

【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⁺-ATP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⁺-ATP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⁺-ATP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⁺-ATP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⁺-ATP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、50~500μm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、100~500μm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⁺-ATPアーゼ阻害剤が、オメプラゾール、そのアルカリ性塩、エソメプラゾール、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⁺-ATP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⁺-ATP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 2 0】

微粒子が、50～500μm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 2 1】

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 2 2】

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 2 3】

請求項18に記載の微粒子を含む医薬組成物。

【請求項 2 4】

胃酸に関連する疾病的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 2 5】

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。