる、患者における疾患の処置方法。