

【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 17 年 12 月 22 日 (2005.12.22)

【公表番号】特表 2004-527505 (P2004-527505A)

【公表日】平成 16 年 9 月 9 日 (2004.9.9)

【年通号数】公開・登録公報 2004-035

【出願番号】特願 2002-571029 (P2002-571029)

【国際特許分類第 7 版】

A 6 1 K 9/14

A 6 1 K 9/19

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 1/04

【F I】

A 6 1 K 9/14

A 6 1 K 9/19

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 1/04

【手続補正書】

【提出日】平成 17 年 2 月 17 日 (2005.2.17)

【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】

高い固体含量を有し、

(i) 酸不安定性の H^+ , K^+ - A T P アーゼ阻害剤、それらのアルカリ性塩、もしくはその単一な光学異性体の一つ、またはそれらのアルカリ性塩、

(ii) 水溶性または水不溶性ポリマーからなる群より選択されるポリマー（該ポリマーは、乾燥含量を基準にして少なくとも 5 重量%である）、および、

(iii) 液体（該液体中、ポリマーは可溶性または分散性である）

を含む液状媒体を液滴状に噴霧すること、

形成された液滴を冷媒体中で凍結すること；および

液滴から凍結液体 / 蒸気を昇華させ、乾燥した均一な微粒子であって、該微粒子の乾燥含量を基準として少なくとも 80 重量%が、酸不安定性の H^+ , K^+ - A T P アーゼ阻害剤、そのアルカリ性塩、またはその単一な光学異性体の一つ、もしくはそのアルカリ性塩である微粒子を得ること

を含む、酸不安定性の H^+ , K^+ - A T P アーゼ阻害剤を含む均一な微粒子の製造方法。

【請求項 2】

液状媒体の固体含量が 15 ~ 70 重量%である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 3】

液状媒体の固体含量が 15 ~ 60 重量%である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 4】

液状媒体が懸濁液である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 5】

液状媒体が溶液である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 6】

液状媒体が乳濁液である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 7】

酸不安定性の H^+ 、 K^+ - A T P アーゼ阻害剤が、乾燥微粒子の重量を基準にして 80 ~ 95 重量 % 含まれる、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 8】

液状媒体の固体含量が 15 ~ 70 重量 % であり、酸不安定性の H^+ 、 K^+ - A T P アーゼ阻害剤が、微粒子の乾燥重量を基準にして 80 ~ 95 重量 % である、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 9】

ポリマーが、セルロース誘導体、多糖類、天然ポリマー、合成ポリマー、界面活性剤およびそれらの混合物からなる群より選択される、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 10】

ポリマーが可溶化または分散された液体は、水、第三ブチルアルコール、シクロヘキサン、塩化メチレン、メタノール、エタノールおよびそれらの混合物からなる群より選択される、請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 11】

冷媒体が、液体窒素、液体アルゴン、液体酸素、または、懸濁液中の液体の凝固点より十分に低温の冷却溶媒からなる群より選択される、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 12】

昇華は凍結乾燥により行われる、請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 13】

微粒子が、50 ~ 500 μm の範囲の粒度分布を有する、請求項 1 ~ 12 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 14】

微粒子が、100 ~ 500 μm の範囲の粒度分布を有する、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 15】

酸不安定性の H^+ 、 K^+ - A T P アーゼ阻害剤が、オメブラゾール、そのアルカリ性塩、エソメブラゾール、またはそのアルカリ性塩からなる群より選択される、請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 16】

請求項 1 ~ 15 のいずれか一項に記載の方法に従って製造された微粒子。

【請求項 17】

さらに腸溶コーティングを含む、請求項 16 に記載の微粒子。

【請求項 18】

(i) 微粒子の乾燥含量を基準にして少なくとも 80 重量 % の酸不安定性の H^+ 、 K^+ - A T P アーゼ阻害剤、そのアルカリ性塩、またはその単一な光学異性体の一つ、もしくはそのアルカリ性塩、および、

(ii) 乾燥含量を基準にして少なくとも 5 重量 % のポリマー（該ポリマーは水溶性または水不溶性ポリマーである）

を含む、酸不安定性の H^+ 、 K^+ - A T P アーゼ阻害剤を含む均一な微粒子。

【請求項 19】

請求項 16 に記載の微粒子が、少なくとも 40 % の多孔度を有する、請求項 18 に記載の微粒子。

【請求項 20】

微粒子が、50～500 μmの範囲の粒度分布を有する、請求項 18 に記載の微粒子。

【請求項 21】

腸溶コーティングをさらに含む、請求項 18 に記載の微粒子。

【請求項 22】

酸不安定性の H^+ ， K^+ -ATPアーゼ阻害剤は、オメプラゾール、そのアルカリ性塩、エソメプラゾールおよびそのアルカリ性塩からなる群より選択される、請求項 18 に記載の微粒子。

【請求項 23】

請求項 18 に記載の微粒子を含む医薬組成物。

【請求項 24】

胃酸に関連する疾病の予防または治療用医薬を製造するための、請求項 18 に記載の微粒子の使用。

【請求項 25】

胃酸に関連する病気が、逆流性食道炎、胃炎、十二指腸炎、胃潰瘍または十二指腸潰瘍である、請求項 24 に記載の微粒子の使用。